

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl.



# [12] 发明专利说明书

专利号 ZL 02818247.2

C07D 231/14 (2006.01)  
C07D 231/40 (2006.01)  
C07D 213/61 (2006.01)  
C07D 213/40 (2006.01)  
A01N 43/56 (2006.01)  
A01N 37/22 (2006.01)

[45] 授权公告日 2007 年 2 月 7 日

[11] 授权公告号 CN 1298706C

[51] Int. Cl. (续)

A01N 37/30 (2006.01)

A01P 5/00 (2006.01)

A01P 7/00 (2006.01)

[22] 申请日 2002.9.17 [21] 申请号 02818247.2

[30] 优先权

[32] 2001. 9. 21 [33] US [31] 60/324,083

[86] 国际申请 PCT/US2002/029468 2002. 9. 17

[87] 国际公布 WO2003/026415 英 2003. 4. 3

[85] 进入国家阶段日期 2004. 3. 18

[73] 专利权人 杜邦公司

地址 美国特拉华

[72] 发明人 乔治·菲利普·拉姆

托马斯·保罗·塞尔比

[56] 参考文献

JP63 - 10777A 1988. 1. 18

US3989840A 1976. 11. 2

FR1491502A 1967. 8. 11

US4004029A 1977. 1. 18

CH373028A 1963. 11. 15

DE1168918B 1964. 4. 30

DE1593957A 1972. 3. 9

US3907892A 1975. 9. 23

审查员 戴年珍

[74] 专利代理机构 永新专利商标代理有限公司

代理人 于 辉

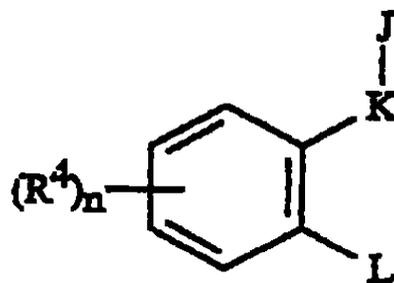
权利要求书 3 页 说明书 245 页

[54] 发明名称

杀虫二酰胺类

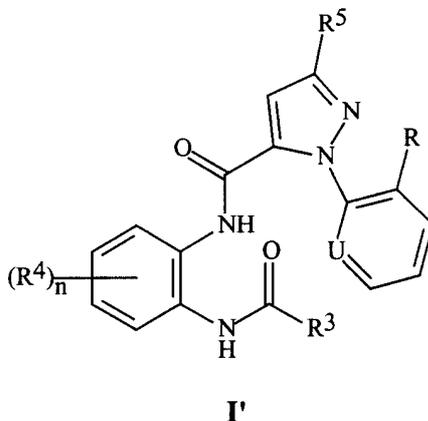
[57] 摘要

本发明涉及一种防治无脊椎害虫的方法，包括用生物有效量的式 I 的化合物(包括所有几何异构体和立体异构体)、其 N - 氧化物或其适用于农业的盐(例如以包括式 I 的化合物的组合物)接触无脊椎害虫或其环境，其中 J 是苯环、萘环系、5 - 或 6 - 元杂芳环或者芳族 8 -、9 - 或 10 - 元稠合杂二环环系，其中每一环或环系取代有 1 - 4 个 R<sup>5</sup>；K 是 -C(=A)NR<sup>2</sup> - 或 -NR<sup>2</sup>C(=A) -；L 是 -NR<sup>1</sup>C(=B) - R<sup>3</sup> 或 -NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub> - R<sup>3</sup>；A 和 B 独立地是 O 或 S；R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> 和 n 的定义如说明书中所述。本发明还公开了一种防治无脊椎害虫的组合物，包括生物有效量的式 I 的化合物、其 N - 氧化物或其适用于农业的盐。本发明还公开了某些式 I 的化合物、其 N - 氧化物或其适用于农业的盐。



I

1、一种式 I' 的化合物，包括其所有立体异构体、其 N-氧化物或其适用于农业的盐



其中

$R^3$  是  $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  烷基氨基或  $C_2$ - $C_4$  二烷基氨基；

每个  $R^4$  各自独立地是 H、 $C_1$ - $C_4$  烷基、卤素或 CN；

$R^5$  是卤素或  $C_1$ - $C_4$  卤烷基；

R 是卤素；

U 是 CH 或 N；并且

n 是 1、2 或 3。

2、一种防治无脊椎害虫的组合物，其包括生物有效量的权利要求 1 的化合物；和至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的其它组分。

3、权利要求 2 的组合物，其还包括有效量的至少一种其它生物活性化合物或试剂。

4、权利要求 3 的组合物，其中至少一种其它生物活性化合物或

试剂选自拟除虫菊酯类、氨基甲酸酯类、新类烟碱类、神经钠通道阻断剂、杀虫的大环内酯、 $\gamma$ -氨基丁酸拮抗剂、杀虫的脲类和保幼激素模拟物。

5、权利要求 2 的组合物，其还包括至少一种选自以下的其它生物活性化合物或试剂：阿维菌素、乙酰甲胺磷、吡虫清、磺胺螨酯、齐墩螨素、艾扎丁、甲基保棉磷、氟氯菊酯、联苯肼酯、噻嗪酮、呋喃丹、氟啉虫清、定虫隆、毒死蜱、甲基毒死蜱、环虫酰肼、噻虫胺、氟氯氰菊酯、 $\beta$ -氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、 $\lambda$ -氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、杀螨硫隆、二嗪农、氟脲杀、乐果、噁茂醚、甲胺基阿维菌素、硫丹、高杀灭菊酯、乙虫清、苯硫威、苯氧威、甲氧菊酯、杀灭菊酯、锐劲特、氟啉虫酰胺、氟氰戊菊酯、 $\tau$ -氟胺氰菊酯、氟虫脲、地虫磷、特丁苯酰肼、氟铃脲、吡虫啉、噁二唑虫、丙胺膦、氟丙氧脲、马拉硫磷、多聚乙醛、甲胺磷、杀扑磷、灭多虫、烯虫酯、甲氧滴滴涕、久效磷、甲氧苯酰肼、硝虫噻嗪、双苯氟脲、甲氧叉威、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、拒嗪酮、啉虫丙醚、蚊蝇醚、鱼藤酮、艾克敌 105、乙丙硫磷、双苯酰肼、伏虫隆、七氟菊酯、特丁硫磷、杀虫畏、噻虫啉、噻虫嗪、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、敌百虫和杀虫隆、涕灭威、克线磷、杀螨脒、灭螨猛、乙酯杀螨醇、三环锡、开乐散、除螨灵、特苯噁唑、啉螨醚、杀螨锡、啉螨酯、噻螨酮、克螨特、啉螨酮、吡螨胺；苏云金杆菌、苏云金杆菌 $\delta$ 毒素、杆状病毒以及食虫细菌、病毒和真菌。

6、权利要求 2 的组合物，其还包括至少一种选自以下的其它生物活性化合物或试剂：氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、氟氯氰菊酯和 $\beta$ -氟氯氰菊酯、高氟戊菊酯、杀灭菊酯、四溴菊酯、苯硫威、灭多虫、甲氧

又威、硫双灭多虫、噻虫胺、吡虫啉、噻虫啉、噁二唑虫、艾克敌105、阿维菌素、齐墩螨素、甲氨基阿维菌素、硫丹、乙虫清、锐劲特、氟虫脲、杀虫隆、噁茂醚、蚊蝇醚、拒嗪酮、虫螨脲、苏云金杆菌、苏云金杆菌 $\delta$ 毒素和食虫真菌。

7、一种用于非治疗目的的防治无脊椎害虫的方法，其包括用生物有效量的权利要求1的化合物接触所述无脊椎害虫或其环境。

## 杀虫二酰胺类

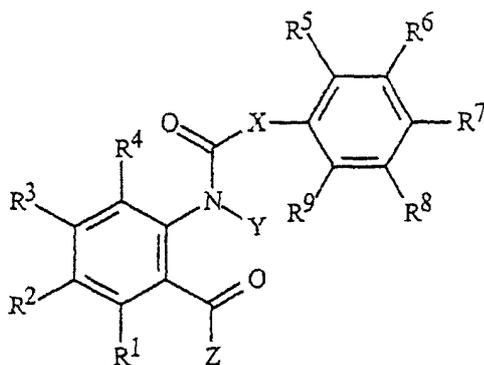
技术领域

本发明涉及某些二酰胺类、它们的 N-氧化物、其适用于农业的盐和组合物，以及它们在农业和非农业环境中防治无脊椎害虫的使用方法。

背景技术

无脊椎害虫（例如节肢动物）的防治在实现高效农业中是非常重要的。无脊椎害虫危害农作物的生长和贮存，会导致农作物严重减产，从而增加消费者的费用。在森林、温室作物、观赏植物、苗圃作物、贮存的食物和纤维产品、家畜、家庭、以及公共与动物保健中，防治无脊椎害虫也是重要的。虽然为此目的已可买到许多产品，但是仍然需要更有效、价廉、低毒、对环境更安全或具有不同作用方式的新化合物。

NL 9202078 公开了用作杀虫剂的式 i 的 N-酰基邻氨基苯甲酸衍生物



i

其中，X 是直接键；

Y 是 H 或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基;

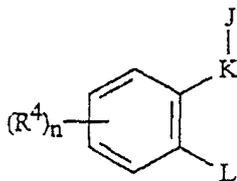
Z 是 NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基)或 N(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基)<sub>2</sub>; 和

R<sup>1</sup>-R<sup>9</sup> 独立地是 H、卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、苯基、羟基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub> 酰氧基。

美国专利 US 3, 907, 892 公开了某些 N-氟烷酰基-邻-苯二胺类作为杀虫剂。

### 发明概述

本发明涉及式 I 的化合物(包括所有几何异构体和立体异构体)、及其 N-氧化物和其适用于农业的盐



I

其中

J 是苯环、萘环系、5-或 6-元杂芳环或者芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系，其中每一环或环系任选取代有 1-4 个 R<sup>5</sup>;

K 是 -C(=A)NR<sup>2</sup>-或 -NR<sup>2</sup>C(=A)-;

L 是 -NR<sup>1</sup>C(=B)-R<sup>3</sup> 或 -NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>-R<sup>3</sup>;

A 和 B 独立地是 O 或 S;

R<sup>1</sup> 是 H; 或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链炔基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基，每一个任选取代有一个或多个选自如下的取代基：卤素、CN、NO<sub>2</sub>、羟基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基和 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基氨基；或者

R<sup>1</sup> 是 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基氨基羰基或

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基羰基；

R<sup>2</sup> 是 H、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基；

R<sup>3</sup> 是 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链炔基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基，每一个任选取代有一个或多个选自如下的取代基：卤素、CN、NO<sub>2</sub>、羟基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基磺酰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 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-元杂芳环任选取代有 1-3 个独立地选自如下的取代基：R<sup>6</sup>；C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基；C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基氨基；C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基；C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)氨基；C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基氨基；C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基；或者

R<sup>1</sup> 和 R<sup>3</sup> 可以与 -NC(=B)-或 -NSO<sub>2</sub>-部分在一起，它们相连形成一个包括 2-6 个碳原子并任选还包括一个氮、硫或氧原子的环，所述环任选取代有 1-4 个选自如下的取代基：C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷基、卤素、CN、NO<sub>2</sub> 和 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷氧基；

每个 R<sup>4</sup> 独立地是 H、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤链炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 卤环烷基、卤素、CN、NO<sub>2</sub>、羟基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 三烷基甲硅烷基，或者任选取代有 1-3 个独立地选自 R<sup>6</sup> 的取代基的苯环；

每个 R<sup>5</sup> 独立地是 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 链炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 卤烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 卤链炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 卤环烷基、卤素、CN、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、羟基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

卤烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 三烷基甲硅烷基；或者

每个 R<sup>5</sup> 独立地是苯基、苄基、苯甲酰基、苯氧基、5-或 6-元杂芳环或者芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系，每个苯基、苄基、苯甲酰基、苯氧基、杂芳环和芳族稠合杂二环环系任选取代有 1-3 个独立地选自 R<sup>6</sup> 的取代基；或者

两个 R<sup>5</sup> 基团与相邻碳原子相连时可以在一起为 -OCF<sub>2</sub>O-、-CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-或-OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-；

每个 R<sup>6</sup> 独立地是 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 链炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 卤链烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 卤链炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 卤环烷基、卤素、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 卤烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基亚磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 环烷基氨基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>(烷基)环烷基氨基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烷基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烷基氨基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> 二烷基氨基羰基或 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 三烷基甲硅烷基；和

n 是 1、2、3 或 4；条件是 L 不是 -NHC(=O)-，并且 R<sup>3</sup> 不是取代有一个或多个氟部分的 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基。

本发明还提供了一种防治无脊椎害虫的方法，包括用生物有效量的式 I 的化合物、其 N-氧化物或其适用于农业的盐(例如以本文所述的组合物)接触无脊椎害虫或其环境。

本发明还提供了一种防治无脊椎害虫的组合物，包括生物有效量的式 I 的化合物、其 N-氧化物或其适用于农业的盐；和至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的其它组分。

本发明还提供了一种组合物，包括生物有效量的式 I 的化合物、

其 N-氧化物或其适用于农业的盐；和有效量的至少一种其它生物活性化合物或试剂。

本发明还提供了式 I 的化合物(包括所有几何异构体和立体异构体)、其 N-氧化物或其适用于农业的盐，其中每个  $R^5$  是  $R^{5a}$  或  $R^{5b}$ ；

J 是苯环、萘环系、5-或 6-元杂芳环或者芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系，其中每一环或环系取代有一个  $R^{5a}$  并任选取代有 1-3 个  $R^{5b}$ ；

K 是  $-C(=A)NR^2-$  或  $-NR^2C(=A)-$ ；

L 是  $-NR^1C(=B)-R^3$  或  $-NR^1SO_2-R^3$ ；

A 和 B 独立地是 O 或 S；

$R^1$  是 H 或  $C_1-C_4$  烷基；

$R^2$  是 H 或  $C_1-C_4$  烷基；

$R^3$  是任选取代有卤素、CN、 $OCH_3$  或  $S(O)_pCH_3$  的  $C_1-C_4$  烷基；

$R^{5a}$  和  $R^{5b}$  各自独立地是  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤烷基、卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1-C_4$  烷氧基、 $C_1-C_4$  卤烷氧基、 $C_1-C_4$  烷硫基、 $C_1-C_4$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  卤烷硫基、 $C_1-C_4$  卤烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  卤烷基磺酰基、 $C_2-C_4$  烷氧基羰基或  $C_3-C_8$  二烷基氨基羰基；或苯基、苄基或者 5-或 6-元杂芳环，每个苯基、苄基和杂芳环任选取代有 1-3 个独立地选自  $R^6$  的取代基；

$R^{5a}$  在与 K 相邻的位置与 J 相连；每个  $R^6$  独立地是卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_2-C_4$  链烯基、 $C_2-C_4$  链炔基、 $C_3-C_6$  环烷基、 $C_1-C_4$  卤烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基或  $C_1-C_4$  卤烷氧基；和

p 是 0、1 或 2；条件是 L 不是  $-NHC(=O)-$  和  $R^3$  不是取代有一个或多个氟部分的  $C_1-C_6$  烷基。

### 发明详述

在上面的陈述中，术语“烷基”既可以单独使用，也可以在组合

词中使用，如“烷基”或“卤烷基”中使用，它包括直链或支链烷基，如甲基、乙基、正丙基、异丙基、或者不同的丁基、戊基或己基异构体。“链烯基”包括直链或支链链烯基，如1-丙烯基、2-丙烯基、以及不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。“链烯基”也包括多烯，如1,2-丙二烯基和2,4-己二烯基。“链炔基”包括直链或支链炔基，如1-丙炔基、2-丙炔基以及不同的丁炔基、戊炔基和己炔基异构体。

“链炔基”也可以包括含有多个三键的基团，如2,5-己二炔基。“烷氧基”包括，例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基以及不同的丁氧基、戊氧基和己氧基异构体。“烷氧基烷基”是指在烷基上取代有烷氧基。“烷氧基烷基”的实例包括  $\text{CH}_3\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$  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，例如甲硫基、乙硫基以及不同的丙硫基、丁硫基、戊硫基和己硫基异构体。“环烷基”包括，例如，环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

术语“杂环环”或“杂环环系”是指是指这样一种环或环系，其中至少一个环原子不是碳并且包括1-4个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，条件是每个杂环环含有不超过4个氮、不超过2个氧和不超过2个硫。所述杂环环可以通过任何可以利用的碳或氮将所述碳或氮上的氢替换相连。术语“芳环系”是指完全不饱和碳环和杂环，其中所述多环系是芳族的(其中芳族是指该环系满足 Hückel 规则)。术语“杂芳环”是指完全芳族的环，其中至少一个环原子不是碳并且包括1-4个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，条件是每个杂环环含有不超过4个氮、不超过2个氧和不超过2个硫(其中芳族是指满足 Hückel 规则)。所述杂环环可以通过任何可以利用的碳或氮将所述碳或氮上的氢替换相连。术语“芳族杂环环系”包括完全芳族的杂环，其中多环系中至少一个环是芳族的(其中芳族是指满足 Hückel 规则)。术语“稠合的杂二环环系”包括由两个稠合环组成的环系，其中至少一个环原子不

是碳并且可以是如上面定义的芳族或非芳族的。

术语“卤素”，可以是单独的或在组合词如“卤烷基”中，包括氟、氯、溴或碘。而且，在组合词如“卤烷基”中使用时，所述烷基可以用卤原子部分或完全地取代，所述卤原子可以相同或不同。“卤烷基”的实例包括  $F_3C$ 、 $ClCH_2$ 、 $CF_3CH_2$  和  $CF_3CCl_2$ 。术语“卤链烯基”、“卤链炔基”、“卤烷氧基”等，定义与术语“卤烷基”类似。“卤链烯基”的实例包括  $(Cl)_2C=CHCH_2$  和  $CF_3CH_2CH=CHCH_2$ 。“卤链炔基”的实例包括  $HC\equiv CCHCl$ 、 $CF_3C\equiv C$ 、 $CCl_3C\equiv C$  和  $FCH_2C\equiv CCH_2$ 。

“卤烷氧基”的实例包括  $CF_3O$ 、 $CCl_3CH_2O$ 、 $HCF_2CH_2CH_2O$  和  $CF_3CH_2O$ 。

取代基中的碳原子总数通过“ $C_i-C_j$ ”前缀来表示，其中  $i$  和  $j$  是 1-8 的数字。例如， $C_1-C_3$  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  $CH_3OCH_2$ ； $C_3$  烷氧基烷基例如表示  $CH_3CH(OCH_3)$ 、 $CH_3OCH_2CH_2$  或  $CH_3CH_2OCH_2$ ； $C_4$  烷氧基烷基表示总共含有 4 个碳原子的烷氧基取代的烷基的不同异构体，实例包括  $CH_3CH_2CH_2OCH_2$  和  $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ 。在上述说明中，当式 I 的化合物含有一个杂环环时，所有取代基都通过取代任何可得到的碳或氮上的氢，经所述碳或氮连接于这些环上。

当一基团含有一取代基(可以是氢)，例如  $R^3$ ，那么当该取代基为氢时，应认为这相当于所述基团未取代。

本发明的化合物可以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异构体含量更多或当从其它异构体分离出来的时候，该立体异构体可以显示更高的活性和/或可以呈现有益的效果。另外，本领域技术人员也知道如何分离、富集和/或选择性地制备所述的立体异构体。因此，本发明的这些化合物可以立体异构体的混合物、单个立体异构体、或以一种光学活性形式

存在。

本发明包括选自以下的化合物：式 I、其 N-氧化物及其适用于农业的盐。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，因为要氧化成氧化物，氮需要有一对可以利用的孤对电子；本领域技术人员知道，哪些含氮杂环可以形成 N-氧化物。本领域技术人员也知道，叔胺可以形成 N-氧化物。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（如过氧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）和二环氧乙烷类（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深入描述或综述，参见文献举例如下：T.L. Gilchrist 的“*Comprehensive Organic Synthesis*”，第 7 卷，第 748-750 页，S.V. Ley 编辑，Pergamon 出版社；M. Tisler 和 B. Stanovnik 的“*Comprehensive Heterocyclic Chemistry*”，第 3 卷，第 18-19 页，A.J. Boulton 和 A. McKillop 编辑，Pergamon 出版社；M.R. Grimmett 和 B.R. T. Keene 的“*Advances in Heterocyclic Chemistry*”，第 43 卷，第 139-151 页，A.R. Katritzky 编辑，Academic 出版社；M. Tisler 和 B. Stanovnik 的“*Advances in Heterocyclic Chemistry*”，第 9 卷，第 285-291 页，A.R. Katritzky 和 A.J. Boulton 编辑，Academic 出版社；和 G.W.H. Cheeseman 和 E.S.G. Werstiuk 的“*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，所述酸例如有氢溴酸、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。

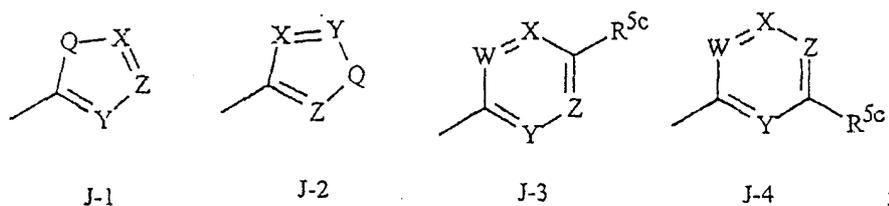
为了获得更高的活性和/或容易合成，优选的方法是：

优选 1. 包括式 I 的化合物的方法，其中 K 是  $-C(=A)NR^2-$ ，并且 A 和 B 都是 O。

优选 2. 包括式 I 的化合物的方法, 其中 K 是  $\text{NR}^2\text{C}(=\text{A})-$ , 并且 A 和 B 都是 O。

优选 3. 优选 1 或优选 2 的方法, 其中

J 是苯环或者 5-或 6-元杂芳环, 该杂芳环选自基团 J-1、J-2、J-3 和 J-4, 每个 J 环任选取代有 1-3 个  $\text{R}^5$



Q 是 O、S 或  $\text{NR}^{5c}$ ;

W、X、Y 和 Z 独立地是 N 或  $\text{CR}^{5c}$ , 条件是在 J-3 和 J-4 中 W、X、Y 或 Z 中至少一个是 N;

$\text{R}^1$  和  $\text{R}^2$  各自独立地是 H、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$  链烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$  链炔基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$  环烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$  烷基羰基或  $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$  烷氧基羰基;

$\text{R}^3$  是  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$  烷基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$  链烯基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$  链炔基或  $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$  环烷基, 它们各自任选取代有一个或多个选自如下的取代基: 卤素、CN、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$  烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$  烷硫基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$  烷基亚磺酰基和  $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$  烷基磺酰基;

每个  $\text{R}^4$  独立地是  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷基、卤素、CN、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷硫基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷基亚磺酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷基磺酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷硫基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷基亚磺酰基或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷基磺酰基;

每个  $\text{R}^5$  独立地是  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷基、卤素、CN、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷硫基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷基亚磺酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  烷基磺酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷硫基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷基亚磺酰基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  卤烷基磺酰基、 $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$  烷氧基羰基或  $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$  二烷基氨基羰基; 或

每个  $\text{R}^5$  独立地是苯基、苄基或者 5-或 6-元杂芳环, 每个环任选取代有 1-3 个独立地选自  $\text{R}^6$  的取代基; 或者

两个  $R^5$  基团与相邻碳原子相连时可以在一起为  $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ 或 $-OCF_2CF_2O-$ ;

$R^{5c}$  是 H 或  $R^5$ ;

每个  $R^6$  独立地是  $C_1-C_4$  烷基、 $C_2-C_4$  链烯基、 $C_2-C_4$  链炔基、 $C_3-C_6$  环烷基、 $C_1-C_4$  卤烷基、 $C_2-C_4$  卤链烯基、 $C_2-C_4$  卤链炔基、 $C_3-C_6$  卤环烷基、卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1-C_4$  烷氧基、 $C_1-C_4$  卤烷氧基、 $C_1-C_4$  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; 和

$n$  是 1 或 2。

优选 4. 优选 3 的方法, 其中

每个  $R^5$  是  $R^{5a}$  或  $R^{5b}$ ;

$J$  取代有  $R^{5a}$  并任选取代有 1-2 个  $R^{5b}$ ;

$R^1$  和  $R^2$  各自独立地是 H 或  $C_1-C_4$  烷基;

$R^3$  是任选取代有卤素、CN、 $OCH_3$  或  $S(O)_pCH_3$  的  $C_1-C_4$  烷基;

$R^{5a}$  基团在与  $K$  相邻的位置与  $J$  相连;

$R^{5a}$  和  $R^{5b}$  各自独立地是  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  卤烷基、卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1-C_4$  烷氧基、 $C_1-C_4$  卤烷氧基、 $C_1-C_4$  烷硫基、 $C_1-C_4$  烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  烷基磺酰基、 $C_1-C_4$  卤烷硫基、 $C_1-C_4$  卤烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$  卤烷基磺酰基、 $C_2-C_4$  烷氧基羰基或  $C_3-C_8$  二烷基氨基羰基; 或苯基、苄基或者 5-或 6-元杂芳环, 每个环任选取代有 1-3 个独立地选自  $R^6$  的取代基;

每个  $R^6$  独立地是卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_2-C_4$  链烯基、 $C_2-C_4$  链炔基、 $C_3-C_6$  环烷基、 $C_1-C_4$  卤烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基或  $C_1-C_4$  卤烷氧基; 和

p 是 0、1 或 2。

优选 5. 优选 4 的方法，其中 J 是苯基、吡唑、吡咯、吡啶或噻啶。

优选 6. 优选 5 的方法，其中

$R^1$  和  $R^2$  各自是 H；

一个  $R^4$  选自如下基团： $C_1$ - $C_3$  烷基、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$  和 卤素，并且任选的第二个  $R^4$  选自如下基团：卤素、 $C_1$ - $C_3$  烷基和  $C_1$ - $C_3$  卤烷基。

优选 7. 优选 6 的方法，其中

J 是 J-1；

Q 是  $NR^{5a}$ ；

X 是 N 或 CH；

Y 是 CH；

Z 是  $CR^{5b}$ ；

$R^{5a}$  是苯基或 2-吡啶基环，它们取代有一个或者两个选自如下基团的取代基：卤素、 $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷基或  $C_1$ - $C_4$  卤烷氧基；和  $R^{5b}$  是卤素或  $CF_3$ 。

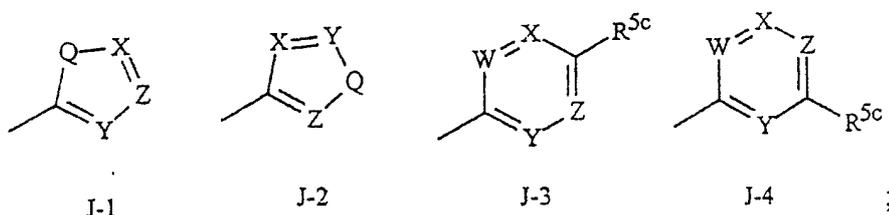
本发明的方法包括这样的实施方式，它包括用生物有效量的包含式 I 的化合物、其 N-氧化物或其适用于农业的盐以及生物有效量的至少一种防治无脊椎害虫的其它化合物或试剂的组合物接触无脊椎害虫或其环境，以防治无脊椎害虫。

本发明还涉及一种防治无脊椎害虫的组合物，其包括生物有效量的式 I 的化合物、其 N-氧化物或其适用于农业的盐以及表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂中的至少一种。本发明的优选组合物是包含上面优选方法的化合物的那些。

本发明还涉及上面定义的一些式 I 的化合物，包括其所有几何异构体和立体异构体、其 N-氧化物或其适用于农业的盐。为了获得更高的活性和/或容易合成，本发明的优选化合物是：

优选 A. 式 I 的化合物，其中

J 是苯环或者 5-或 6-元杂芳环，该杂芳环选自基团 J-1、J-2、J-3 和 J-4，每个 J 环取代有  $R^{5a}$  并任选取代有 1-2 个  $R^{5b}$



Q 是 O、S 或  $NR^{5c}$ ；

W、X、Y 和 Z 独立地是 N 或  $CR^{5c}$ ，条件是在 J-3 和 J-4 中 W、X、Y 或 Z 中至少一个是 N；

$R^1$  和  $R^2$  各自独立地是 H 或  $C_1$ - $C_4$  烷基；

$R^3$  是  $C_1$ - $C_4$  烷基，它任选取代有卤素、CN、 $OCH_3$  或  $S(O)_pCH_3$ ；

每个  $R^4$  独立地是  $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷基、卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1$ - $C_4$  烷氧基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷氧基、 $C_1$ - $C_4$  烷硫基、 $C_1$ - $C_4$  烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷硫基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷基亚磺酰基或  $C_1$ - $C_4$  卤烷基磺酰基；

$R^{5a}$  在与 K 相邻的位置与 J 相连；

$R^{5a}$  和  $R^{5b}$  各自独立地是  $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷基、卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1$ - $C_4$  烷氧基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷氧基、 $C_1$ - $C_4$  烷硫基、 $C_1$ - $C_4$  烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷硫基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷基磺酰基、 $C_2$ - $C_4$  烷氧基羰基或  $C_3$ - $C_8$  二烷基氨基羰基；或苯基、苄基或者 5-或 6-元杂芳环，每个环任选取代有 1-3 个独立地选自  $R^6$  的取代基；

$R^{5c}$  是 H 或  $R^{5a}$ ;

每个  $R^6$  独立地是卤素、CN、 $NO_2$ 、 $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_2$ - $C_4$  链烯基、 $C_2$ - $C_4$  链炔基、 $C_3$ - $C_6$  环烷基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷基、 $C_1$ - $C_4$  烷氧基或  $C_1$ - $C_4$  卤烷氧基;

n 是 1 或 2; 和

p 是 0、1 或 2。

优选 B. 优选 A 的化合物, 其中 J 是苯基、吡唑、吡咯、吡啶或嘧啶。

优选 C. 优选 B 的化合物, 其中

$R^1$  和  $R^2$  各自是 H;

一个  $R^4$  选自如下基团:  $C_1$ - $C_3$  烷基、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$  和卤素, 并且任选的第二个  $R^4$  选自如下基团: 卤素、 $C_1$ - $C_3$  烷基和  $C_1$ - $C_3$  卤烷基。

优选 D. 优选 C 的化合物, 其中

J 是 J-1;

Q 是  $NR^{5a}$ ;

X 是 N 或 CH;

Y 是 CH;

Z 是  $CR^{5b}$ ;

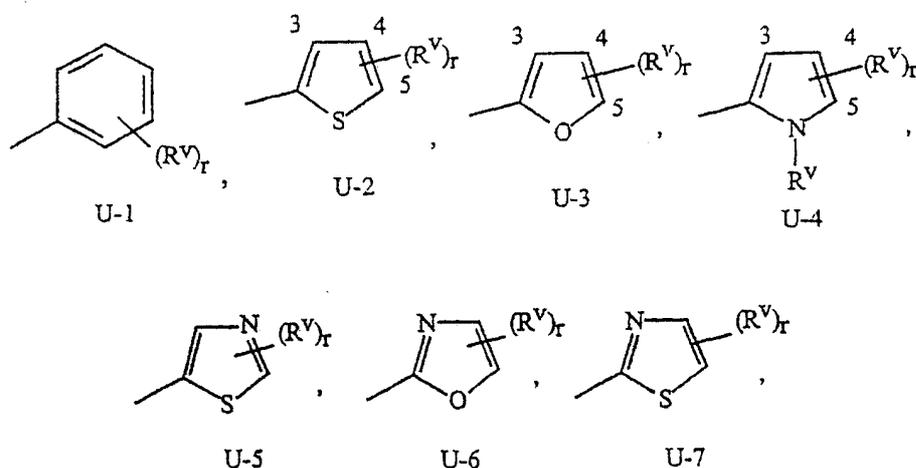
$R^{5a}$  是苯基或 2-吡啶基环, 它们取代有一个或者两个选自如下基团的取代基: 卤素、 $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  卤烷基或  $C_1$ - $C_4$  卤烷氧基; 和  $R^{5b}$  是卤素或  $CF_3$ 。

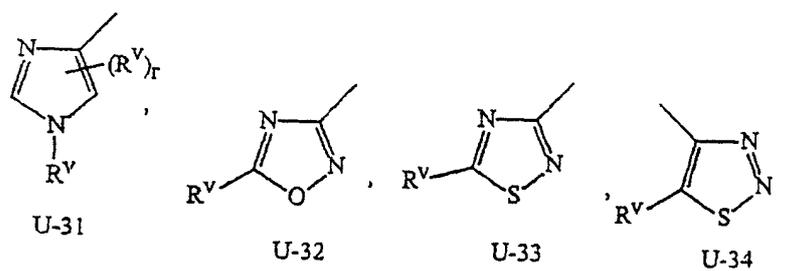
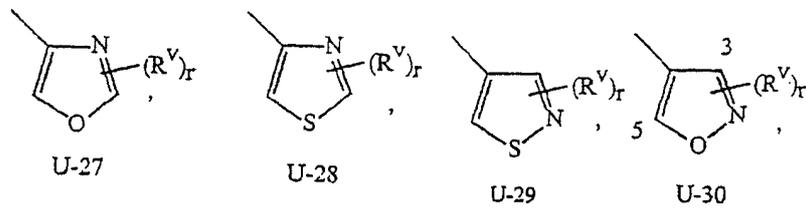
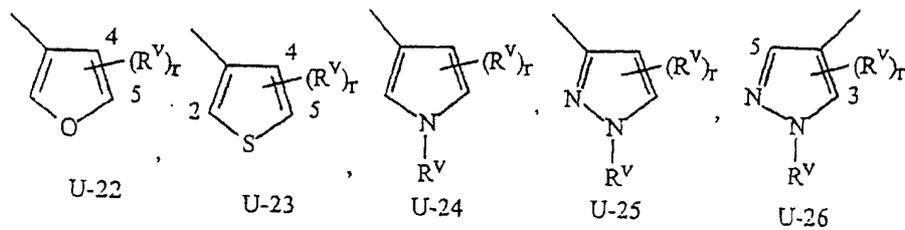
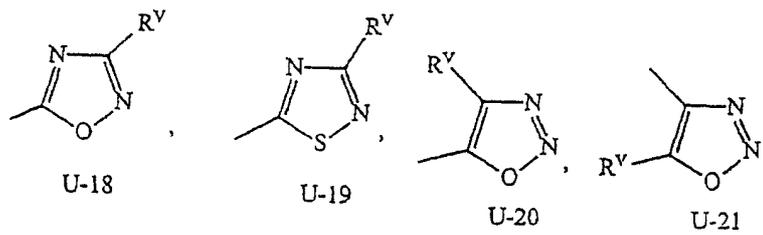
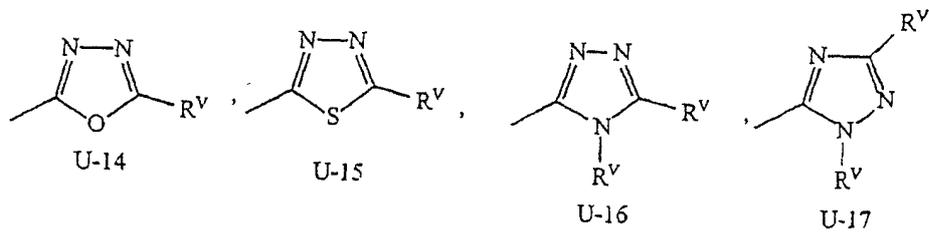
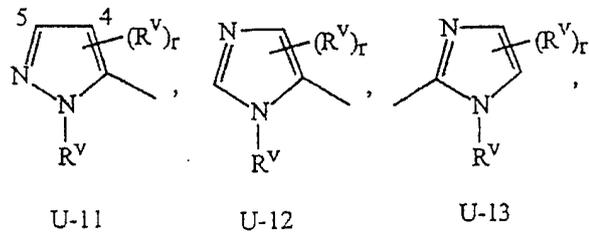
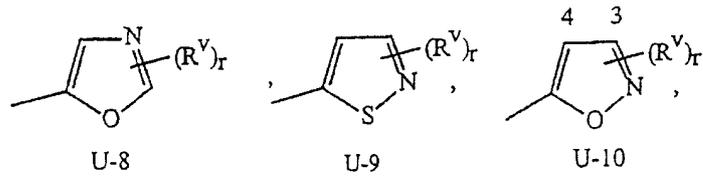
如上所述, J 是苯环、萘环系、5-或 6-元杂芳环或者芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系, 其中每一环或环系任选取代有 1-4 个  $R^5$ 。与这些 J 基团有关的术语“任选取代的”是指未取代或者具有至少一个非氢取代基的基团, 所述取代基不使未取代的类似物所具有的防止无脊椎害虫活性消失。任选取代有 1-4 个  $R^5$  的苯基的实例是显示 1

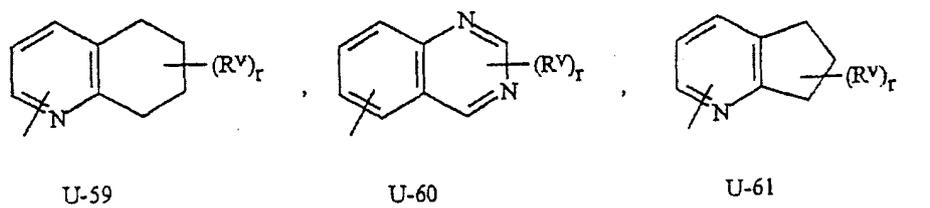
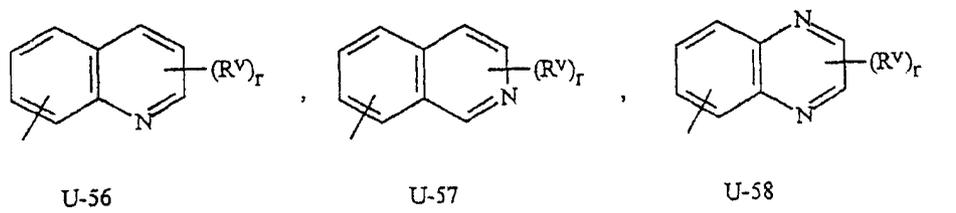
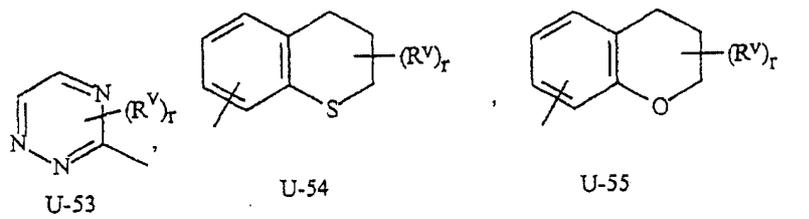
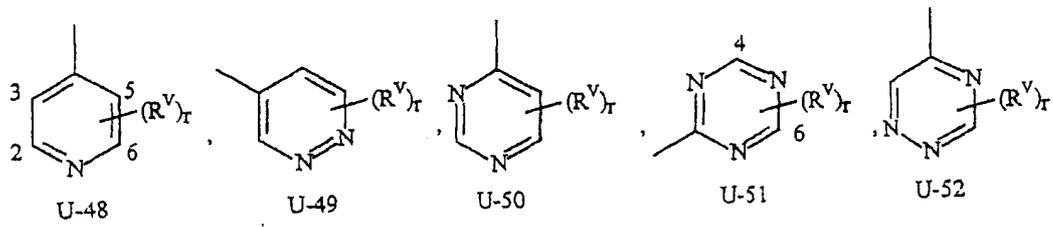
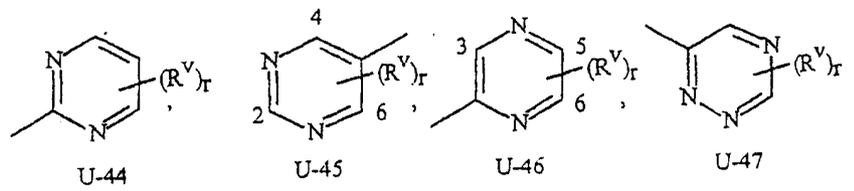
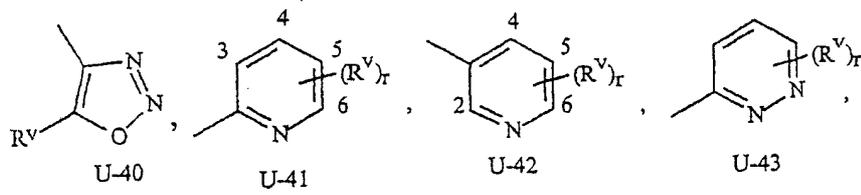
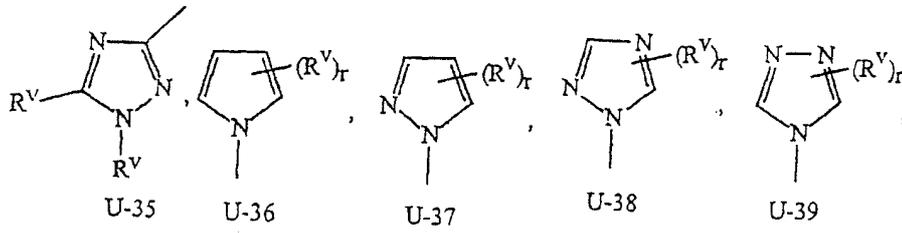
中如 U-1 所示的环，其中  $R^v$  是  $R^5$  或 H， $r$  是 1-4 的整数。任选取代有 1-4 个  $R^5$  的萘基的实例如显示 1 中的 U-85 所述，其中  $R^v$  是  $R^5$  或 H， $r$  是 1-4 的整数。任选取代有 1-4 个  $R^5$  的 5-或 6-元杂芳环的实例包括显示 1 中所示的 U-2 至 U-53，其中  $R^v$  是  $R^5$  或 H， $r$  是 1-4 的整数。注意上面的 J-1 至 J-4 也代表 5-或 6-元杂芳环。注意 U-2 至 U-20 是 J-1 的实例，U-21 至 U-35 和 U-40 是 J-2 的实例，U-41 至 U-48 是 J-3 的实例，U-49 至 U-53 是 J-4 的实例。任选取代有 1-4 个  $R^5$  的芳族的 8-、9-或 10-元稠合的杂二环环系的实例包括显示 1 中所述的 U-54 至 U-84，其中  $R^v$  是  $R^5$  或 H， $r$  是 1-4 的整数。

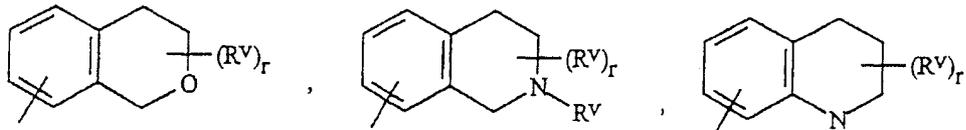
尽管在结构 U-1 至 U-85 显示存在有  $R^v$  基团，但是应注意的是它们可以是 H，这相当于  $R^5$  任选不存在。注意当  $R^v$  是与一原子相连的 H 时，这与该原子未被取代相同。需要取代以填充其化合价的这些氮原子取代有 H 或  $R^v$ 。注意一些 U 基团仅可被少于 4 个  $R^v$  基团取代(例如 U-14、U-15、U-18 至 U-21 和 U-32 至 U-34 仅可被一个  $R^v$  取代)。注意当  $(R^v)_r$  和 U 基团之间的连接点描述为浮动的时候， $(R^v)_r$  可以与 U 基团上的任何可以利用的碳原子相连。注意当 U 基团上的连接点描述为浮动的时候，U 基团可以通过取代氢原子与式 I 的剩余部分经 U 基团的任何可以利用的碳原子相连。

显示 1





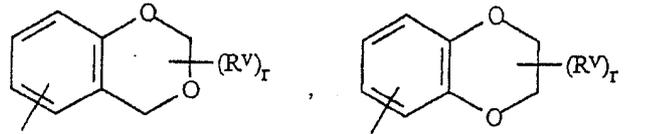




U-62

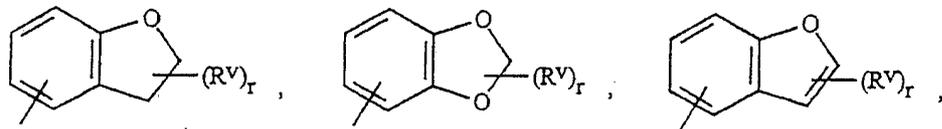
U-63

U-64



U-65

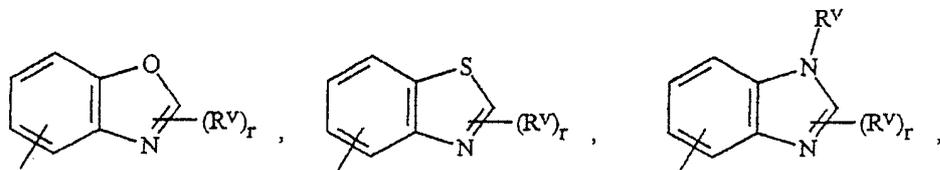
U-66



U-67

U-68

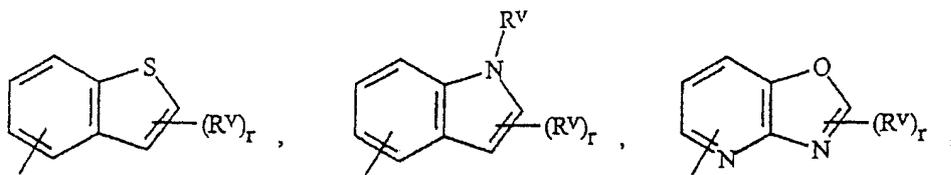
U-69



U-70

U-71

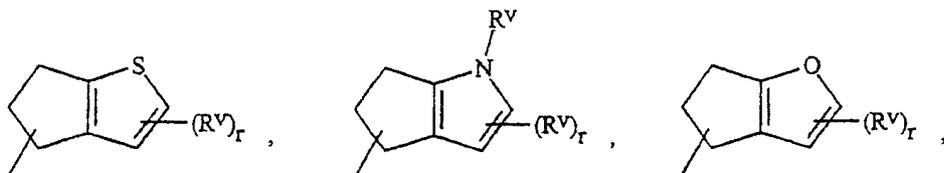
U-72



U-73

U-74

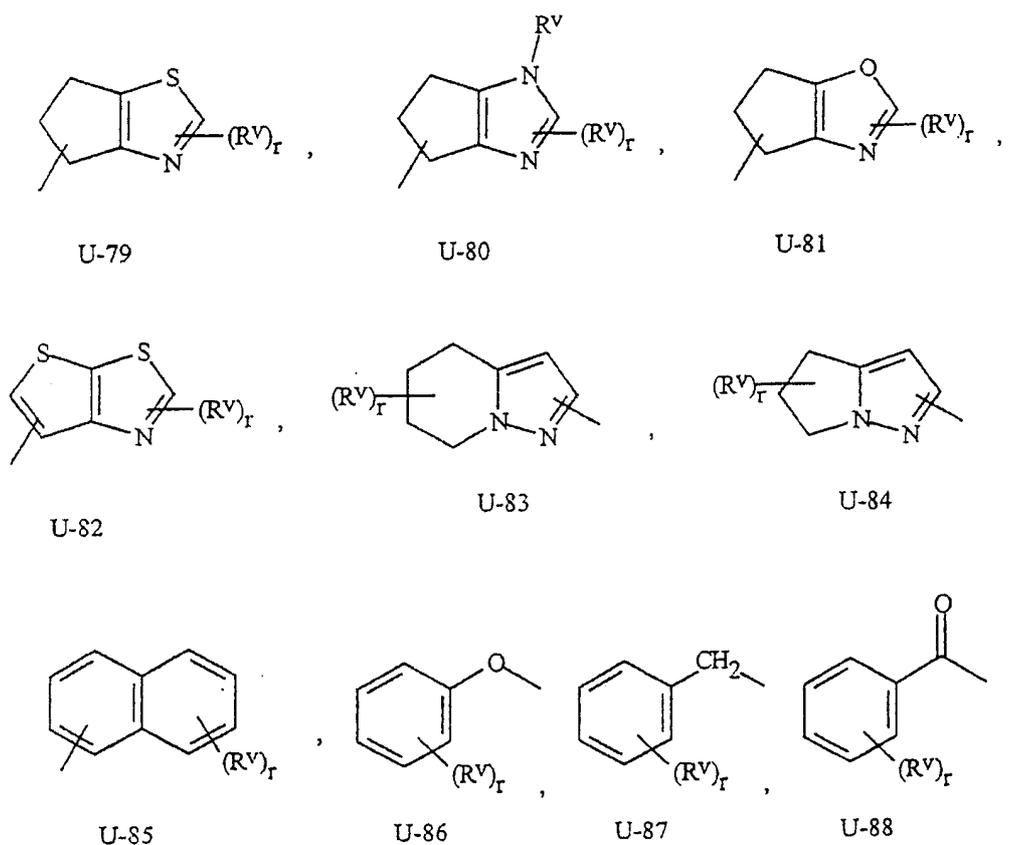
U-75



U-76

U-77

U-78



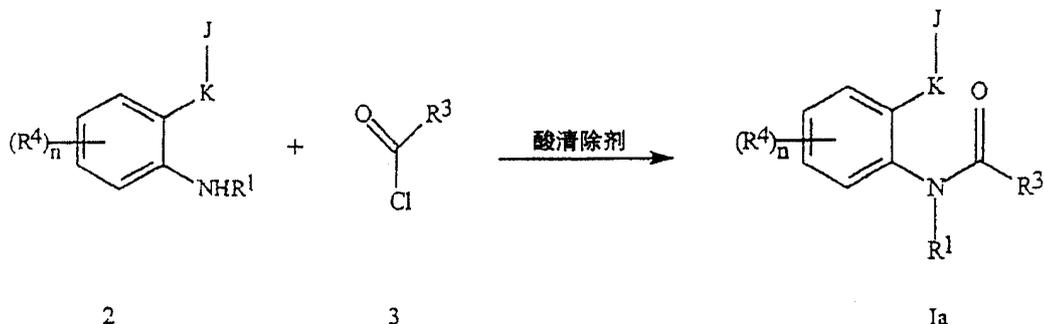
如上所述,  $R^3$  可以(尤其是)是  $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_6$  链烯基、 $C_2$ - $C_6$  链炔基、 $C_3$ - $C_6$  环烷基, 每一个任选取代有一个或多个选自如下的取代基: 苯环、苯氧基或者 5-或 6-元杂芳环, 每个环任选取代有 1-3 个独立地选自  $R^6$  的取代基;  $C_1$ - $C_4$  烷氧基;  $C_1$ - $C_4$  烷基氨基;  $C_2$ - $C_8$  二烷基氨基;  $C_1$ - $C_4$  烷氧基( $C_1$ - $C_4$  烷基)氨基;  $C_3$ - $C_6$  环烷基氨基;  $C_2$ - $C_6$  烷氧基羰基或  $C_2$ - $C_6$  烷基羰基。 $R^3$  的取代环的实例包括如显示 1 中所述的 U-1 至 U-53 和 U-86 所述的环, 不过这些环任选取代有 1-3 个独立地选自  $R^6$ (不包括  $R^V$ )的取代基。

如上所述, 每个  $R^5$  可以独立地(尤其是)是苯基、苄基、苯甲酰基、苯氧基、5-或 6-元杂芳环或者芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系, 每个环任选取代有 1-3 个独立地选自  $R^6$  的取代基。这些  $R^5$  基团的实例包括如显示 1 中 U-1 至 U-88 所述的环或环系, 不过这些环任选取代有 1-3 个独立地选自  $R^6$ (不包括  $R^V$ )的取代基。

式 I 的化合物可以用如下反应式 1-34 中所述的一种或多种方法和改进方法制备。在下式 I 和式 2-57 的化合物中,  $R^1$ - $R^6$ 、J、K、L 和 n 的定义如同本发明上面的概述中的定义, 式 Ia-Ie、2a、5a-e、13a-e 和 49a-b 的化合物分别是式 I、2、5、13 和 49 的化合物的不同亚类。

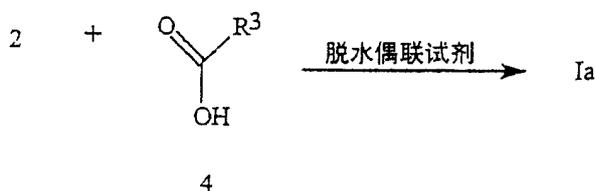
式 Ia 的化合物可以在有酸清除剂的情况下, 将式 2 的胺与式 3 的酰基氯偶联制得, 如反应式 1 所示。典型的酸清除剂包括胺碱类, 例如三乙胺、*N,N*-二异丙基乙胺和吡啶; 其它清除剂包括氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾以及碳酸盐如碳酸钠和碳酸钾。在某些情况下, 也可以采用聚合物载酸清除剂, 如结合在聚合物上的 *N,N*-二异丙基乙胺和结合在聚合物上的 4-(二甲基)氨基吡啶。所述偶联作用可以在合适的惰性溶剂如四氢呋喃、二噁烷、二乙醚或二氯甲烷中进行以得到式 Ia 的酰苯胺。

反应式 1



如反应式 2 所述, 制备式 Ia 的化合物的另一方法包括在脱水剂如 1, 3-二环己基碳二亚胺(DCC)存在下, 将式 2 的胺与式 4 的酸偶联。这里也可以采用聚合物载试剂, 例如结合在聚合物上的 1, 3-二环己基碳二亚胺。反应式 1 和 2 的合成方法是用于制备式 I 化合物的方法的代表性实例, 关于这类反应的合成文献很多。

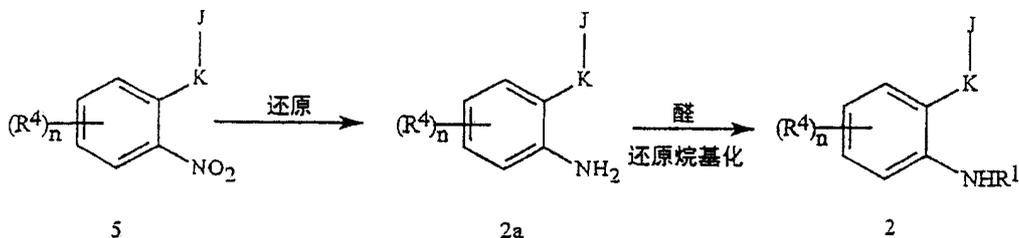
## 反应式 2



本领域技术人员还会知道,可通过多种熟知的方法由式 4 的酸制成式 3 的酰基氯。例如,在惰性溶剂如甲苯或二氯甲烷中在有催化量的 *N,N*-二甲基甲酰胺的情况下将羧酸 4 与亚硫酸氯反应可以容易地由式 4 的羧酸制备式 3 的酰基氯。

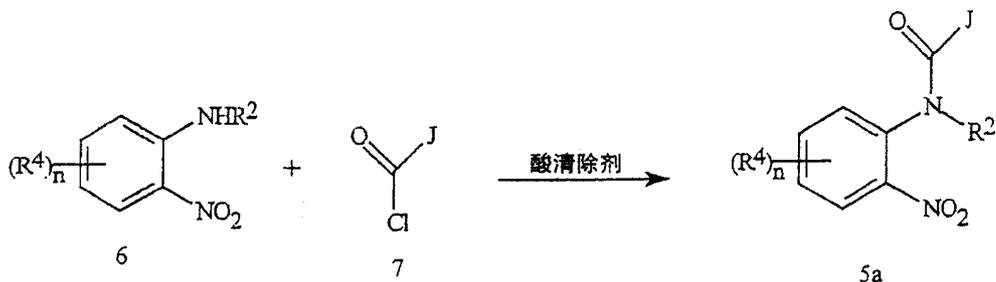
式 2a 的胺通常可以由式 5 的相应的硝基化合物经如反应式 3 所示的硝基催化氢化反应获得。典型的步骤包括在存在金属催化剂(如 Pd/C 或氧化铂)的情况下并在羟基溶剂如乙醇和异丙醇中用氢还原。它们也可以在乙酸中用锌还原制得。这些步骤充分地公开在化学文献中。在这一阶段通常可以通过通常优选的将该胺还原烷基化的方法引入  $R^1$  取代基,例如烷基、取代的烷基等。常用步骤是在有还原剂如氰基硼氢化钠的情况下将苯胺 2a 与醛混合制得式 2 化合物,其中  $R^1$  是烷基、链烯基、链炔基或其取代的衍生物。

## 反应式 3



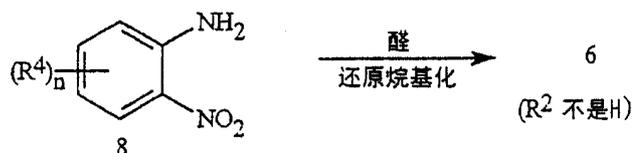
如反应式 4 所述,将式 6 的胺与式 7 的酰基氯通过与反应式 1 所述的类似方法反应可以制得式 5a 的硝基苯。

## 反应式 4



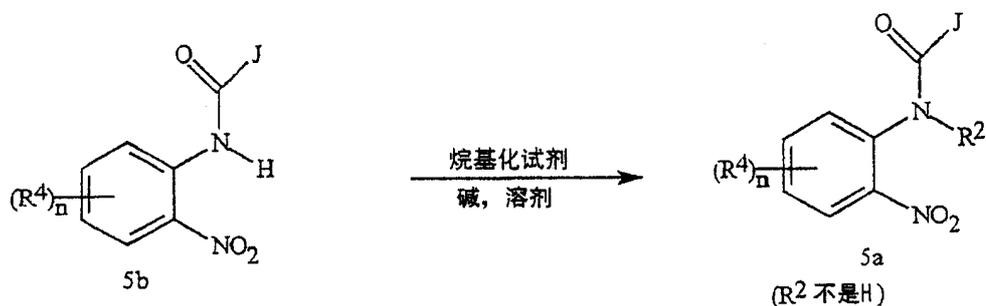
如反应式 5 所述, 式 6 的胺(其中  $\text{R}^2$  不是 H)可以通过将式 8 的伯胺经与反应式 3 中所述的类似方法还原烷基化制得。

## 反应式 5



反应式 6 显示了式 5b 的化合物可以在有碱(如氢氧化钠或正丁基锂)的情况下在惰性溶剂如四氢呋喃或 *N,N*-二甲基甲酰胺(DMF)中用合适的烷基化试剂烷基化, 从而得到式 5a 的酰苯胺, 其中  $\text{R}^2$  不是氢。该步骤特别适用于制备  $\text{R}^2$  是烷基、链烯基或链炔基的式 5a 化合物。

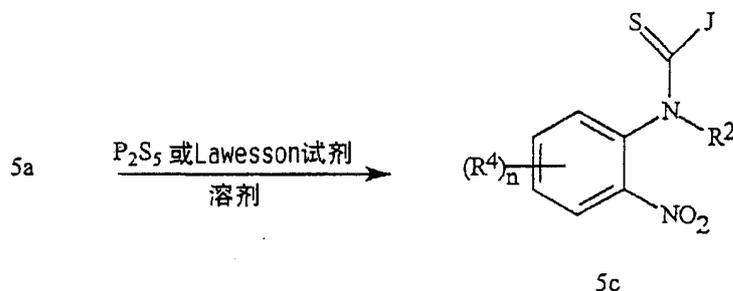
## 反应式 6



反应式 7 概括了式 5c 的硫代酰苯胺的制备方法。式 5a 的酰苯胺(其中  $\text{R}^2$  是 H、烷基等)与五硫化磷或 Lawesson 试剂(即 2, 4-二(4-甲氧基苯基)-1, 3-二硫代-2, 4-diphosphetane-2, 4-二硫化物)在合适的

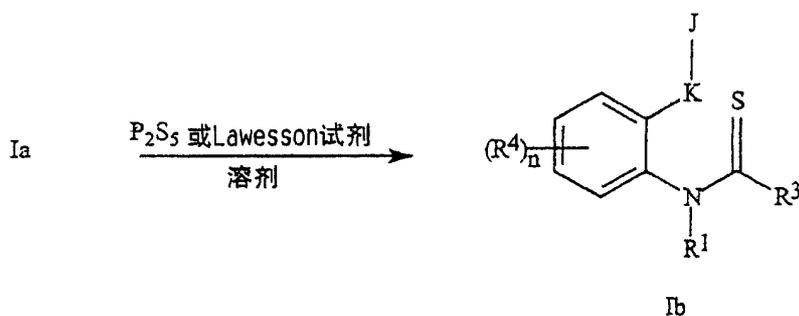
溶剂如吡啶中于室温或加热下反应得到式 5c 的硫代酰苯胺。

### 反应式 7



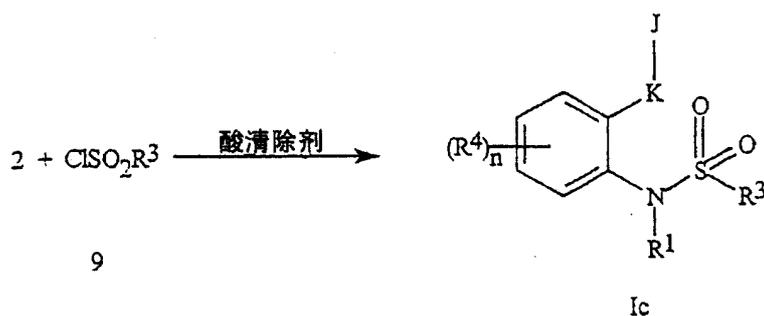
此外，式 Ib 的硫代酰苯胺可以由式 Ia 的相应的酰苯胺经反应式 8 中所述的方法制得。

### 反应式 8



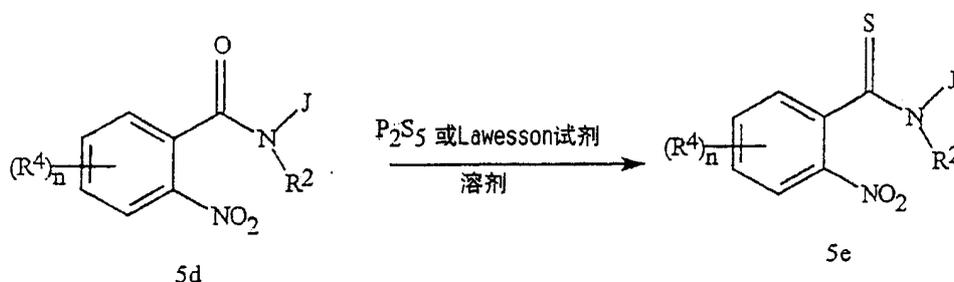
式 Ic 的化合物可以在有酸清除剂的情况下，将式 2 的胺与式 9 的磺酰基氯反应制得。典型的酸清除剂包括胺碱类，例如三乙胺、*N,N*-二异丙基乙胺和吡啶；其它清除剂包括氢氧化物如氢氧化钠和氢氧化钾以及碳酸盐如碳酸钠和碳酸钾。在某些情况下，也可以采用聚合物载酸清除剂，如结合在聚合物上的 *N,N*-二异丙基乙胺和结合在聚合物上的 4-(二甲基)氨基吡啶。

### 反应式 9



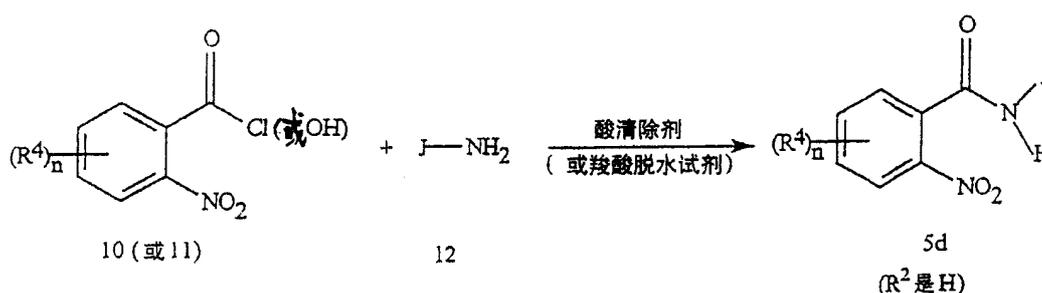
式 5e 的硫酰胺可以由式 5d 的相应的酰胺经与反应式 7 中所述相似的方法制得。

### 反应式 10



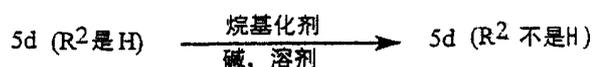
式 5d 的酰胺(其中  $R^2$  是 H)可以由式 10 的酰基氯或者由式 11 的羧酸分别经与反应式 1 和 2 中所述相似的方法制得。

### 反应式 11



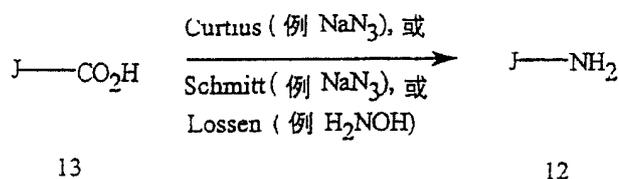
式 5d 的酰胺(其中  $R^2$  不是 H)可以由式 5d 的相应酰胺经与反应式 6 中所述的类似方法制得。

### 反应式 12



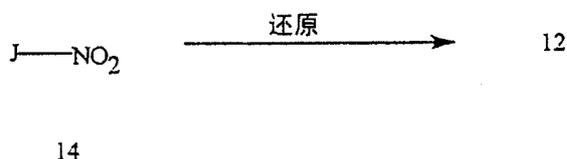
式 12 的胺可以由式 13 的羧酸(或者相应的酰基氯衍生物)使用 Curtius、Schmitt 或 Lossen 条件制得。这些名称反应在文献中已被充分公开。一些代表性的反应条件例如参见 R.C. Larock、*Comprehensive Organic Transformations*, 1989, VCH 出版社, 第 431-2 页。

## 反应式 13



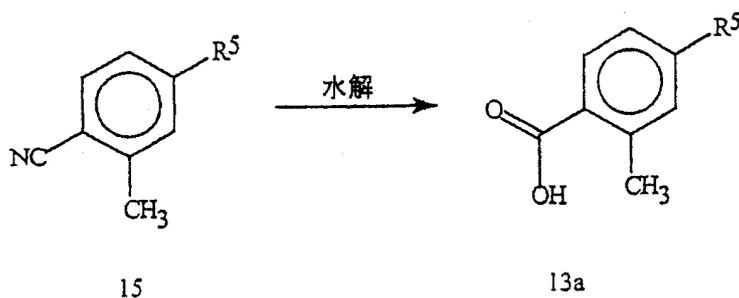
式 12 的胺也可以将式 14 的合适硝基化合物通过与反应式 3 中所述相似的方法还原制得。

## 反应式 14



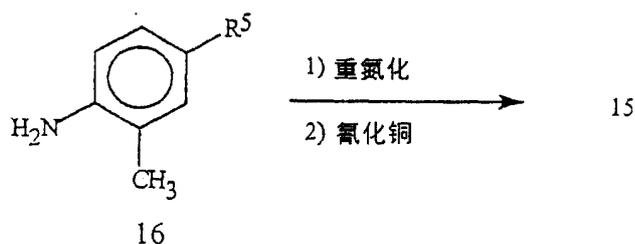
式 13a 的苯甲酸(J 是任选取代的苯基)及其制备步骤在本领域中为公知。本发明的苯甲酸的一个特别有用的亚类是式 13a 的 2-甲基-4-全氟烷基苯甲酸(一个  $R^5$  是例如  $\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_2\text{F}_5$ 、 $\text{C}_3\text{F}_7$ )。反应式 15-19 概括了这些化合物的合成。式 13a 的苯甲酸可以由式 15 的苜腈通过水解制得。所用条件可以包括使用在溶剂如水、乙醇或乙二醇中的碱如碱金属氢氧化物或醇化物(例如氢氧化钾或氢氧化钠)(例如 *J. Chem. Soc.* 1948, 1025)。或者, 可以使用酸(如硫酸或磷酸)在合适的溶剂如水中进行水解(例如 *Org. Synth.* 1955, Coll Vol. 3, 557)。条件的选择依  $R^5$  对这些反应条件的稳定性而定; 通常使用高温获得这种转化。

## 反应式 15



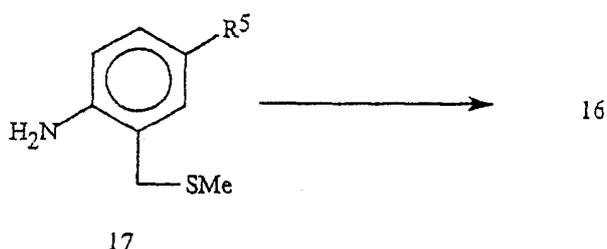
式 15 的脒可以由式 16 的苯胺通过包括重氮化并用氰化铜盐处理该中间重氮盐的经典步骤制得(例如 *J. Amer. Chem. Soc.* 1902, 24, 1035)。

### 反应式 16



式 16 的苯胺可以由式 17 的化合物制得。这种转化可以通过一种公知步骤使用阮内镍实现(*Org. Synth. Coll. Vol VI*, 581)。或者, 在有氢的情况下采用适当的催化剂例如钯, 也可以进行相同的转化。该反应通常在  $10^2$ - $10^5$  kPa 压力下, 在适当的有机溶剂如甲苯(但不限于此)中进行。为了完成转化, 通常需要 80-110°C 的高温。作为本领域技术人员将知道, 可以对硫醚部分进行许多化学改性, 并且在需要促进这种转化时可以采用。

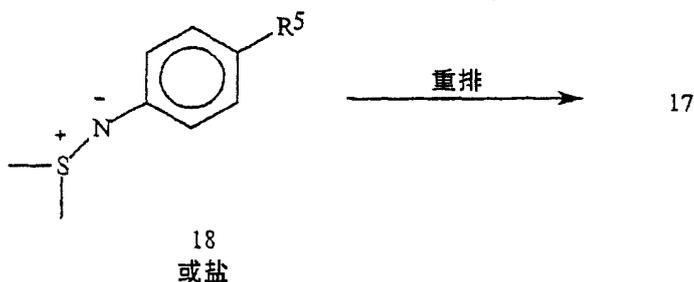
### 反应式 17



式 17 的化合物可从式 18 的亚氨基硫化物(iminosulfurane)制得。该转化可以在极性溶剂(如甲醇或水)中, 在非质子溶剂(如二氯甲烷或甲苯)中在适当的碱如三乙胺存在下(如 *Org. Synth. Coll. Vol. VI*, 581)或甲氧基钠存在下, 或在极性溶剂、极性溶剂和碱共同存在下完

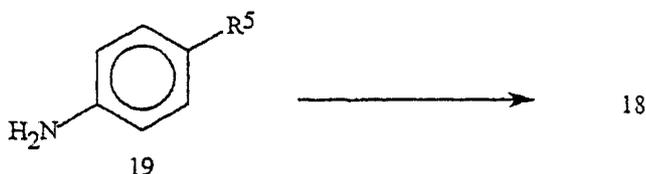
成。反应进行的温度通常在 40-110°C 的范围内。本领域技术人员知道，也可以采用式 18 的化合物的适当的盐，例如，但不限于盐酸盐、硫酸盐或亚硫酸盐，条件是首先用适量的碱以产生游离碱 18。这可以作为一个独立的步骤，或者与包括式 18 的化合物转化成式 17 的化合物的步骤合为一步。

### 反应式 18



式 18 的化合物可以由式 19 的苯胺通过与二甲基硫醚和适当的氯化剂（如(但不限于)*N*-氯丁二酰亚胺(如 *Org. Synth. Coll. Vol. VI*, 581)、氯或 *N*-氯苯并三唑) 反应制得。另外，式 19 的苯胺可以用二甲基砷处理，后者已通过用例如乙酸酐、三氟乙酸酐、三氟甲磺酸酐、环己基碳二亚胺、三氧化硫或五氧化二磷的试剂处理“活化”。该反应在适当的有机溶剂如二氯甲烷或二甲基砷中进行。反应在 -70°C 至 25°C 的温度下进行；最佳反应温度取决于所用的溶剂和反应剂。

### 反应式 19

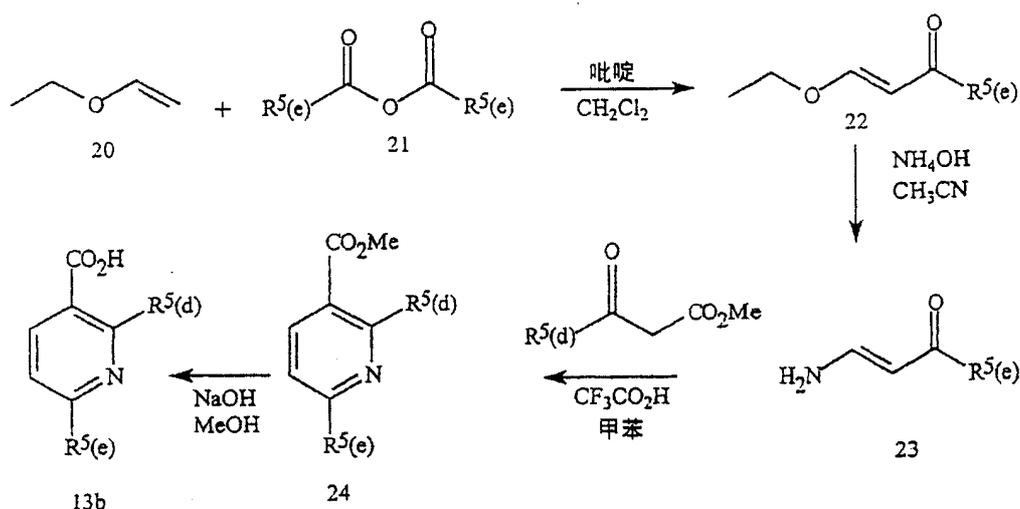


式 13 的杂环酸（其中 J 是一任选取代的杂环）可以通过反应式 20-25 所概括的步骤制得。在以下的概要中可以找到包括噻吩、呋喃、吡啶、嘧啶、三唑、咪唑、吡唑、噻唑、噁唑、异噻唑、噻二唑、噁二

唑、三嗪、吡嗪、哒嗪和异噻唑等的多种杂环酸的一般参考文献与专门参考文献: *Rodd's Chemistry of Chemistry of Carbon Compounds*, Vol. IVa-IVf., S. Coffey 编辑, Elsevier Scientific Publishing, New York, 1973; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol. 1-7, A. R. Katritzky 和 C. W. Rees 编辑, Pergamon Press, New York, 1984; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, Vol. 1-9, A. R. Katritzky, C. W. Rees 和 E. F. Scriven 编辑, Pergamon Press, New York, 1996; 及其系列, *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*, E. C. Taylor 编辑, Wiley, New York. 特别有用的本发明的杂环酸包括吡啶酸、嘧啶酸和吡唑酸。在反应式 20-25 中详述了合成每个代表性实例的方法。在世界专利申请 WO 98/57397 中可找到各种杂环酸及其常规的合成方法。

式 13b 的代表性的吡啶酸的合成描述于反应式 20。该方法包括已知的由 $\beta$ -酮酯和式 23 的 4-氨基丁酮合成吡啶。取代基  $R^5(d)$  和  $R^5(e)$  例如包括烷基和卤烷基。该方法的指导文献参见 *Synthesis*, 1999, (7), 1216-1222 和 *Heterocycles*, 1997, 46, 129-132。

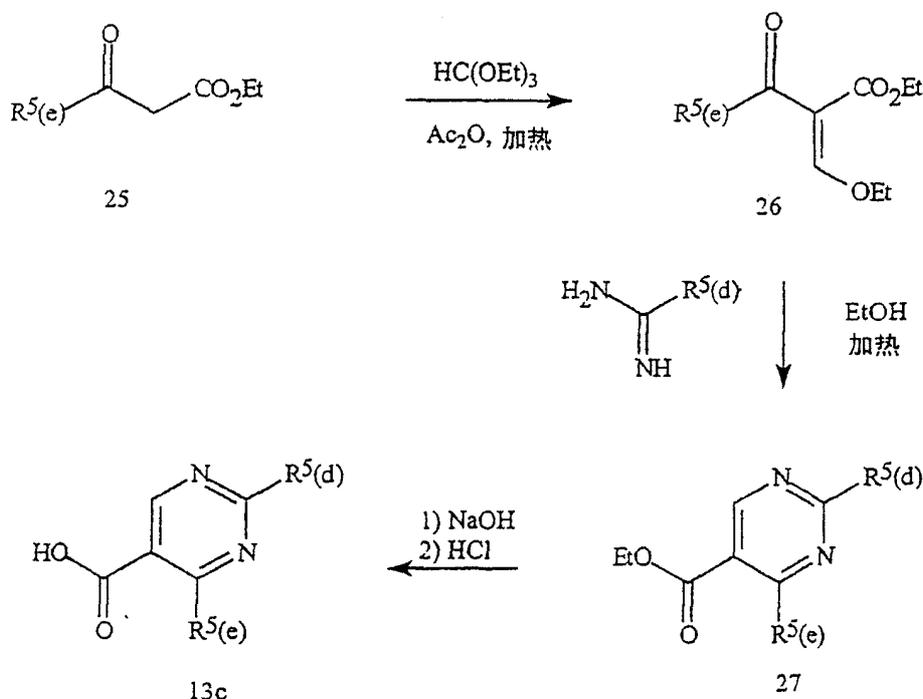
### 反应式 20



式 13c 的代表性的嘧啶酸的合成描述于反应式 21。该方法包括已知的由式 26 的亚乙烯基- $\beta$ -酮酯和脘合成嘧啶。取代基  $R^5(d)$  和  $R^5(e)$

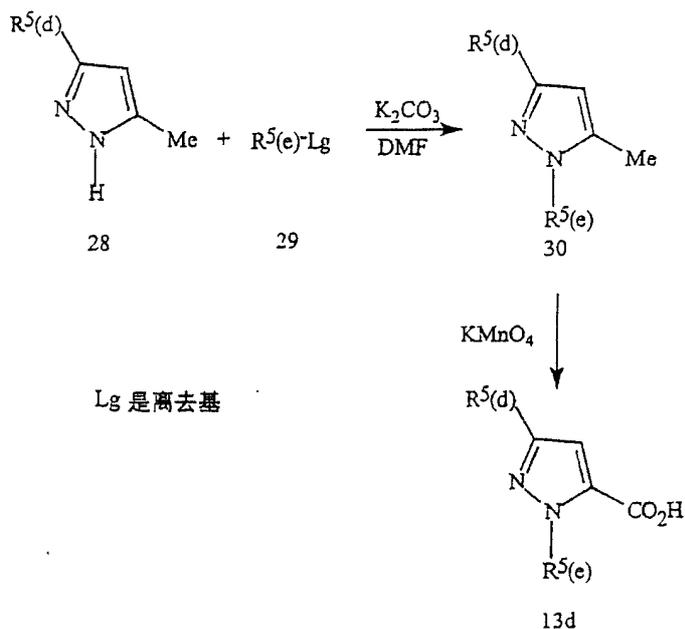
例如包括烷基和卤烷基。该方法的指导文献参见 *Bull. Soc. Chim. Fr.*, 1987, (2), 318-324。

### 反应式 21



式 13d 的代表性的吡唑酸的合成描述于反应式 22-25。反应式 22 中 13d 的合成包括通过式 28 的吡啶的烷基化引入  $R^5(e)$  取代基的关键步骤。烷基化试剂  $R^5(e)-Lg$  (其中  $Lg$  是可离去基团, 例如  $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、磺酸根如对甲苯磺酸基或甲磺酸基或硫酸根如  $-OSO_2R^5(e)$ ) 包括  $R^5(e)$  基团, 如  $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  链烯基、 $C_2-C_6$  链炔基、 $C_3-C_6$  环烷基、 $C_1-C_6$  卤烷基、 $C_2-C_6$  卤链烯基、 $C_2-C_6$  卤链炔基、 $C_3-C_6$  卤环烷基、 $C_2-C_6$  烷基羰基、 $C_2-C_6$  烷氧基羰基、 $C_3-C_8$  二烷基氨基羰基、 $C_3-C_6$  三烷基甲硅烷基; 和苯基、苄基、苯甲酰基、5-或 6-元杂芳环或芳族的 8-、9-或 10-元稠合的杂二环环系, 每个环或环系经过任选取代。甲基的氧化产生吡唑甲酸。更优选的一些  $R^5(d)$  基团包括卤烷基。

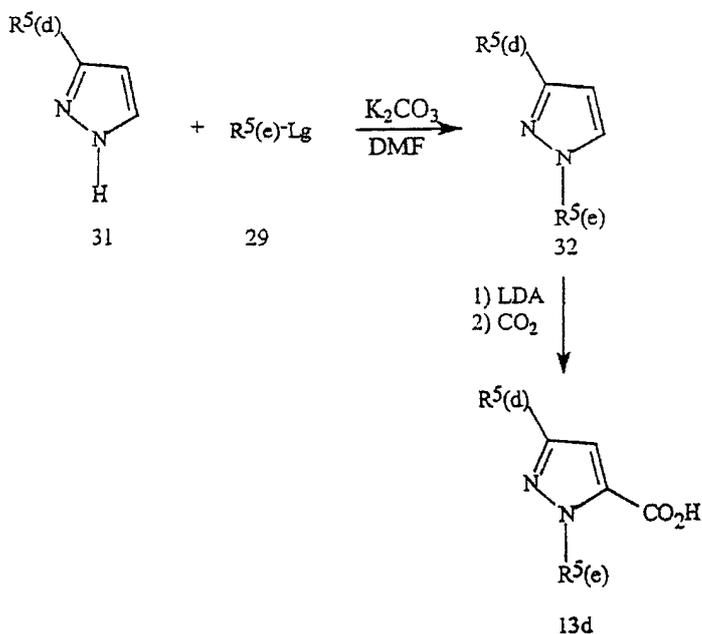
### 反应式 22



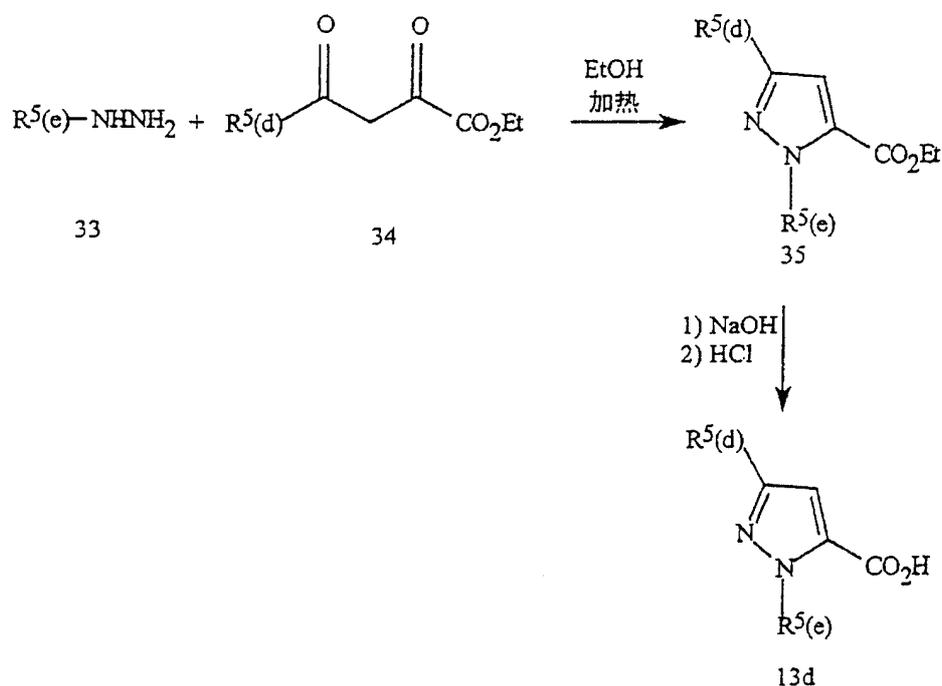
一些吡唑酸可以经式 32 的吡唑的金属化和羧化作为关键步骤来制备(反应式 23)。R<sup>5(e)</sup>基团以与反应式 22 类似的方法引入,即用 R<sup>5(e)</sup>烷基化试剂烷基化。代表性的 R<sup>5(d)</sup>基团包括如氰基和卤烷基。

式 13d 的其它吡唑可以经过任选取代的苯肼 33 与丙酮酸酯 34 反应产生吡唑酯 35 来制备(反应式 24)。所得的酯水解产生吡唑酸 13d。该方法对于制备 R<sup>5(e)</sup>为任选取代的苯基并且 R<sup>5(d)</sup>是卤烷基的化合物特别有用。

### 反应式 23

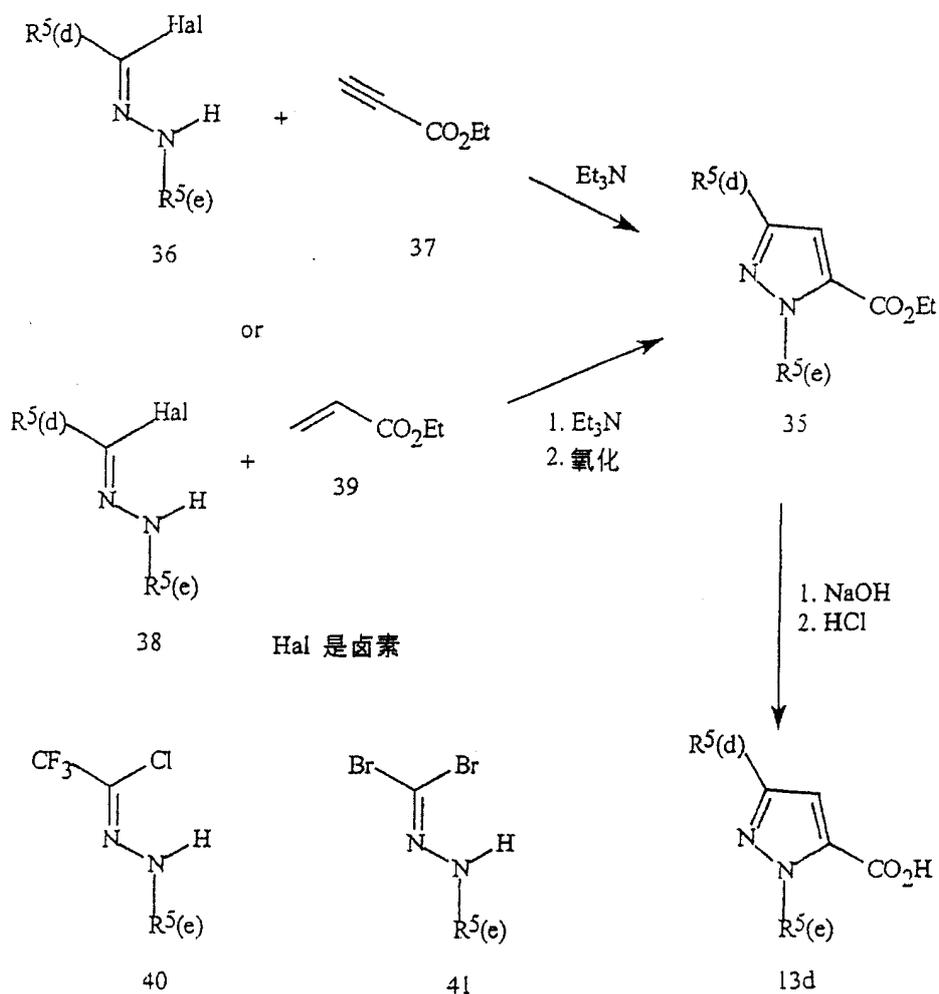


## 反应式 24



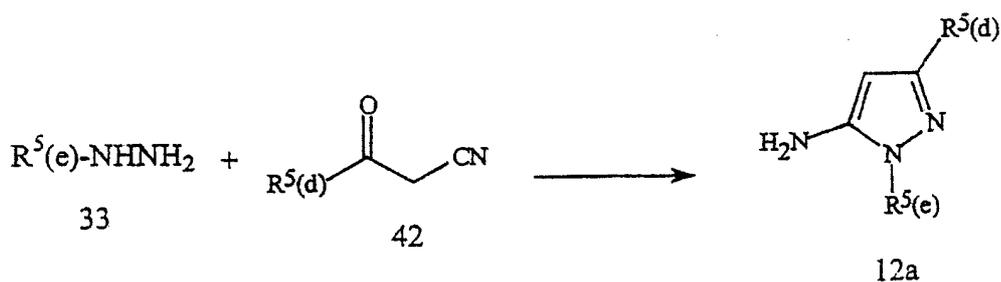
式 13d 的吡唑酸也可以通过一个适当取代的脞亚胺与式 37 的取代丙炔酸酯或者式 39 的丙烯酸酯经 3+2 环加成来制备，如反应式 25 中所示。用丙烯酸酯的环加成需要把中间体吡唑啉再氧化成吡唑。酯 35 水解产生吡唑酸 13d。本反应优选的亚胺卤化物包括三氟甲基亚氨基氯化物(40)和亚氨基二溴化物(41)。化合物如 40 是已知的(*J. Heterocycl. Chem.* 1985, 22(2), 565-8)。化合物如 41 可由已知方法得到(*Tetrahedron Letters* 1999, 40, 2605)。这些方法对于制备  $R^{5(e)}$  是任选取代的苯基和  $R^{5(d)}$  是卤烷基或溴的化合物特别有用。

## 反应式 25



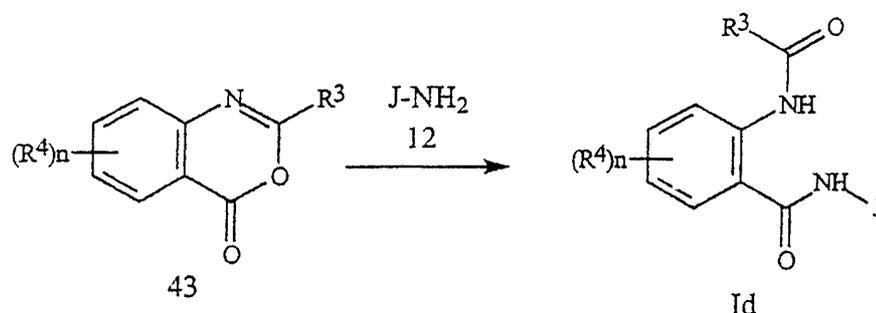
式 12a 的吡唑胺可以通过任选取代的苯肼 33 与式 42 的酮腈反应制得。该环化反应在现有技术中已充分公开。指导文献和一些代表性反应条件参见 PCT 公开 WO01/004115 和 *Synthesis*, 1997, (3), 337-341。反应条件也可以参见本发明的实施例 7。

## 反应式 26



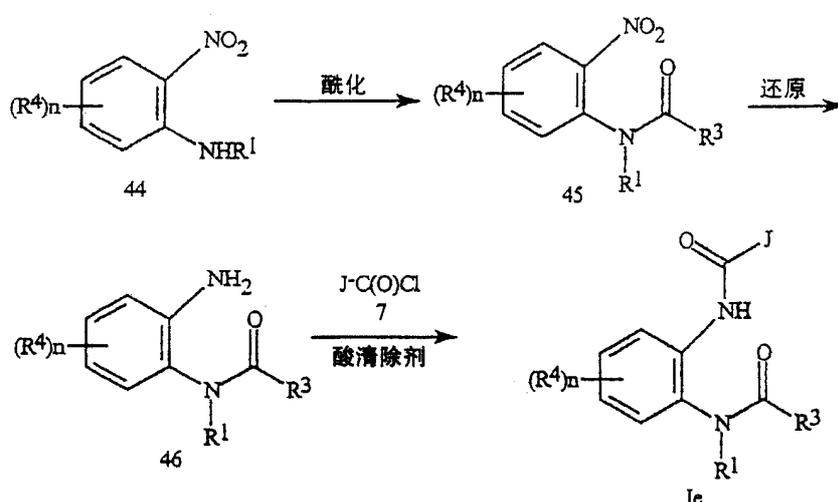
式 Id 的化合物可以用胺 12 处理苯并咪唑酮 43 制得，如反应式 27 所示。苯并咪唑酮与胺产生苯甲酰亚氨酰胺(anthranilamide)的常规反应在化学文献中已充分公开。关于苯并咪唑酮化学的综述参见 Jakobsen 等人, *Biorganic and Medicinal Chemistry* 2000, 8, 2095-2103 以及其中引证的文献。制备苯并咪唑酮 43 的代表性反应方法参见 *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 2000, 37(4), 725-729 和 *Tetrahedron*, 1995, 51(7), 1861-6。

反应式 27

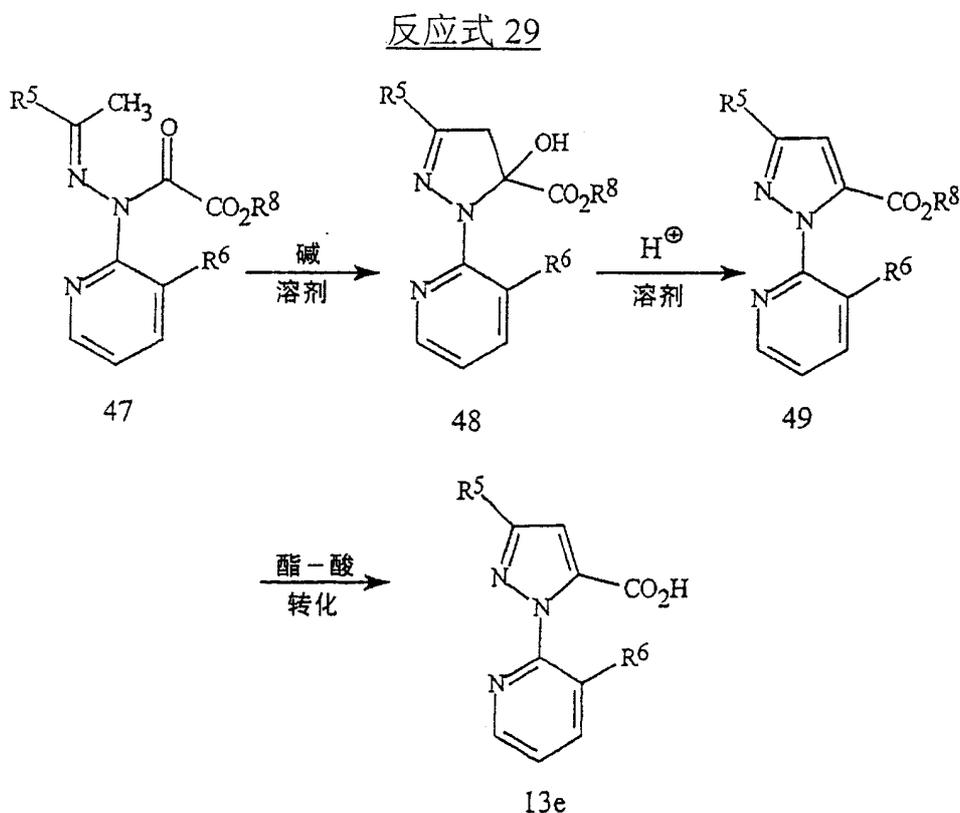


式 Ie 的化合物可以通过反应式 28 中所述的方法制得。将胺 44 酰基化，然后将硝基还原，得到式 46 的胺。胺 46 与酰基氯 7 经反应式 1 中所述的类似方法偶联得到式 Ie 的化合物。式 44 的化合物可以与反应式 3 中所述的类似方法通过还原烷基化制得。所述酰基化反应可以通过与反应式 1 和反应式 2 中所述的类似方法与酰基氯 3 或酸 4 偶联实现。

反应式 28



式 13e 的吡唑甲酸，其中  $R^5$  是  $CF_3$ ，可以通过反应式 29 中概括的方法制得。



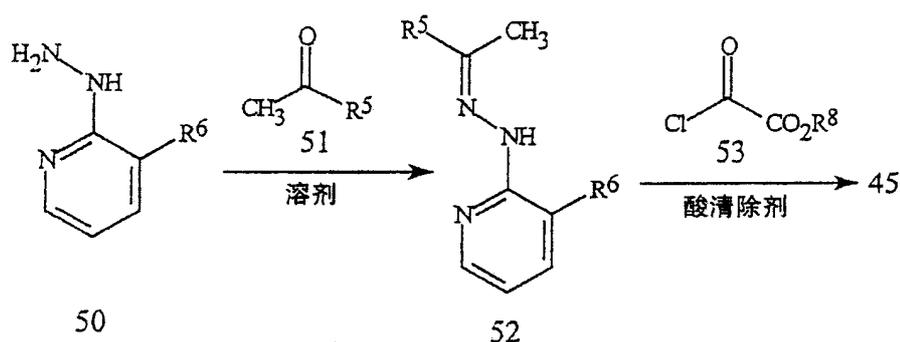
式 47 的化合物(其中  $R^8$  是  $C_1-C_4$  烷基)与合适的碱在合适的有机溶剂中反应，在用诸如乙酸的酸中和之后，得到式 48 的环化产物。所述合适的碱例如可以是，但不限于，氢化钠、叔丁氧基钾、甲基亚磺酸钠( $CH_3S(O)CH_2, Na^+$ )、碱金属(如锂、钠或钾)的碳酸盐或氢氧化物、四烷基(如甲基、乙基或丁基)铵氟化物或氢氧化物、或 2-叔丁基亚氨基-2-二乙基氨基-1,3-二甲基全氢化-1,3,2-diazaphosphonine。合适的有机溶剂可以是例如，但不限于，丙酮、乙腈、四氢呋喃、二氯甲烷、二甲亚砜或 *N,N*-二甲基甲酰胺。所述环化反应通常在约 0-120  $^{\circ}C$  的温度下进行。溶剂、碱、温度和加入时间的影响都是相互依赖的，并且反应条件的选择使副产物的形成最小化是重要的。优选的碱是氟化四丁基铵。

将式 48 的化合物脱水得到式 49 的化合物，接着将羧酸酯官能团

转化成羧酸，从而得到式 13e 的化合物。该脱水反应受到用催化量的合适酸处理的影响。该催化酸可以是例如，但不限于，硫酸。该反应通常使用有机溶剂进行。本领域技术人员应了解，脱水反应可以在各种溶剂中于通常在约 0-200°C，更优选在约 0-100°C 的温度范围内进行。就反应式 9 的方法中的脱水反应而言，优选溶剂包括乙酸，温度为约 65°C。通过许多方法可以将羧酸酯化合物转化成羧酸化合物，这些方法包括在无水条件下亲核裂解或者包括使用酸或碱的水解法(参见 T. W. Greene 和 P. G. M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版, John Wiley & Sons, Inc., New York, 1991, 第 224-269 页的方法综述)。就反应式 9 的方法而言，优选碱催化水解的方法。合适的碱包括碱金属(如锂、钠或钾)氢氧化物。例如，所述酯可以溶解在水和醇如乙醇的混合物中。用氢氧化钠或氢氧化钾处理之后，将该酯皂化得到羧酸的钠或钾盐。用强酸，如盐酸或硫酸酸化，得到式 13e 的羧酸。该羧酸可以通过本领域技术人员已知的方法分离，这些方法包括结晶、萃取和蒸馏。

式 47 的化合物可以通过反应式 30 中概括的方法制备。

### 反应式 30



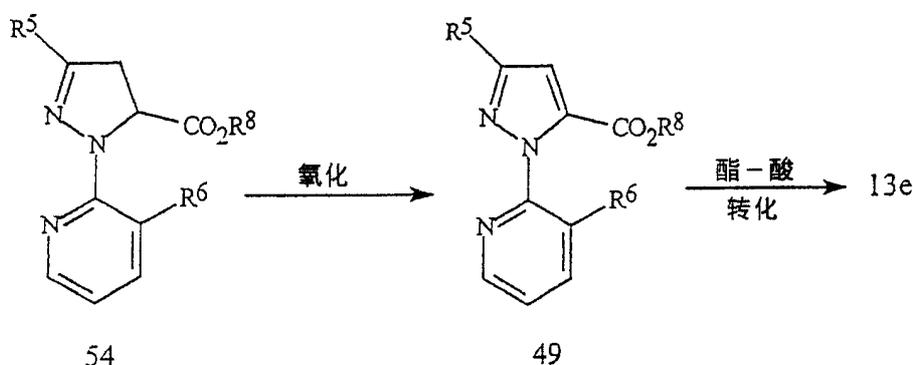
其中， $\text{R}^5$  为  $\text{CF}_3$ ， $\text{R}^6$  为  $\text{C}_1-\text{C}_4$  的烷基。

在溶剂如水、甲醇或乙酸中用式 51 的酮处理式 50 的胍化合物得到式 52 的脒。本领域技术人员将意识到，该反应可能需要任选的酸催化，并且可能还需要高温，这取决于式 52 的脒的分子取代形式。

式 52 的胍与式 53 的化合物在合适的有机溶剂(例如,但不限于,二氯甲烷或四氢呋喃)中在有酸清除剂(如三乙胺)的情况下反应得到式 47 的化合物。该反应通常在约 0-100°C 的温度下进行。反应式 30 的方法的进一步试验细节描述在实施例 8。式 50 的胍化合物可以通过标准方法制得,例如通过将相应的 2-卤代吡啶与胍接触。

作为反应式 29 中所述方法的替代,式 13e 的吡唑甲酸(其中  $R^5$  是 Cl 或 Br)也可以通过反应式 31 中概括的方法制得。

### 反应式 31

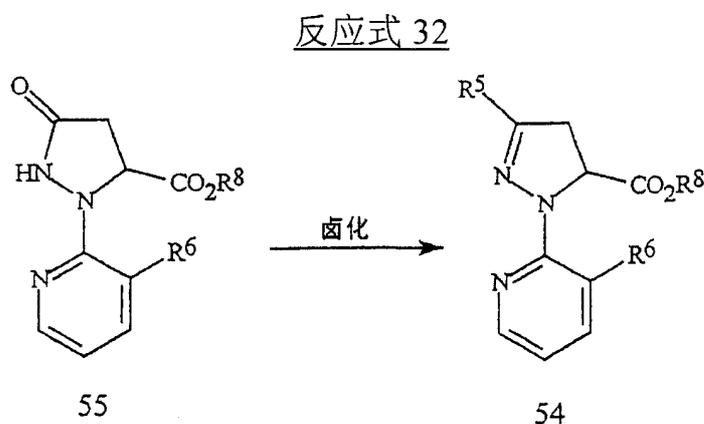


其中  $R^8$  是  $C_1$ - $C_4$  烷基。

任选在有酸的情况下将式 54 的化合物氧化得到式 49 的化合物,接着将羧酸酯官能团转化成羧酸,从而得到式 13e 的化合物。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、一过硫酸钾(例如, Oxone®)或高锰酸钾。为了获得完全转化,应使用至少 1 当量的氧化剂(相对式 54 的化合物),优选约 1-2 当量。这种氧化反应通常是在有一溶剂的情况下进行的。该溶剂可以是醚,例如四氢呋喃、对二噁烷等;有机酯,例如乙酸乙酯、碳酸二甲酯等;或者一极性质子惰性有机溶剂,例如 *N,N*-二甲基甲酰胺、乙腈等。适用于该氧化步骤的酸包括无机酸,例如硫酸、磷酸等;和有机酸,例如乙酸、苯甲酸等。该酸(当使用时)应以相对式 54 的化合物大于 0.1 当量使用。为了获得完全转化,可以使用 1-5 当量的酸。优选的氧化剂是过硫酸钾,并且该氧化反应优选在有硫酸的情况下进行。该反应可

以通过将式 54 的化合物混入所需溶剂和(如果使用的话)酸中进行。然后以方便的速度加入氧化剂。反应温度通常在低至约 0°C 至高至溶剂沸点的范围内变化,以便获得完成该反应的合理反应时间,优选小于 8 小时。所需产物,式 49 的化合物,可以通过本领域技术人员已知的方法分离,这些方法包括结晶、萃取和蒸馏。适用于将式 49 的酯转化成式 13e 的羧酸的方法已描述于反应式 29。

式 54 的化合物可以由式 55 的相应化合物如反应式 32 中所示制得。



其中 R<sup>8</sup> 是 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基。

通常在有一溶剂的情况下,用卤化试剂处理式 55 的化合物,得到式 54 的相应卤代化合物。可以使用的卤化试剂包括磷酰卤、三卤化磷、五卤化磷、亚硫酸氯、二卤三烷基磷烷、二卤二苯基磷烷、草酰氯和光气。优选磷酰卤和五卤化磷。为了获得完全的转化,相对式 55 的化合物,应使用至少 0.33 当量的磷酰卤,优选约 0.33-1.2 当量。为了获得完全的转化,相对式 55 的化合物,应使用至少 0.20 当量的五卤化磷,优选约 0.20-1.0 当量。就该反应而言,优选式 55 的化合物,其中 R<sup>8</sup> 是 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基。该卤化作用用的典型溶剂包括卤化链烷,例如二氯甲烷、氯仿、氯丁烷等;芳族溶剂,例如苯、二甲苯、氯苯等;醚类,例如四氢呋喃、对二噁烷、二乙醚等;和极性质子惰性溶剂,例如乙腈、*N,N*-二甲基甲酰胺等。任选,可以加入一种有机碱,

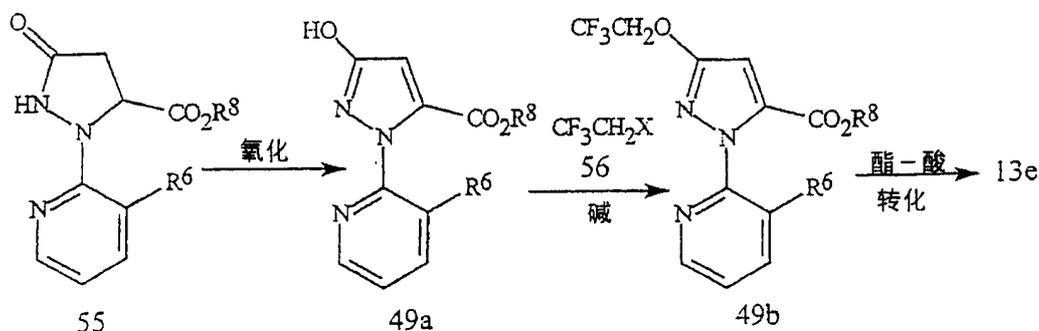
例如三乙胺、吡啶、*N,N*-二甲基苯胺等。加入一种催化剂，例如 *N,N*-二甲基甲酰胺，也是一种选择。优选溶剂是乙腈且没有碱的方法。通常，当使用乙腈溶剂时，要求既没有碱也没有催化剂。优选方法是通过将式 55 的化合物混入乙腈中来进行的。然后在方便的时间内加入该卤化试剂，然后将该混合物保持在所需温度，直到反应结束。反应温度通常在 20°C 与乙腈的沸点之间，并且反应时间通常小于 2 小时。然后将反应物用例如碳酸氢钠、氢氧化钠等的无机碱或者用例如乙酸钠的有机碱中和。目标产物，式 54 的化合物，可以用本领域技术人员已知的方法(包括结晶、萃取和蒸馏)分离。

或者，式 54 的化合物(其中  $R^5$  是 Br 或 Cl)可以通过分别用溴化氢或氯化氢处理式 54 的相应化合物制得，其中  $R^5$  是不同的卤素(例如，对于制备式 54 (其中  $R^5$  是 Br) 是 Cl)或者是磺酸根基团如对甲苯磺酸基、苯磺酸根和甲磺酸基。通过该方法，将式 54 的原料化合物上  $R^5$  卤素或磺酸根取代基分别用来自溴化氢或氯化氢的 Br 或 Cl 替换。该反应在合适的溶剂如二溴甲烷、二氯甲烷或乙腈中进行。该反应可以在大气压下或者在大气压附近或者在大于大气压于压力容器中进行。当式 54 的原料化合物中的  $R^5$  是卤素如 Cl 时，反应优选将反应中产生的卤化氢通过喷射或者其它合适的方式除去。该反应可以在约 0-100°C 之间进行，最方便地接近室温(例如，约 10-40°C)，更优选在约 20-30°C 之间。加入路易斯酸催化剂(如对制备  $R^5$  是 Br 的式 54 而言为三溴化铝)可以使该反应加速。式 54 的产物通过本领域技术人员已知的常规方法(包括萃取、蒸馏和结晶)分离。

式 54 的原料化合物(其中  $R^5$  是 Cl 或 Br)如已经叙及的可以由式 55 的相应化合物制得。式 54 的原料化合物(其中  $R^5$  是磺酸根基团)同样可以由式 54 的相应化合物通过标准方法如用磺酰氯(例如对甲苯磺酰氯)和碱如叔胺(例如，三乙胺)在合适的溶剂如二氯甲烷中处理制得。

式 13e 的吡唑甲酸(其中  $R^5$  是  $OCH_2CF_3$ )可以通过反应式 33 中概括的方法制得。

### 反应式 33



其中  $R^8$  是  $C_1$ - $C_4$  烷基, 并且 X 是离去基团。

在该方法中, 不用如反应式 32 中所示的卤化, 而是将式 55 的化合物氧化成式 49a 的化合物。该氧化反应的反应条件已在反应式 31 中将式 54 的化合物转化成式 49 的化合物时进行了描述。

然后在有碱的情况下将式 49a 的化合物与烷基化试剂  $CF_3CH_2X$  (56) 接触烷基化形成式 49b 的化合物。在该烷基化试剂 56 中, X 是一亲核反应离去基团, 例如卤素(例如 Br、I)、 $OS(O)_2CH_3$  (甲磺酸基)、 $OS(O)_2CF_3$ 、 $OS(O)_2Ph-p-CH_3$  (对甲苯磺酸基)等; 甲磺酸基是良好的离去基团。反应是在有至少 1 当量碱的情况下进行的。合适的碱包括无机碱, 例如碱金属(如锂、钠或钾)碳酸盐和氢氧化物; 以及有机碱, 如三乙胺、二异丙基乙基胺和 1, 8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯。反应通常是在一溶剂中进行的, 该溶剂可以包括醇类, 如甲醇和乙醇; 卤化链烷, 如二氯甲烷; 芳族溶剂, 如苯、甲苯和氯苯; 醚类, 如四氢呋喃; 和极性质子惰性溶剂, 如乙腈、*N,N*-二甲基甲酰胺等。优选将醇和极性质子惰性溶剂与无机碱一起使用。优选碳酸钾作为碱, 并优选乙腈作为溶剂。反应通常在约 0-150°C 之间进行, 最优选在室温-100°C 之间。通过常规技术如萃取可以将产物式 49b 分离。然后可以通过在反应式 29 中已经描述的将式 49 转化成式 13e 的方法



分钟。然后加入有机酸如乙酸等和无机酸如盐酸、硫酸等，将该反应物酸化。根据反应条件和分离方式，式 55 的化合物上的 $-\text{CO}_2\text{R}^8$ 官能团可以水解成 $-\text{CO}_2\text{H}$ ；例如，反应混合物中的水可以促进这种水解。如果形成羧酸( $-\text{CO}_2\text{H}$ )，那么使用本领域公知的酯化法可以将其转化回到 $-\text{CO}_2\text{R}^8$ ，其中 $\text{R}^8$ 是 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基。目标产物，式 55 的化合物，可以通过本领域技术人员已知的方法，如结晶、萃取或蒸馏分离。

应理解的是，上面所述制备式 I 的化合物的一些试剂和反应条件可能与这些中间物中存在的某些官能度不相容。在这些情况下，向该合成中加入保护/去保护序列或官能团将有助于获得所需产物。使用并选择保护基团对化学合成领域的技术人员将是显而易见的(例如参见 Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版; Wiley: New York, 1991)。本领域技术人员将意识到，在一些情况下，在任何单个反应式中加入如所述的给定试剂之后，可能需要进行未详细描述的其他路径的合成步骤来完成式 I 的化合物的合成。本领域技术人员还应意识到，在制备式 I 的化合物时，可能需要以不同与上述顺序的顺序来对上面反应式中所述的步骤进行组合。

本领域技术人员还意识到，式 I 的化合物和本文所述的中间物可以经受各种亲电、亲核、自由基、有机金属、氧化和还原反应以加入取代基或者改进现有的取代基。

尽管未进一步描述，但是据信本领域技术人员使用前面的描述可以最充分地利用本发明。因此，以下实施例仅仅是描述性的解释，不得以任何方式限制其内容。百分比以重量计，除了色谱溶剂混合物或者另有说明的之外。色谱溶剂混合物的份数和百分比以体积计，除非另有说明。 $^1\text{H}$  NMR 谱以 ppm 计从四甲硅烷降场报道的；s 是单峰，d 是双峰，t 是三重峰，q 是四重峰，m 是多峰，dd 是双重的双峰，dt 是双重的三重峰，br s 是宽单峰。

### 实施例 1

#### 1-(2-氯苯基)-N-[3-甲基-2-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-羧酰胺

##### 步骤 A: 1-(2-氯苯基)-5-2-呋喃基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑的制备

向 4, 4, 4-三氟-1-(2-糠基)-1, 3-丁二酮(30.0 g, 146 mmol)的冰醋酸(65 mL)溶液中加入乙酸钠(12.1 g, 148 mmol)。将该混合物冷却至约 25°C, 分份加入 2-氯苯基胍盐酸盐(25.6 g, 145 mmol), 接着适当放热, 将该混合物加热至 60°C 持续 4 小时, 然后冷却至 25°C。用二氯甲烷(400 mL)稀释该混合物, 并将有机相用水(3x250 mL)、饱和碳酸钠水溶液(2x250 mL)和盐水洗涤, 然后在硫酸镁上干燥并在减压下蒸发, 得到 43.2 g 标题化合物棕色油。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$  7.6(m, 5H), 6.9(1H), 5.7(d, 1H)。

##### 步骤 B: 1-(2-氯苯基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-羧酸的制备

在约 0.25 小时内向含有步骤 A 的标题化合物(43.2 g, 138 mmol)的乙腈(415 mL)悬浮液中加入磷酸二氢钠一水合物(92.4 g, 669 mmol)。在室温下搅拌 0.5 小时之后, 将该混合物冷却至约 5°C, 并在 1 小时内滴加含有亚氯酸钠(181.7 g、2.0 mmol)的 430 mL 水的溶液, 同时保持反应温度低于 10°C。[注: 与含水氢氧化钠洗涤塔相连以清洗析出的黄色气体。]加入结束之后, 在 5°C 下将该悬浮液搅拌约 1 小时, 在 25°C 下过夜, 然后通过滴加浓盐酸(150 mL)酸化至 pH 1, 然后用乙酸乙酯(1x500 mL, 然后 2x250 mL)萃取。在低于 20°C 的反应温度下将该混合的乙酸乙酯萃取物滴加到焦亚硫酸钠水溶液(228.5g 于 1.05 L 水中)中。将该悬浮液分开, 含水层用乙酸乙酯(2x100 mL)萃取。将有机层混合, 在硫酸镁上干燥并在减压下蒸发。残余物与己烷:二乙醚(99:1, 100 mL)一起研磨, 得到 32.9 g 标题化合物固体。

$^1\text{H NMR}(\text{DMSO}-d_6) \delta$  13.9(bs, 1H), 7.7(m, 5H)。

##### 步骤 C: 1-(2-氯苯基)-N-(3-甲基-2-硝基苯基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-

### 羧酰胺的制备

向步骤 B 的标题化合物(1.2 g, 3.4 mmol)的二氯甲烷(15 mL)的混合物中加入草酰氯(0.5g, 3.7 mmol), 接着加入 2 滴 *N,N*-二甲基甲酰胺。开始放热之后, 在室温、 $N_2$  下将该悬浮液搅拌 0.4 小时, 然后在减压下蒸发, 得到一油状残余物。将该残余物溶解在四氢呋喃(20 mL)中, 加入 2-甲基-6-硝基苯胺(0.5g, 152.2 mmol), 接着加入 *N,N*-二异丙基乙基胺(0.7 g, 129.5 mmol), 并在室温、 $N_2$  下将该悬浮液搅拌过夜。在减压下将该粗混合物蒸发, 在硅胶上用己烷:乙酸乙酯(2:1)作为洗脱剂通过闪蒸塔色谱法将该残余物纯化, 得到 200 mg 标题化合物固体; m.p. 215-220°C。

$^1H$  NMR( $CDCl_3$ ) $\delta$  2.3(s, 3H), 6.3-6.6(s, 1H), 7.4-7.6(m, 7H), 8.0(d, 1H)。

### 步骤 D: *N*-(2-氨基-3-甲基苯基)-1-(2-氯苯基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-羧酰胺

将步骤 C 的标题化合物(1.0 g, 2.3 mmol)溶解在乙酸乙酯(50 mL)中并在 10% Pd/C(200 mg, 1.8 mmol)上于 Parr Shaker(45 psi)中氢化 3 小时。接着将该反应混合物通过 Celite® 硅藻助滤剂进行过滤, 并在减压下将滤液蒸发, 将所得油残余物浆化于己烷中并过滤, 得到 1.0 g 标题化合物灰白色固体; m.p.165-167°C。

$^1H$  NMR( $CDCl_3$ ) $\delta$  2.2(s, 3H), 3.6(m, 2H), 6.7(m, 1H), 6.9(m, 1H), 7.1(m, 1H), 7.2(m, 1H), 7.4(m, 2H), 7.5, (m, 2H), 8.1(bs, 1H)。

### 步骤 E: 1-(2-氯苯基)-*N*-[3-甲基-2-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]苯基]-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-羧酰胺的制备

向含有步骤 D 的标题化合物(0.6 g, 1.5 mmol)的四氢呋喃(20 mL)悬浮液中加入异丁基氯(0.25g, 2.3 mmol), 接着加入 1-二异丙基乙基

胺(0.5g, 3.9 mmol)。在 25°C 下将该悬浮液搅拌过夜, 然后用 1N HCl(100 mL)和乙酸乙酯(100 mL)稀释。分离有机层, 用 1N HCl、水、饱和碳酸氢钠水溶液和盐水洗涤(每一洗液为约 50 mL), 然后在硫酸镁上干燥并在减压下蒸发, 得到 0.6 g 标题化合物(本发明的化合物)固体; m.p.240-242°C。<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) $\delta$  1.3(d, 6H), 2.5(s, 3H), 2.6(m, 1H), 7.0-7.6(m, 9H), 9.5(s, 1H)。

## 实施例 2

### 2-甲基-6-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]-N-[2-甲基-4-(三氟甲基)苯基]苯甲酰胺

#### 步骤 A: 2-甲基-N-[2-甲基-4-(三氟甲基)苯基]-6-硝基苯甲酰胺的制备

将 2-甲基-6-硝基苯甲酸(9.0 g, 49.7 mmol)和亚硫酸氯(62 mL)的混合物在回流下于甲苯(100 mL)中加热 2.5 小时, 然后冷却至 25°C。在减压下将所得悬浮液蒸发, 然后与甲苯共沸。将所得残余物溶解在四氢呋喃(10 mL)中, 将其滴加到含有 2-氨基-5-三氟甲基甲苯(2.89 g 16.5 mmol)和三乙胺(2.02 g, 20 mmol)的四氢呋喃(20 mL)溶液中。在 25°C 下将该悬浮液搅拌 72 小时, 然后倒入水中并用乙酸乙酯(2x20 mL)萃取。将该混合有机萃取物蒸发于硅胶上并在硅胶(使用梯度从 100%己烷到 1:1 己烷:乙酸乙酯的洗脱剂)上通过中压液相色谱法纯化, 得到 1.22 g 标题化合物。

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) $\delta$  2.4(s, 3H), 2.6(s, 3H), 7.5-7.7(m, 5H), 8.1(m, 1H), 8.2(m, 1H)。

#### 步骤 B: 2-氨基-6-N-[2-甲基-4-(三氟甲基)苯基]苯甲酰胺的制备

将步骤 A 的标题化合物(2.73 g, 7.7 mmol)溶解在乙醇(25 mL)中并在 Pd/C(0.2 g)上使用 Parr Shaker(350 kPa)氢化 16 小时。将所得反应悬浮液通过 Colite®过滤之后, 用二乙醚洗涤滤得的白色滤饼。在减压下将这些混合的有机层蒸发, 得到 2.4 g 标题化合物半固体。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$  2.4(m, 6H), 6.8(m, 3H), 7.1(m, 1H), 7.4-7.7(m, 4H), 8, 3(m, 1H)。

步骤 C : 2-甲基-6-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]-N-[2-甲基-4-三氟甲基]苯基]苯甲酰胺的制备

将异丁酰氯(51.8 mg, 0.5 mmol)加入到含有步骤 B 的标题化合物(0.15g, 0.5 mmol)和 *N,N*-二异丙基乙基胺(0.13 g, 1.0 mmol)的氯仿(5 mL)溶液中。在 25°C 下将该悬浮液搅拌过夜, 然后用 1N HCl 稀释。搅拌约 1 小时之后, 将该悬浮液通过 0.45 微米 PTFE 膜过滤, 并在减压下将该滤液蒸发, 得到 0.08 g 标题化合物(本发明的化合物)固体; m.p. > 230°C。

$^1\text{H NMR}(\text{DMSO}-d_6)\delta$  1.0(d, 6H), 2.5(s, 3H), 2.4(s, 3H), 2.6(m, 1H), 7.1(m, 1H), 7.3(m, 1H), 7.6(m, 2H), 7.9(m, 2H), 9.3(bs, 1H), 9.9(s, 1H)。

### 实施例 3

2-甲基-6-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]-N-[2-甲基-4-(三氟甲氧基)苯基]苯甲酰胺

步骤 A: 2-甲基-N-[2-甲基-4-(三氟甲氧基)苯基]-6-硝基苯甲酰胺的制备

通过实施例 2 的步骤(步骤 A), 将 2-甲基-4-三氟甲氧基苯胺(3.15g, 16.5 mmol)与 2-甲基-6-硝基苯甲酰氯(3.3 g, 16.5 mmol)和三乙胺(2.02 g, 20 mmol)于四氢呋喃(30 mL)中反应。在反应结束之后, 将反应悬浮液倒入过量水中, 并用乙酸乙酯萃取几次。将这些混合的萃取液在硫酸镁上干燥并在减压下蒸发, 得到一固体。将该固体通过与己烷:二乙醚溶液一起研磨进一步纯化, 得到 2.73 g 标题化合物。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$  2.3(s, 3H), 2.6(s, 3H), 7.1(m, 3H), 7.5(m, 1H), 7.6(m, 1H), 7.9(m, 1H), 8.1(m, 1H)。

### 步骤 B: 2-氨基-6-N-[2-甲基-4-(三氟甲氧基)-苯基]苯甲酰胺的制备

通过实施例 2 的步骤(步骤 B), 将实施例 3(步骤 A)的标题化合物(2.73 g, 7.7 mmol)氢化, 得到 2.4 g 标题化合物半固体。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$  2.3(s, 3H), 2.5(s, 3H), 6.6(m, 2H), 7.1(m, 6H), 7.4(bs, 1H), 8.0(m, 1H)。

### 步骤 C: 2-甲基-6-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基-N-[2-甲基-4-(三氟甲氧基)苯基]苯甲酰胺的制备

将异丁酰氯(0.16 g, 1.2 mmol)加入到含有步骤 B 的标题化合物(0.2 g, 0.6 mmol)和 *N,N*-二异丙基乙基胺(0.16 g, 1.2 mmol)的二氯甲烷(5 mL)溶液中。在 25°C 下将该反应搅拌过夜之后, 将该悬浮液倒入水中并用乙酸乙酯萃取几次。将这些混合的萃取物在硫酸镁上干燥并在减压下蒸发, 得到 0.13 g 标题化合物(本发明的化合物)固体; m.p. > 230°C。

$^1\text{H NMR}(\text{DMSO}-d_6)\delta$  1.0(d, 6H), 2.3(s, 3H), 2.4(s, 3H), 2.6(m, 1H), 7.1(m, 1H), 7.2-7.4(m, 4H), 7.7(m, 1H), 9.3(s, 1H), 9.8(s, 1H)。

## 实施例 4

### 3-氯-2-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]-N-[4-(三氟甲氧基)苯基]苯甲酰胺

#### 步骤 A: 3-氯-2-硝基-N-[4-(三氟甲氧基)苯基]苯甲酰胺的制备

将五氯化磷(2.14 g, 10.2 mmol)分份加入到 3-氯-2-硝基苯甲酸(2.0 g, 9.7 mmol)的二氯甲烷(30 mL)混合物中。加入结束并且气体释放停止之后, 在室温下将溶液搅拌 0.5 小时, 然后在减压下蒸发。残余的磷酰氯在减压下用甲苯进一步除去, 得到 2.1 g 相应的苯甲酰氯固体。将含有该苯甲酰氯(1.0 g, 4.4 mmol)的二氯甲烷(10 mL)溶液滴加到含有 4-三氟甲氧基苯胺(0.79 g, 4.4 mmol)和三乙胺(0.45g, 4.4 mmol)的二氯甲烷(3 mL)溶液中。在室温下将该悬浮液搅拌 0.5 小时,

然后倒入过量水中并用乙酸乙酯萃取几次。将该混合的有机萃取物用水洗涤，在硫酸镁上干燥并在减压下蒸发，得到一固体。将该固体用己烷:二乙醚(1:1)洗涤，得到 1.38 g 标题化合物固体；m.p.171-172°C。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$  7.2(m, 3H), 7.5-7.7(m, 4H), 7.8(bs, 1H)。

#### 步骤 B: 2-氨基-3-氯-N-[4-(三氟甲氧基)苯基]苯甲酰胺的制备

向硼氢化钠(26 mg, 0.68 mmol)的乙醇(1 mL)溶液中加入含有乙酰丙酮酸铜(II) (20.0 mg, 0.08 mmol)的 2-丙醇(1 mL)悬浮液，接着加入含有步骤 A 的标题化合物(0.25g, 0.6 mmol)的 2-丙醇(3 mL)悬浮液，接着加入硼氢化钠(2.0 mg, 78 mmol)的乙醇(2 mL)溶液。在 25°C 下将该反应混合物搅拌 7 小时，然后倒入稀氯化铵水溶液中并用乙酸乙酯萃取几次。将该混合有机萃取物在氯化镁上干燥并在减压下蒸发，得到 0.18 g 标题化合物。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$  7.3(m, 5H), 7.4(m, 2H), 7.6(m, 2H), 7.8(bs, 1H)。

#### 步骤 C: 3-氯-2-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]-N-[4-(三氟甲氧基)苯基]苯甲酰胺的制备

将异丁酰氯(57 mg, 0.5 mmol)加入到步骤 B 的标题化合物(0.18 g, 0.5 mmol)和三乙胺(54.0 mg, 0.5 mmol)的二氯甲烷(3 mL)中的混合物中。搅拌 1.5 小时之后，另外加入 5 滴异丁酰氯和 5 滴三乙胺。将该悬浮液搅拌 2 小时，然后倒入水中并用乙酸乙酯萃取几次。混合的萃取物用水洗涤，然后在硫酸镁上干燥并在减压下蒸发。残余物在硅胶上用己烷:乙酸乙酯(2:1)作为洗脱剂通过闪蒸塔色谱法进一步纯化，得到 40.0 mg 标题化合物(本发明的化合物)固体；m.p.230-233°C。

$^1\text{H NMR}(\text{DMSO}-d_6)\delta$  1.0(d, 6H), 2.6(m, 1H), 7.3-7.4(m, 3H), 7.5(m, 1H), 7.7(m, 1H), 7.8(m, 2H), 9.6(s, 1H), 10.4(s, 1H)。

### 实施例 5

1-(3-氯-吡啶基)-N-[2-甲基-6-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]苯基]-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-羧酰胺

步骤 A: 1-(3-氯-吡啶基)-N-(2-甲基-6-硝基苯基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-羧酰胺的制备

向 0°C 下 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-羧酸(2.875 g, 9.86 mmol) 搅拌于二氯甲烷(30 mL) 中的悬浮液中加入草酰氯(5.16 mL, 59.2 mmol), 接着滴加 *N,N*-二甲基甲酰胺(1 滴)。然后将该搅拌溶液加热至回流并在该温度下搅拌 1 小时之后, 在减压下将该溶液浓缩至干。然后将残余物溶解在四氢呋喃(30 mL) 中并向该搅拌溶液中加入 2-甲基-6-硝基苯胺。然后将该溶液冷却至 0°C 并滴加 *N,N*-二异丙基乙基胺(8.60 mL, 49.3 mmol)。然后将该搅拌溶液加热至回流, 并在该温度下搅拌 42 小时, 然后在减压下浓缩至干。然后将残余物溶解在乙酸乙酯(30 mL) 中, 并将该溶液用 1N HCl(10 mL)、饱和碳酸氢钠水溶液(10 mL) 和盐水(10 mL) 洗涤, 干燥(MgSO<sub>4</sub>) 并在减压下浓缩, 剩下一黄色固体。将该产物溶解在乙腈(6 mL) 中, 同时搅拌, 加入氨水(6 mL), 并在室温下将该溶液搅拌 2 小时, 然后在减压下浓缩至干。该产物在硅胶(3:1 庚烷-乙酸乙酯洗脱剂) 上通过闪蒸塔色谱法纯化, 得到标题化合物黄色固体(1.53 g)。

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 2.21(s, 3H), 7.18(s, 1H), 7.27(t, 1H), 7.38(m, 1H), 7.47(d, 1H), 7.84(d, 1H), 7.85(d, 1H), 8.42(dd, 1H), 9.16(s, 1H)。

步骤 B: N-(2-胺-6-甲基苯基)-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-羧酰胺的制备

将含有 10% Pd/C(69 mg) 的乙醇(5 mL) 搅拌悬浮液的烧瓶抽真空/填充氮气(x3)。然后向该悬浮液中加入 1-(3-氯-吡啶基)-N-(2-甲基-6-硝基苯基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-羧酰胺(即步骤 A 的产物)(1.38 g, 3.25 mmol) 的乙醇(9 mL) 溶液。然后将该烧瓶抽真空/填充氮气(x3) 然

后抽真空/填充氢气(x3)。在室温下将该反应混合物搅拌 18 小时，然后通过 Celite®过滤并将滤床用乙醇(2 x 3 mL)洗涤。在减压下将滤液浓缩，得到标题化合物灰白色固体(1.306 g)。

步骤 C: 1-(3-氯-吡啶基)-N-[2-甲基-6-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-羧酰胺的制备

向异丁酰氯(0.053 mL, 0.505 mmol)的四氢呋喃的搅拌溶液中加入 N-(2-胺-6-甲基苯基)-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-羧酰胺(即步骤 B 的产物)(0.20 g, 0.505 mmol)。然后将该溶液冷却至 0 °C，并滴加二异丙基乙基胺(0.60 mL, 3.59 mmol)。然后在 18 小时内将该搅拌溶液加热至室温，然后在减压下浓缩至干。然后将残余物溶解在乙酸乙酯(10 mL)中，并将该溶液用 1N HCl(10 mL)、饱和碳酸氢钠水溶液(10 mL)和盐水(10 mL)洗涤，干燥(MgSO<sub>4</sub>)并在减压下浓缩，剩下一黄色固体。该产物通过在热的叔丁基甲基醚(5 mL)中浆化纯化，得到标题化合物(本发明的化合物)固体(216 mg)，它在 215-217°C 下熔融。

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.11(s, 3H), 1.13(s, 3H), 2.20(s, 3H), 2.44(m, 1H), 6.89(dd, 1H), 7.05(s, 1H), 7.07(d, 1H), 7.15(s, 1H), 7.35(m, 1H), 7.48(s, 1H), 7.81(dd, 1H), 8.41(dd, 1H), 9.06(s, 1H)。

### 实施例 6

1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[3-甲基-2-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-羧酰胺

步骤 A : 2-甲基-N-(2-甲基-6-硝基苯基)-丙酰胺的制备

向 0°C 下 2-甲基-6-硝基苯胺(2.5g, 16.4 mmol)搅拌于二氯甲烷(22.5 mL)中的溶液中加入吡啶(2.5 mL)，接着滴加异丁酰氯(1.72 mL, 16.4 mmol)。在 2 小时内将该溶液加热至室温。于室温下再搅拌 48 小时之后，加入二氯甲烷(10 mL)，接着加入饱和碳酸氢钠水溶液(30

mL)。然后将水相分离并用二氯甲烷(20 mL)萃取。然后将有机萃取物混合,干燥(MgSO<sub>4</sub>)并在减压下浓缩,得到标题化合物黄色固体(3.54 g)。

#### 步骤 B: N-(2-氨基-6-甲基苯基)-2-甲基丙酰胺的制备

将含有 10% Pd/C(25 mg)的乙醇(5 mL)的搅拌悬浮液的烧瓶抽真空/填充氮气(x 3)。然后向该悬浮液中加入 2-甲基-N-(2-甲基-6-硝基苯基)-丙酰胺(即步骤 A 的产物)(2.54 g, 11.4 mmol)的乙醇(45 mL)溶液。然后将该烧瓶抽真空/填充氮气(x 3),然后抽真空/填充氢气(x 3)。室温下将该反应混合物搅拌 35 分钟,然后通过 Celite®过滤,并将滤床用乙醇(2 x 5 mL)洗涤。滤液在减压下浓缩,得到标题化合物灰白色固体(2.19 g)。

#### 步骤 C: 1-(3-氯-吡啶基)-N-[3-甲基-2-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-羧酰胺的制备

向 0°C 下 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-羧酸(0.1 g, 0.42 mmol)搅拌于二氯甲烷(4 mL)中的悬浮液中加入草酰氯(0.31 g, 2.44 mmol),接着滴加 *N,N*-二甲基甲酰胺(1 滴)。然后将该搅拌溶液加热至回流,并在该温度下搅拌 1 小时之后,在减压下将该溶液浓缩至干。然后将该残余物溶解在四氢呋喃(10 mL)中并向该搅拌溶液中加入 *N*-(2-氨基-6-甲基苯基)-2-甲基丙酰胺(即步骤 B 的产物)。然后将该溶液冷却至 0°C 并滴加 *N,N*-二异丙基乙基胺(0.52 mL, 2.99 mmol)。然后在 18 小时内将该溶液加热至室温并在减压下浓缩至干。然后将残余物溶解在乙酸乙酯(10 mL)中并将该溶液用 1N HCl(10 mL)、饱和碳酸氢钠水溶液(10 mL)和盐水(10 mL)洗涤,干燥(MgSO<sub>4</sub>)并在减压下浓缩,得到一黄色固体。该产物在硅胶(1:1 庚烷-乙酸乙酯洗脱剂)上经闪蒸塔色谱法纯化,然后从乙酸乙酯中再结晶,得到标题化合物(本发明的化合物)固体(70 mg),它在 219-220°C 下熔融。

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ 1.27(s, 3H), 1.29(s, 3H), 2.29(s, 3H), 2.66(m,

1H), 7.02(s, 1H), 7.08(s, 1H), 7.10(d, 1H), 7.25(s, 1H), 7.33(d, 1H), 7.39(m, 1H), 7.84(dd, 1H), 8.44(dd, 1H), 9.50(s, 1H)。

### 实施例 7

#### N-[1-(2-氯苯基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-基]-2-甲基-6-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]苯甲酰胺

#### 步骤 A: 4, 4, 4-三氟-3-氧代-丁腈(或者命名为 4, 4, 4-三氟乙酰乙腈)的制备

向一 500 mL 三颈烧瓶(配备有一个氮气起泡器和两个隔)中加入二异丙基酰胺锂(LDA)(18.4 mL, 0.172 mol, 2M 于庚烷中), 并将该反应混合物冷却至-72°C。在氮气下使用添加漏斗滴加乙酸三氟甲酯(10.0 g, 0.078 mol)、乙腈(6.41 g, 0.156 mol)和 THF(100 mL)的 0°C 溶液。45 分钟之后, 在 1-2 小时内将该溶液加热至室温, 用冷水(250 mL)骤冷, 并将有机溶剂蒸发。将含水层用二乙醚(3 x 250 mL)洗涤, 用浓 HCl 酸化至 pH 2 并用二氯甲烷(3 x 250 mL)洗涤。接着, 将含水层用二乙醚(3 x 250 mL)萃取。该二乙醚萃取物用硫酸钠干燥并浓缩, 得到标题化合物澄清橙色油(1.38 g, 0.010 mol, 产率 32%)。

$^1\text{H NMR}(\text{CD}_3\text{OD}, 300 \text{ MHz})\delta$  2.96(2H, s)。

#### 步骤 B: 1-(2-氯苯基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-胺的制备

向一 Personal Chemistry(Personal Chemistry Inc., Boston, MA, USA)10 mL 反应容器中加入 2-氯苯基胍(0.392 g, 2.19 mmol)、乙醇(2.5 mL)和 5 滴冰醋酸。加入 4, 4, 4-三氟-3-氧代-丁腈(即步骤 A 的产物)(0.300g, 2.19 mmol)的乙醇(1mL)溶液, 然后将该管密封, 并在 150°C 下在微波中加热 30 分钟。将所得粗混合物浓缩并使用硅胶色谱法(乙酸乙酯/己烷, 1:4)纯化, 得到标题化合物黄色固体(0.179 g, 0.684 mmol, 31%产率)。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3, 300 \text{ MHz}) \delta$  3.82(2H, br), 5.85(1H, s),

7.45-7.60(4H, m)。

步骤 C: 5-甲基-2-(1-甲基乙基)-4H-3, 1-苯并噁嗪-4-酮的制备

向一 500 mL 圆底烧瓶中加入 2-氨基-6-甲基苯甲酸(5.00 g, 0.033 mol)和 THF(200 mL)。加入异丁酰氯(7.049 g, 0.066 mol)和三乙胺(10.04 g, 0.099 mol), 并在室温下将该反应混合物搅拌过夜。除去溶剂之后, 化合物通过硅胶色谱法(乙酸乙酯/己烷, 1:9)纯化, 得到标题化合物白色固体(4.85g, 0.024 mol, 72%产率)。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3, 300 \text{ MHz})\delta$  1.35(6H, d), 2.78(3H, s), 2.90(1H, 七重峰), 7.21(1H, d), 7.40(1H, d), 7.64(1H, t)。

步骤 D: N-[1-(2-氯苯基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-基]-2-甲基-6-(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]苯甲酰胺的制备

在氮气下将氢化钠(0.2 g, 7.9 mmol, 95%纯度)加入到一 10 mL 的装有 1-(2-氯苯基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-胺(即步骤 B 的产物)(0.200 g, 0.76 mmol)和 DMF(5 mL)的烧瓶中。室温下搅拌 5 分钟之后, 加入 5-甲基-2-(1-甲基乙基)-4H-3, 1-苯并噁嗪-4-酮(即步骤 C 的产物)(0.155g, 0.76 mmol)。反应通过 TLC(薄层色谱法)监控, 用 10 滴水骤冷, 并直接通过硅胶制备 TLC(1:4 乙酸乙酯/己烷)纯化, 得到标题化合物(本发明的化合物)白色固体(0.135g, 0.29 mmol, 38%产率)。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3, 300 \text{ MHz})\delta$  1.08(6H, d), 2.14(3H, s), 2.38(1H, m), 6.91(1H, d), 7.07(1H, s), 7.02(1H, t), 7.41-7.59(5H, m), 8.28(1H, br), 8.36(1H, br)。

下面的实施例 8 描述了 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-羧酸的制备, 它可用于通过实施例 5 中所述的其它步骤制备例如 1-(3-氯-吡啶基)-N-[2-甲基-6-[(2-甲基-1-氧代丙基)氨基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-羧酰胺。

## 实施例 8

### 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-5-羧酸的制备

#### 步骤 A: 3-氯-2(1H)-吡啶酮(2,2,2-三氟-1-甲基亚乙基)脞的制备

在 20-25°C 下将 1, 1, 1-三氟丙酮(7.80 g, 69.6 mmol)加入到 3-氯-2(1H)-吡啶酮脞(或者命名为(3-氯-吡啶-2-基)-脞)(10 g, 69.7 mmol)中。结束加入之后, 将该混合物搅拌约 10 分钟。在减压下除去该溶剂并在乙酸乙酯(100 mL)和饱和碳酸钠水溶液(100 mL)之间将混合物分开。将有机层干燥并蒸发。通过硅胶色谱(用乙酸乙酯洗脱)得到灰白色固体产物(11 g, 66%产率), m.p. 64-64.5°C(从乙酸乙酯/己烷中结晶之后)。

IR(nujol) $\nu$  1629, 1590, 1518, 1403, 1365, 1309, 1240, 1196, 1158, 1100, 1032, 992, 800  $\text{cm}^{-1}$ 。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$  2.12(s, 3H), 6.91-6.86(m, 1H), 7.64-7.61(m, 1H), 8.33-8.32(m, 2H)。

MS  $m/z$  237( $\text{M}^+$ )。

#### 步骤 B: (3-氯-2-吡啶基)(2,2,2-三氟-1-甲基亚乙基)酰脞乙基氢乙二酸酯(或者命名为(3-氯-2-吡啶基)(2,2,2-三氟-1-甲基亚乙基)脞)乙基氢乙二酸酯的制备

0°C 下将三乙胺(20.81 g, 0.206 mol)加入到 3-氯-2(1H)-吡啶酮(2,2,2-三氟-1-甲基亚乙基)脞(即步骤 A 的产物)(32.63 g, 0.137 mol)的二氯甲烷(68 mL)中。在 0°C 下向该混合物中滴加氯氧代乙酸乙酯(18.75g, 0.137 mol)的二氯甲烷(69 mL)溶液。在约 2 小时内将该混合物加热至 25°C。将该混合物冷却至 0°C 并滴加另一份氯氧代乙酸乙酯(3.75g, 27.47 mmol)的二氯甲烷(14 mL)。加入约 1 小时之后, 用二氯甲烷(约 450 mL)稀释该混合物, 并且用水(2 x 150 mL)洗涤该混合物。将有机层干燥并蒸发。在硅胶上进行色谱分离(用 1:1 乙酸乙酯-己烷洗脱), 得到产物固体(42.06 g, 90%产率), m.p. 73.0-73.5°C(从乙酸乙

酯/己烷结晶之后)。

IR(nujol) $\nu$  1751, 1720, 1664, 1572, 1417, 1361, 1330, 1202, 1214, 1184, 1137, 1110, 1004, 1043, 1013, 942, 807, 836 $\text{cm}^{-1}$ 。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- $d_6$ , 115 $^\circ\text{C}$ ) 1.19(t, 3H), 1.72(br s, 3H), 4.25(q, 2H), 7.65(dd,  $J=8.3, 4.7$  Hz, 1H), 8.20(dd,  $J=7.6, 1.5$  Hz, 1H), 8.55(d,  $J=3.6$  Hz, 1H)。

MS  $m/z$  337( $M^+$ )。

#### 步骤 C: 1-(3-氯-2-吡啶基)-4,5-二氢-5-羟基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-甲酸乙酯的制备

在 8 小时内将(3-氯-2-吡啶基)(2,2,2-三氟-1-甲基-亚乙基)酰肼乙基氢乙二酸酯(即步骤 B 的产物)(5g, 14.8 mmol)的二甲亚砷(25mL)溶液加入到氯化四丁基铵(10 g)的二甲亚砷(25 mL) 溶液中。加入结束之后, 将该混合物倒入乙酸(3.25g)的水(25 mL)溶液中。在 25 $^\circ\text{C}$ 下搅拌过夜之后, 用甲苯萃取(4 x 25 mL)该混合物, 并将该混合的甲苯萃取物用水(50 mL)洗涤, 干燥并蒸发, 得到一固体。在硅胶上进行色谱分离(用 1:2 乙酸乙酯-己烷洗脱), 得到产物固体(2.91 g, 50%产率, 含有约 5%的 3-氯-2(1H)-吡啶酮(2,2,2-三氟-1-甲基亚乙基)脞), m.p. 78-78.5 $^\circ\text{C}$ (从乙酸乙酯/己烷中再结晶之后)。

IR(nujol) $\nu$  3403, 1726, 1618, 1582, 1407, 1320, 1293, 1260, 1217, 1187, 1150, 1122, 1100, 1067, 1013, 873, 829 $\text{cm}^{-1}$ 。

$^1\text{H NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$  1.19(s, 3H), 3.20(1/2 的 ABZ 图谱,  $J=18$  Hz, 1H), 3.42(1/2 的 ABZ 图谱,  $J=18$  Hz, 1H), 4.24(q, 2H), 6.94(dd,  $J=7.9, 4.9$  Hz, 1H), 7.74(dd,  $J=7.7, 1.5$  Hz, 1H), 8.03(dd,  $J=4.7, 1.5$  Hz, 1H)。

MS  $m/z$  319( $M^+$ )。

#### 步骤 D: 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-甲酸乙酯的制备

将硫酸(浓, 2 滴)加入到 1-(3-氯-2-吡啶基)-4,5-二氢-5-羟基-3-(三

氟甲基)-1*H*-吡唑-5-甲酸乙酯(即步骤 C 的产物)(1 g, 2.96 mmol)的乙酸(10 mL)中, 并将该混合物加热至 65°C 持续约 1 小时。将该混合物冷却至 25°C 并在减压下除去大多数乙酸。将该混合物在饱和碳酸钠水溶液(100 mL)和乙酸乙酯(100 mL)之间分开。将含水层再用乙酸乙酯(100 mL)。将混合的有机萃取物干燥并蒸发, 得到油状产物 (0.66 g, 77%产率)。

IR(neat) $\nu$  3147, 2986, 1734, 1577, 1547, 1466, 1420, 1367, 1277, 1236, 1135, 1082, 1031, 973, 842, 802 $\text{cm}^{-1}$ 。

$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)\delta$  1.23(t, 3H), 4.25(q, 2H), 7.21(s, 1H), 7.48(dd,  $J = 8.1, 4.7$  Hz, 1H), 7.94(dd,  $J = 6.6, 2$  Hz, 1H), 8.53(dd,  $J = 4.7, 1.5$  Hz, 1H)。

MS  $m/z$  319( $\text{M}^+$ )。

#### 步骤 E: 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-羧酸的制备

将氢氧化钾(0.5g, 85%, 2.28 mmol)的水(1 mL)溶液加入到 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-甲酸乙酯(即步骤 D 的产物)(0.66 g, 2.07 mmol)的乙醇(3 mL)溶液中。约 30 分钟之后, 在减压下除去溶剂, 将该混合物溶解在水(40 mL)中。将所得溶液用乙酸乙酯(20 mL)洗涤。含水层用浓盐酸酸化, 并用乙酸乙酯(3 x 20 mL)萃取。将混合的萃取物干燥并蒸发, 得到固体产物 (0.53 g, 93%产率), m.p.178-179 C(从己烷-乙酸乙酯中结晶之后)。

IR(nujol) $\nu$  1711, 1586, 1565, 1550, 1440, 1425, 1292, 1247, 1219, 1170, 1135, 1087, 1059, 1031, 972, 843, 816  $\text{cm}^{-1}$ 。

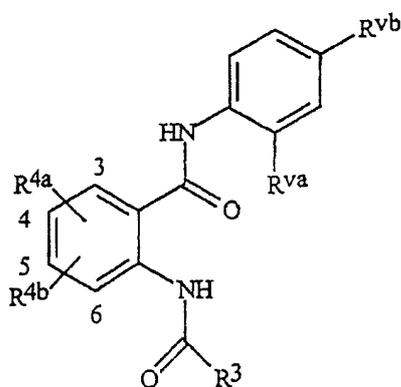
$^1\text{H NMR}(\text{DMSO-}d_6)\delta$  7.61(s, 1H), 7.77(m, 1H), 8.30(d, 1H), 8.60(s, 1H)。

通过本文所述的步骤并结合本领域已知的方法, 可以制备表 1-20 的下面的化合物, 其中: t 是叔, s 是仲, n 是正, i 是异, c 是环, Me 是甲基, Et 是乙基, Pr 是丙基, i-Pr 是异丙基, Bu 是丁基, Ph

是苯基，OMe 是甲氧基、OEt 是乙氧基、SMe 是甲硫基，SEt 是乙硫基，CN 是氰基，并且 S(O)<sub>2</sub>Me 是甲基磺酰基。

在如下的表 1-20 中：propargyl 为炔丙基；cyclopropyl 为环丙基；pyridyl 为吡啶基。

表 1



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>

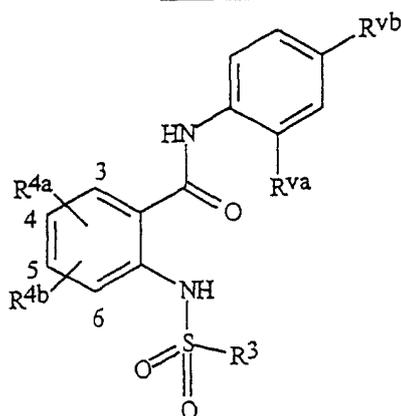
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 2



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>

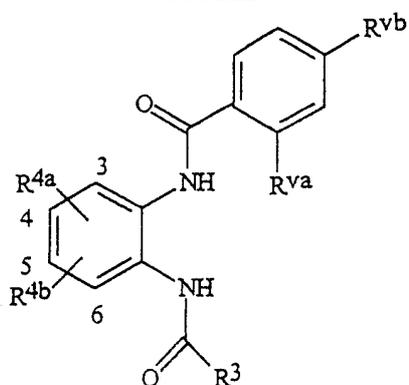
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 3



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-CIPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-CIPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-CIPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CIPh	Cl
Me	3-Me	H	2-CIPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

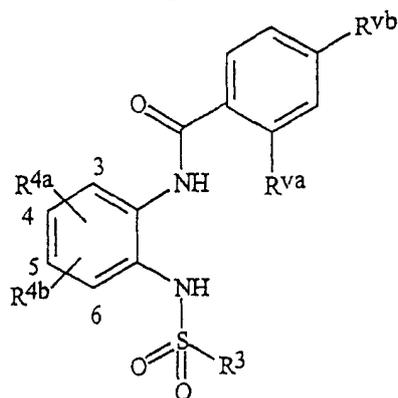
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 4



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>

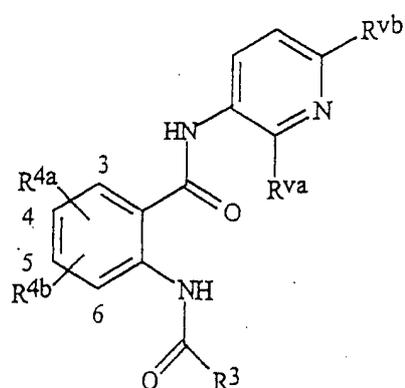
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	5-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-CIPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-CIPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-CIPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CIPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-CIPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 5



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-CIPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-CIPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-CIPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-CIPh	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>

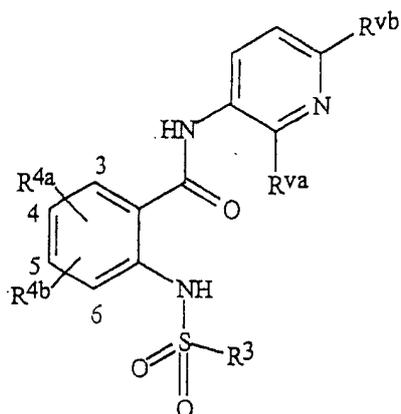
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 6



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-CIPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-CIPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-CIPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-CIPh	Cl
Me	6-Me	H	2-CIPh	SCHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

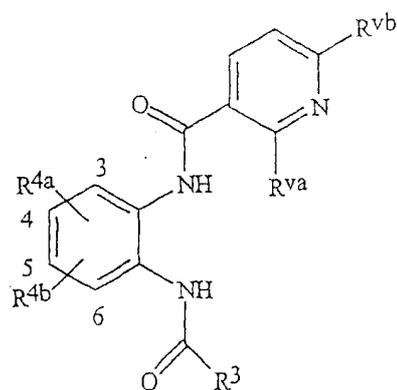
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
t-Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 7



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-CIPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-CIPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-CIPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-CIPh	Cl
Me	6-Me	H	2-CIPh	SCHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

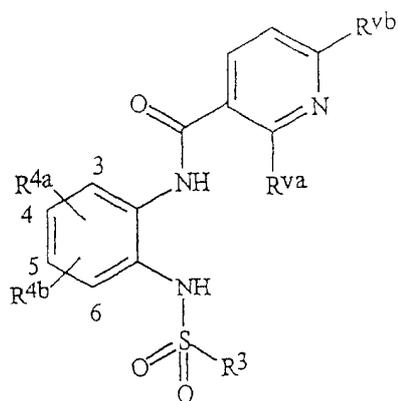
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 8



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

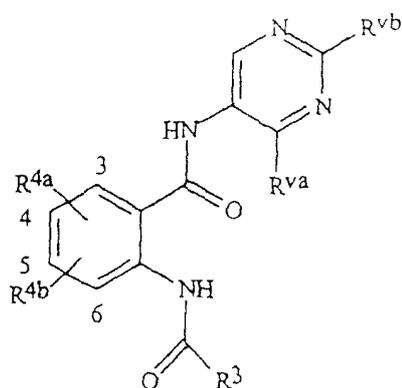
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 9



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-CIPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-CIPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-CIPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CIPh	Cl
Me	3-Me	H	2-CIPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-CIPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-CIPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-CIPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-CIPh	Cl
Me	6-Me	H	2-CIPh	SCHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

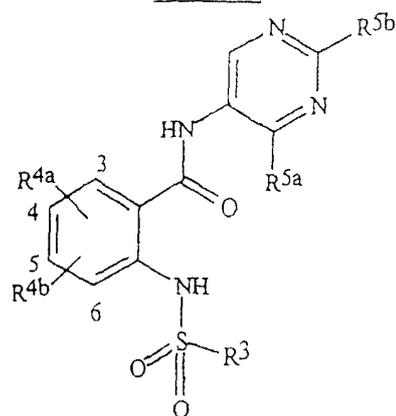
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 10



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

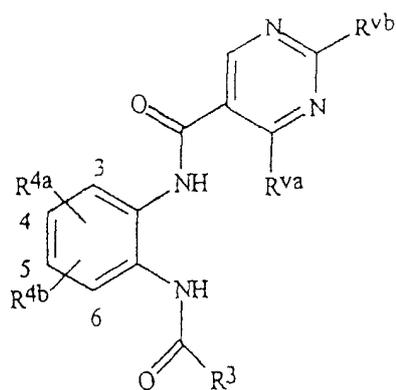
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 11



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-CIPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-CIPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-CIPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-CIPh	Cl
Me	6-Me	H	2-CIPh	SCHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

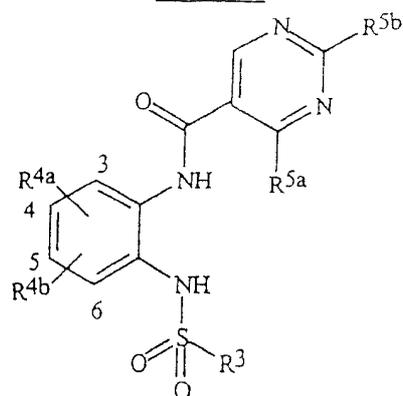
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 12



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
Et	6-Me	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

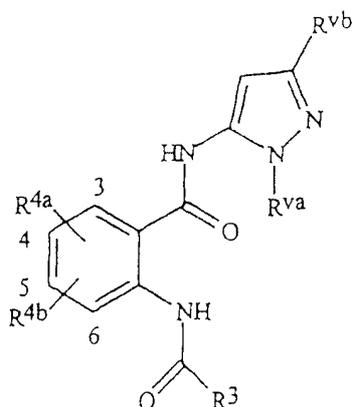
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Cl	CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	F	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 13



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OEt
Me	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CHF <sub>2</sub>	Me
Et	3-Me	H	Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Ph	Br
cyclopropyl	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-ClPh	Br
Et	3-Me	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
Et	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF <sub>3</sub>	Me
Me	6-Me	H	Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	Me	Br
Et	3-Br	5-Me	Et	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl
Me	3-Cl	H	Me	I
Et	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>

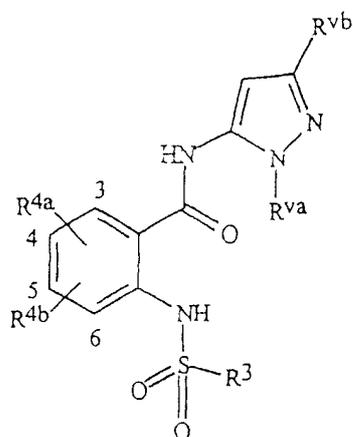
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Et	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
Et	3-Cl	H	Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br
Me	3-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	3-Cl	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Et	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	SMe
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
Et	6-I	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF <sub>3</sub>	Me
propargyl	6-Cl	H	Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 14



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Me	SMe

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OEt
Me	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CHF <sub>2</sub>	Me
Et	3-Me	H	Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Ph	Br
cyclopropyl	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-ClPh	Br
Et	3-Me	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
Et	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF <sub>3</sub>	Me
Me	6-Me	H	Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	Me	Br
Et	3-Br	5-Me	Et	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl
Me	3-Cl	H	Me	I

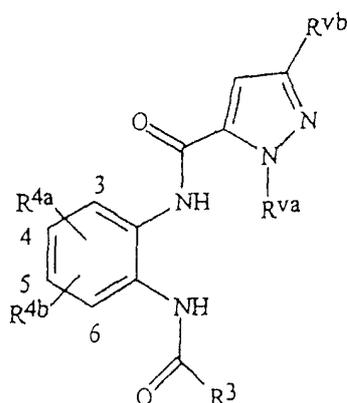
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Et	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
Et	3-Cl	H	Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br
Me	3-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Et	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	SMe
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OMe

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
Et	6-I	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF <sub>3</sub>	Me
propargyl	6-Cl	H	Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 15



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OEt
Me	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CHF <sub>2</sub>	Me
Et	3-Me	H	Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Ph	Br
cyclopropyl	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-ClPh	Br
Et	3-Me	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
Et	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF <sub>3</sub>	Me
Me	6-Me	H	Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	Me	Br
Et	3-Br	5-Me	Et	Br

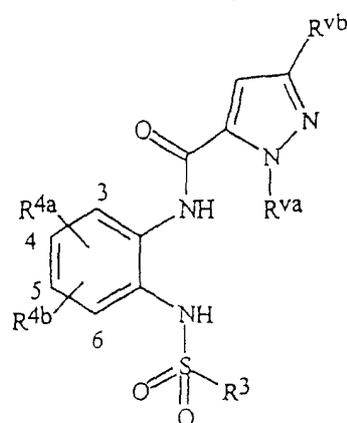
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl
Me	3-Cl	H	Me	I
Et	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Et	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
Et	3-Cl	H	Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br
Me	3-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Et	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	SMe
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
Et	6-I	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF <sub>3</sub>	Me
propargyl	6-Cl	H	Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 16



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	<i>S</i> -Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	<i>S</i> -Cl	Me	OEt
Me	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Me	<i>S</i> -F	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	<i>S</i> -Cl	CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	CHF <sub>2</sub>	Me
Et	3-Me	H	Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Ph	Br
cyclopropyl	3-Me	<i>S</i> -Br	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	<i>S</i> -Me	2-CIPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CIPh	OCF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2-CIPh	Br
Et	3-Me	H	2-CIPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	<i>S</i> -Cl	2-CIPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	<i>S</i> -Br	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
Et	6-Me	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF <sub>3</sub>	Me
Me	6-Me	H	Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br

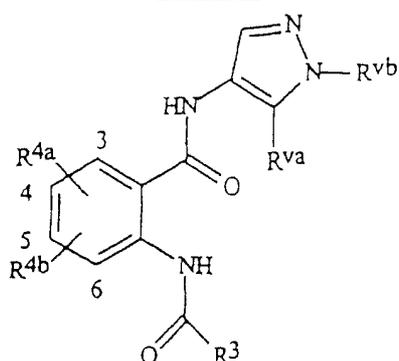
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	Me	Br
Et	3-Br	5-Me	Et	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl
Me	3-Cl	H	Me	I
Et	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Et	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	Me
Et	3-Cl	H	Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br
Me	3-Cl	H	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-CN	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
Me	3-F	H	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Me	OCF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	SCHF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Et	6-Cl	H	Et	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	SMe
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	SO <sub>2</sub> Me
Et	6-I	H	Me	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF <sub>3</sub>	Me
propargyl	6-Cl	H	Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
cyclopropyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 17



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Me	H	Et	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF <sub>2</sub>

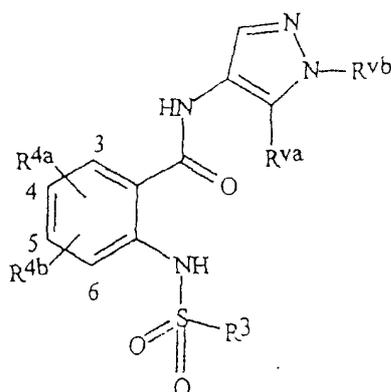
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	3-F	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Et	CHF <sub>2</sub>
Et	6-Br	4-Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	CBtF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	F	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-F	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

Table 18



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Me	H	Et	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CB <sub>r</sub> F <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Me	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

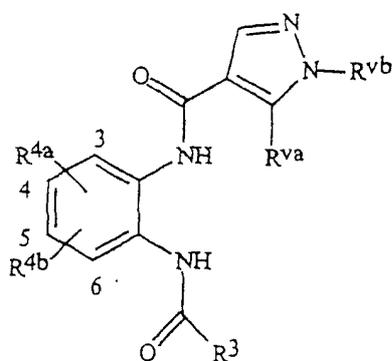
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	3-F	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Et	CHF <sub>2</sub>
Et	6-Br	4-Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	F	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-F	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

Table 19



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Me	5-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Me	H	Et	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	2-FPh	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>

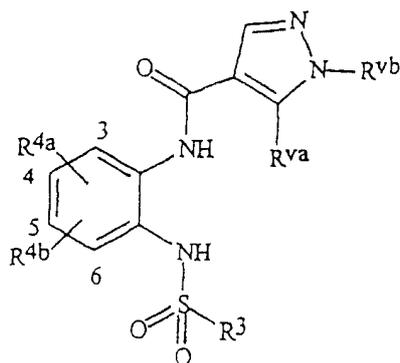
R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	3-F	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Et	CHF <sub>2</sub>
Et	6-Br	4-Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	F	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-F	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

Table 20



R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	5-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me'	3-Me	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> '-Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Me	H	Et	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu,	3-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	3-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Me	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
cyclopropyl	3-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	4-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> F

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Me	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	H	CHF <sub>2</sub>
Et	3-Br	5-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Br	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-CN	H	CF <sub>3</sub>	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	3-F	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Et	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	3-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF <sub>3</sub>
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
Me	6-Cl	H	Et	CHF <sub>2</sub>
Et	6-Br	4-Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Me	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF <sub>2</sub>
propargyl	6-Cl	H	Me	CBrF <sub>2</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	F	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-F	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu,	6-Cl	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	CF <sub>3</sub>	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

R <sup>3</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>va</sup>	R <sup>vb</sup>
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>
Me	6-Cl	H	H	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>
propargyl	6-Cl	H	Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
cyclopropyl	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-F	H	2-ClPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	2,6-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F <sub>2</sub> Ph	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F <sub>2</sub> Ph	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF <sub>2</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-pyridyl	CBrF <sub>2</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
propargyl	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>3</sub>
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

$R^3$	$R^{4a}$	$R^{4b}$	$R^{va}$	$R^{vb}$
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF <sub>2</sub> HCF <sub>2</sub>

### 本发明的生物学实施例

#### 剂型/应用

本发明的化合物一般与农业上适宜的载体一起作为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、湿度与温度相一致。有用的剂型包括液体如溶液(包括可乳化的浓缩物)、悬浮剂、乳液(包括微乳剂和/或悬浮剂)等等，它们可任选被粘稠成胶状物。有用的剂型也包括固体如粉剂、粉末、颗粒剂、片剂、丸剂、薄膜等，它们可以是水分散性的(“可湿的”)或水溶性的。有效成分可被(微)囊化，进一步制成悬浮剂或固体剂型；另外也可对有效成分的整个剂型进行胶囊化(或“外涂敷”)。成胶囊可以控制或延缓有效成分的释放。可喷雾剂型可在适当的介质中冲稀，使用的喷雾体积为每公顷大约1百至几百升。高浓度的组合物主要用作进一步配制的中间体。

这些剂型一般含有有效量的有效成分、稀释剂和表面活性剂，其中大约按以下范围，各组分含量总和为100%(重量计)。

	重量百分数		
	有效成分	稀释剂	表面活性剂
水分散性和水溶性颗粒剂、片剂和粉剂	5-90	0-94	1-15
悬浮剂、乳液、溶液(包括可乳化的浓缩物)	5-50	40-95	0-15
粉	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

典型的固体稀释剂在 Watkins 等人, *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey 中作了介绍。典型的液体稀释剂在 Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950 中作了介绍。*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, 列出了表面活性剂和推荐应用。所有剂型都可含有少量的添加剂, 以减少泡沫、结块、腐蚀、微生物的生长等, 或加增稠剂以增加粘度。

表面活性剂包括, 例如, 聚乙氧基化醇、聚乙氧基化烷基酚、聚乙氧基化脱水山梨糖醇脂肪酸酯、磺化丁二酸二烷基酯、硫酸烷基酯、烷基苯磺酸盐、有机聚硅氧烷、*N,N*-二烷基牛磺酸酯、木质素磺酸盐、萘磺酸盐甲醛缩合物、聚羧酸酯和聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物。固体稀释剂包括, 例如, 粘土如膨润土、蒙脱石、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、二甲亚砜、*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、酮类如环己酮、2-庚酮、异佛尔酮和 4-羟基-4-甲基-2-戊酮、和醇类如甲醇、环己醇、十二烷醇和四氢呋喃醇。

溶液, 包括可乳化的浓缩物, 可以通过简单地混合各组分制得。粉剂和细粉可通过混合和通常在捶磨或液能磨中通过研磨来制备。悬浮剂一般通过湿磨来制备; 参见, 例如, US 3,060,084。颗粒剂和丸剂通过将有效物质喷到预先制成的颗粒载体上或通过造粒技术来制备。参见 Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, 1967 年 12 月 4 日, 第 147-48 页、*Perry's Chemical Engineer's Handbook*,

4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963 第 8-57 页和随后部分, 以及 PCT 公开 WO 91/13546。丸剂的制备如 US 4,172,714 中所述。水分散性和水溶性颗粒剂如 US 4,144,050、US 3,920,442 和 DE 3,246,493 中教导制备。片剂可如 US 5,180,587、US 5,232,701 和 US 5,208,030 中教导制备。薄膜可按照 GB 2,095,558 和 US 3,299,566 中教导制备。

有关剂型技术的更多信息可参见 T.S. Woods, "The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks 和 T.R. Roberts 编辑, Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999 第 120-133 页。还参见 US 3,235,361 第 6 栏第 16 行至第 7 栏第 19 行和实施例 10-41; US 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; US 2,891,855 第 3 栏第 66 行至第 5 栏第 17 行和实施例 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York. 1961 第 81-96 页; 和 Hance 等, *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989。

在以下实施例中, 所有百分数均以重量计, 所有剂型都用常规方法制备。化合物号参见在索引表 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 7	10.0%
硅镁土颗粒(低挥发物, 0.71/0.30 mm; U.S.25-50 号筛)	90.0%

实施例 C挤压丸

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

实施例 D可乳化的浓缩物

化合物 7	20.0%
油状可溶性磺酸酯和聚氧乙基醚的混合物	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%

本发明的化合物的特征在于有利的新陈代谢和/或土壤残留物形

式，并显示对一定范围的农业和非农业无脊椎害虫的防治活性。(在本说明书的上下文中“无脊椎害虫防治”意思是抑制无脊椎害虫生长(包括致死)，从而显著减少其摄食量或减少害虫引起的其它损失；相关的表述定义类似。)正如本说明书中所述，术语“无脊椎害虫”包括具有经济重要性的节肢动物类、腹足动物类和线虫类害虫。术语“节肢动物”包括昆虫、螨、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、千足虫、球潮虫和综合纲。术语“腹足动物”包括蜗牛、鼻涕虫和其它柄眼目。术语“线虫”包括所有的寄生虫，例如：蛔虫、大恶丝虫和植食性线虫(线虫纲)、吸虫(Tematoda)、棘头纲和绦虫(多节绦虫亚纲)。本领域技术人员将理解，不是所有的化合物对所有害虫都有相等的药效。然而，本发明化合物显示了对经济上重要性的农业、林业、温室、苗圃、观赏植物、食物和纤维、公共卫生和动物保健、家庭和商用建筑、家用品、和贮藏产品的害虫的活性。这些包括鳞翅目的幼虫，例如夜蛾科的粘虫、切根虫、尺蠖和 heliothines(例如，草地粘虫(*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith)、甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua* Hubner)、小地老虎(*Agrotis ipsilon* Hufnagel)、粉纹夜蛾(*Trichoplusia ni* Hubner)、美洲夜烟蛾(*Heliothis virescens* Fabricius)); 螟蛾科的钻蛀虫、鞘蛾幼虫、结网毛虫、锥形虫、卷叶菜虫和雕叶虫(例如，欧洲玉米钻蛀虫(*Ostrinia nubilalis* Hubner)、脐橙螟(*Amyelois transitella* Walker)、玉米根结网毛虫(*Crambus caliginosellus* Clemens)、草地结网毛虫(*Herpetogramma licarsisalis* Walker)); 卷蛾科中的卷叶蛾、蚜虫、种子蠕虫、和水果蠕虫(例如，苹果蠹蛾(*Cydia pomonella* Linnaeus)、葡萄小食心虫(*Endopiza viteana* Clemens)、梨小食心虫(*Grapholita molesta* Busck)); 和许多其它经济上重要的鳞翅目(例如，菜蛾(*Plutella xylostella* Linnaeus)、红铃虫(*Pectinophora gossypiella* Saunders)、舞毒蛾(*Lymantria dispar* Linnaeus)); 蜚镰目的蛹和成虫，包括来自小蠊科和蠊科的(例如，东方蜚镰(*Blatta orientalis* Linnaeus)、亚洲蜚镰(*Blatella*

*asahinai* Mizukubo)、德国蜚镰(*Blattella germanica* Linnaeus)、长须蝼蛄(*Supella longipalpa* Fabricius)、美洲栗(*Periplaneta americana* Linnaeus)、褐色大蝼蛄(*Periplaneta brunnea* Burmeister)、马德拉蜚镰(*Leucophaea maderae* Fabricius)); 鞘翅目的食叶幼虫和成虫, 包括来自长脚象虫科、豆象科和象虫科的象鼻虫(例如, 棉籽象鼻虫(*Anthonomus grandis* Boheman)、稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel)、谷象(*Sitophilus granarius* Linnaeus)、米象(*Sitophilus oryzae* Linnaeus)); 叶甲科中的跳甲、黄瓜甲虫、根虫、叶虫、薯虫、和潜叶蛾(例如, 科罗拉多薯虫(*Leptinotarsa decemlineata* Say)、玉米根叶甲(*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); 来自金龟子科的金龟子和其它甲虫(例如, 日本金龟子(*Popillia Japonica* Newman)和欧洲金龟子(*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); 来自皮蠹科的红缘皮蠹; 来自叩头虫科的线虫; 来自刺胫小蠹科的树皮甲虫和来自拟步行虫科的粉甲虫。此外农业和非农业害虫包括: 革翅目的成虫和幼虫, 包括来自球螋科的螋螋(例如, 欧洲球螋(*Forficula auricularia* Linnaeus)、黑球螋(*Chelisoche morio* Fabricius)); 半翅目和同翅目的成虫和蛹, 例如, 来自盲蝽科的盲蝽、来自蝉科的蝉、来自大叶蝉科的叶蝉(例如微叶蝉亚种)、来自樗鸡科和飞虱科的樗鸡、来自角蝉科的角蝉、来自木虱科的木虱、来自粉虱科的粉虱、来自蚜科的蚜虫、来自根瘤蚜科的根瘤蚜、来自粉蚧科的水蜡虫、来自蚧科、盾蚧科和珠棉蚧亚科的介壳虫、来自网蝽科的网蝽、来自蝽象科的蝽象、来自长蝽科的麦长蝽(例如, 长蝽亚种)和其它实蝽、来自沫蝉科的沫蝉、来自缘蝽科的缘蝽、以及来自红蝽科的红蝽和红甲虫。还包括螨目的成虫和幼虫, 例如叶螨科的蛛螨和红蜘蛛(例如, 欧洲红蜘蛛(*Panonychus ulmi* Koch)、两斑纹蛛螨(*Tetranychus urticae* Koch)、麦克旦尼氏螨(*Tetranychus mcdanieli* McGregor))、细须螨科的 flat mites(例如, 桔短须螨(*Brevipalpus lewisi* McGregor))、瘿螨科的锈螨和芽螨以及其它食叶螨

和在人和动物健康中重要的螨，即表皮螨科的尘螨、蠕形螨科的毛囊螨、食甜螨科的干酪螨、蜱目的蜱(例如，鹿蜱(*Ixodes scapularis* Say)、澳洲瘫痪蜱(*Ixodes holocyclus* Neumann)、美洲犬蜱(*Dermacentor variabilis* Say)、美洲花蜱(*Amblyomma americanum* Linnaeus)以及痒螨科、蒲螨科和疥螨科的马痒螨和疥螨；直翅目的成虫和未成年虫，包括蚂蚱、蝗虫和蟋蟀(例如，迁徙蚂蚱(例如，*Melanoplus sanguinipes* Fabricius、*M. differentialis* Thomas)、美洲蚂蚱(例如，*Schistocerca americana* Drury)、沙漠蝗(*Schistocerca gregaria* Forskal)、飞蝗(*Locusta migratoria* Linnaeus)、家蟋蟀(*Acheta domesticus* Linnaeus)、蝼蛄(蝼蛄属亚种))；双翅目的成虫和未成年虫，包括潜叶蛾、蠓、果蝇(实蝇科)、瑞典杆蝇(例如，*Oscinella frit* Linnaeus)、土壤蛆、家蝇(例如，*Musca domestica* Linnaeus)、小加蝇(例如，*Fannia canicularis* Linnaeus、*F. femoralis* Stein)、厩螯蝇(例如，*Stomoxys calcitrans* Linnaeus)、秋家蝇、角蝇、丽蝇(例如，金蝇属亚种、伏蝇属亚种)、和其它蝇状飞虫(muscoid fly pests)、马蝇(例如，虻属亚种)、肤蝇(例如，马胃蝇属亚种、牛虻属亚种)、牛皮蝇(例如，下皮属亚种)、鹿虻(例如，斑虻属亚种)、羊蜱蝇(例如，*Melophagus ovinus* Linnaeus)和其它短角亚目、蚊子(例如，伊蚊属亚种、按蚊属亚种、库蚊属亚种)、黑蝇(例如，原蚋属亚种、蚋属亚种)、蠓、沙蝇、尖眼蕈蚊、和其它长角亚目；缨翅目的成虫和未成年虫，包括葱蓟马(*Thrips tabaci* Lindeman)和其它食叶蓟马；膜翅目的昆虫，包括蚂蚁(例如，红木蚁(*Camponotus ferrugineus* Fabricius)、黑木蚁(*Camponotus pennsylvanicus* De Geer)、厨蚁(*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)、铺道蚁(*Tetramorium caespitum* Linnaeus)、玉米田蚁(*Lasius alienus* Forster)、香家蚁(*Tapinoma sessile*

Say))、蜜蜂(包括木蜂)、大黄蜂、胡蜂和黄蜂;等翅目的昆虫,包括东美散白蚁(*Reticulitermes flavipes* Kollar)、西美散白蚁(*Reticulitermes hesperus* Banks)、台湾乳白蚁(*Coptotermes formosanus* Shiraki)、移栖楹白蚁(*Incisitermes immigrans* Snyder)和其它经济上重要的白蚁;缨尾目的昆虫,例如蠹虫(*Lepisma saccharina* Linnaeus)和家衣鱼(*Thermobia domestica* Packard);食毛目的昆虫并包括头虱(*Pediculus humanus capitis* De Geer)、体虱(*Pediculus humanus humanus* Linnaeus)、鸡体虱(*Menacanthus stramineus* Nitsch)、狗羽虱(*Trichodectes canis* De Geer)、食毛鸟虱(*Goniocotes gallinae* De Geer)、羊体虱(*Bovicola ovis* Schrank)、牛盲虱(*Haematopinus eurysternus* Nitsch)、犊长颚虱(*Linognathus vituli* Linnaeus)和其它攻击人和动物的吸和咬的寄生虱;蚤目的昆虫,包括东方鼠蚤(*Xenopsylla cheopis* Rothschild)、猫蚤(*Ctenocephalides felis* Bouche)、狗蚤(*Ctenocephalides canis* Curtis)、鸡蚤(*Ceratophyllus gallinae* Schrank)、禽毒蚤(*Echidnophaga gallinacea* Westwood)、人蚤(*Pulex irritans* Linnaeus)和其它折磨动物和鸟的蚤。包含的其它节肢动物害虫包括:蜘蛛目的蜘蛛,例如褐皮花蛛(*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik)和黑寡妇蜘蛛(*Latrodectus mactans* Fabricius),以及蜘蛛形目的蜈蚣,例如家蜘蛛(*Scutigera coleoptrata* Linnaeus)。本发明的化合物还对线虫纲、多节绦虫亚纲、吸虫纲和棘头纲的成员有活性,这些成员包括圆线虫目、蛔虫目、蛲虫目、杆状线虫目、旋尾目和嘴刺目的经济上重要的成员,例如但不限于经济上重要的农业害虫(即,根结线虫属的根癌线虫、草地垫刀线虫属的 lesion nematodes、根线虫属的鬃根线虫,等。)以及危害动物和人健康的害虫(即,所有经济上重要的吸虫、绦虫和蛔虫,例如马内的寻常圆线虫、狗内的犬弓首蛔虫、羊内的捻转血矛线虫、狗内的 *Dirofilaria immitis* Leidy、马内的叶形裸头绦虫、反刍动物内的肝片吸虫,等。)

本发明的化合物对以下害虫显示了特别高的活性：鳞翅目(例如，*Alabama argillacea* Hubner(棉叶波纹夜蛾)、*Archips argyrospila* Walker(果树卷叶虫)、*A. rosana* Linnaeus(欧洲卷叶虫)和其它黄卷蛾属种、*Chilo suppressalis* Walker(二化螟)、*Cnaphalocrosis medinalis* Guenee(稻纵卷叶螟)、*Crambus caliginosellus* Clemens(玉米根草螟)、*Crambus teterrellus* Zincken(早熟禾草螟)、*Cydia pomonella* Linnaeus(苹果蠹蛾)、*Earias insulana* Boisduval(棉斑实蛾)、*Earias vittella* Fabricius(棉斑实蛾)、*Helicoverpa armigera* Hbner (美洲棉铃虫)、*Helicoverpa zea* Boddie(玉米穗夜蛾)、*Heliothis virescens* Fabricius(美洲夜烟蛾)、*Herpetogramma licarsisalis* Walker(草皮结网毛虫)、*Lobesia botrana* Denis & Schiffermuller (葡萄小食心虫)、*Pectinophora gossypiella* Saunders(红铃虫)、*Phyllocnistis citrella* Stainton(桔细潜蛾)、*Pieris brassicae* Linnaeus(大菜粉蝶)、*Pieris rapae* Linnaeus(小菜粉蝶)、*Plutella xylostella* Linnaeus(菜蛾)、*Spodoptera exigua* Hubner(甜菜夜蛾)、*Spodoptera litura* Fabricius(斜纹夜蛾、cluster caterpillar)、*Spodopteraflugiperda* J. E. Smith(草地粘虫)、*Trichoplusia ni* Hubner (粉纹夜蛾)和 *Tuta absoluta* Meyrick(番茄潜叶蛾))。本发明的化合物还对来自同翅目的成员具有商业上显著的活性，这些同翅目成员包括：*Acyrtosiphon pisum* Harris (豌豆蚜)、*Aphis craccivora* Koch(豇豆蚜)、*Aphis fabae* Scopoli(豆蚜)、*Aphis gossypii* Glover(棉蚜、甜瓜蚜)、*Aphis pomi* De Geer(苹果蚜)、*Aphis spiraecola* Patch(绣线菊蚜)、*Aulacorthum solani* Kaltenbach(毛地黄蚜)、*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (草莓蚜)、*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko(俄罗斯小麦蚜)、*Dysaphis plantaginea* Paaserini(苹粉红劣蚜)、*Eriosoma lanigerum* Hausmann(苹绵蚜)、*Hyalopteruspruni* Geoffroy (梅大尾蚜)、*Lipaphis erysimi* Kaltenbach(萝卜蚜)、*Metopolophium dirrhodum* Walker(谷类蚜)、*Macrosipum euphorbiae* Thomas(马铃薯蚜)、*Myzus persicae* Sulzer(桃-

薯蚜、桃蚜)、*Nasonovia ribisnigri* Mosley(莴苣蚜)、天庖疮亚种(根蚜和缨蚜)、*Rhopalosiphum maidis* Fitch(玉米叶蚜)、*Rhopalosiphum padi* Linnaeus(粟缢蚜)、*Schizaphis graminum* Rondani(麦二叉蚜)、*Sitobion avenae* Fabricius(英国谷物蚜)、*Therioaphis maculata* Buckton(苜蓿斑翅蚜)、*Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe(桔二叉蚜)、和 *Toxoptera citricida* Kirkaldy(桔二岔蚜); 球蚜属亚种(球蚜); *Phylloxera devastatrix* Pergande(美核桃根瘤蚜); *Bemisia tabaci* Gennadius(菸草粉虱、棉粉虱)、*Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (银叶粉虱)、*Dialeurodes citri* Ashmead(桔粉虱)和 *Trialeurodes vaporariorum* Westwood(温室白粉虱); *Empoasca fabae* Harris (马铃薯微叶蝉)、*Laodelphax striatellus* Fallen(灰飞虱)、*Macrolestes quadrilineatus* Forbes(紫莞叶蝉)、*Nephotettix cincticeps* Uhler(大青叶蝉)、*Nephotettix nigropictus* Stal (黑尾叶蝉)、*Nilaparvata lugens* Stal (稻褐飞虱)、*Peregrinus maidis* Ashmead(菲岛玉米蜡蝉)、*Sogatella furcifera* Horvath(白背飞虱)、*Sogatodes orizicola* Muir(美洲稻飞虱)、*Typhlocyba pomaria* McAtee(苹白小叶蝉)、红斑叶蝉属亚种(葡萄二星斑叶蝉); *Magicidada septendecim* Linnaeus(十七年蟥); *Icerya purchasi* Maskell(吹棉蚧)、*Quadraspidotus perniciosus* Comstock(梨圆盾蚧); *Planococcus citri* Risso(桔粉蚧); 粉蚧属亚种(其它水蜡虫复合物); *Cacopsyllapyricola* Foerster(木虱)、*Trioza diospyri* Ashmead(柿木虱)。这些化合物也对来自半翅目的成员有活性, 这些成员包括: *Acrosternum hilare* Say(喜绿蝽)、*Anasa tristis* De Geer(南瓜缘蝽)、*Blissus leucopterus leucopterus* Say(麦长蝽)、*Corythuca gossypii* Fabricius(棉网蝽)、*Cyrtopeltis modesta* Distant(番茄蝽)、*Dysdercus suturellus* Herrich-Sch ffer (红甲虫)、*Euchistus servus* Say(褐臭蝽)、*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (一点褐蝽)、*Graptosthetus* 亚种(实蝽的复合物)、*Leptoglossus corculus* Say(松籽喙缘蝽)、*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (牧草盲蝽)、

*Nezara viridula* Linnaeus(稻绿蝽)、*Oebalus pugnax* Fabricius(美洲稻盾蝽)、*Oncopeltus fasciatus* Dallas (大马利筋长蝽)、*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter(棉跳盲蝽)。通过本发明化合物防治的其它昆虫目包括缨翅目(例如, *Frankliniella occidentalis* Pergande(苜蓿蓟马)、*Scirtothrips citri* Moulton(桔实蓟马)、*Sericothrips variabilis* Beach (大豆蓟马)、和 *Thrips tabaci* Lindeman(葱蓟马); 和鞘翅目(例如, *Leptinotarsa decemlineata* Say(科罗拉多薯虫)、*Epilachna varivestis* Mulsant(墨西哥豆瓢虫)和叩甲属(*Agriotes*)、叩甲属(*Athous*)或草金针虫属的金针虫)。

本发明的化合物也可与一种或多种其它生物活性化合物包括杀虫剂、杀真菌剂、杀线虫剂、杀细菌剂、杀螨剂、生长调节剂如根刺激剂、化学消毒剂、化学信息素、驱避剂、诱引剂、信息激素、摄食刺激剂、其它生物活性化合物或食虫菌、病毒或真菌混合形成多组分农药, 给出更广谱的农业保护作用。因此本发明的组合物还可以包括生物有效量的至少一种其它生物活性化合物或试剂。可与本发明化合物一起加工的这些生物活性化合物的实例是: 杀虫剂如阿维菌素、乙酰甲胺磷、吡虫清、齐墩螨素、艾扎丁、保棉磷、氟氯菊酯、联苯肼酯、噻嗪酮、呋喃丹、氟唑虫清、定虫隆、毒死蜱、甲基毒死蜱、chromafenozide、clothianidin、氟氯氰菊酯、 $\beta$ -氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、 $\lambda$ -氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、杀螨硫隆、二嗪农、氟脲杀、乐果、噁茂醚、emamectin、硫丹、高杀灭菊酯、ethiprole、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、啮螨酯、杀灭菊酯、锐劲特、flonicamid、氟氰戊菊酯、 $\tau$ -氟胺氰菊酯、氟虫脲、地虫磷、特丁苯酰肼、氟铃脲、吡虫啉、噁二唑虫、丙胺磷、氟丙氧脲、马拉硫磷、四聚乙醛、甲胺磷、杀扑磷、灭多虫、烯虫酯、甲氧滴滴涕、久效磷、甲氧苯酰肼、硝虫噻嗪、甲氧叉威、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、拒嗪酮、pyridalyl、

蚊蝇醚、鱼藤酮、艾克敌 105、乙丙硫磷、双苯酰肼、伏虫隆、七氟菊酯、特丁硫磷、杀虫畏、thiacloprid、thiamethoxam、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、敌百虫和杀虫隆；杀真菌剂如噻二唑素、腈菌酯、苯菌灵、杀稻瘟菌素-S、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、氧氯化铜、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-氧丙基)-4-甲基苯甲酰胺 (RH 7281)、双氯氰菌胺 (S-2900)、啞菌清、氯硝胺、噁醚唑、(S)-3, 5-二氢-5-甲基-2-(甲硫基)-5-苯基-3-(苯氨基)-4H-咪唑-4-酮 (RP 407213)、烯酰吗啉、dimoxystrobin、烯唑醇、烯唑醇-M、多果定、敌瘟磷、氧唑菌、噁唑酮菌、fenamidone、氯苯嘧啶醇、腈苯唑、fencaramid (SZX0722)、拌种咯、苯锈啶、丁苯吗啉、薯瘟锡、毒菌锡、氟啶胺、咯菌腈、氟联苯菌(RPA 403397)、氟啶唑、氟硅唑、氟酰胺、粉唑醇、灭菌丹、三乙膦酸铝、呋霜灵、呋吡唑灵(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、代森锰锌、代森锰、mefenoxam、灭锈胺、甲霜灵、叶菌唑、又氨苯酰胺(SSF-126)、腈菌唑、田安(甲腈酸铁)、恶霜灵、戊菌唑、戊菌隆、烯丙苯噻唑、咪鲜胺、霜霉威、丙环唑、啞斑肱、pyraclostrobin、二甲嘧菌胺、咯啶酮、啶氧灵、螺噁茂胺、硫磺粉、戊唑醇、四氟醚唑、噻菌灵、噻呋酰胺、甲基硫菌灵、福美双、tiadinil、三唑酮、三唑醇、三环唑、肱菌酯、灭菌唑、有效霉素和乙烯菌核利；杀线虫剂如涕灭威、甲氨叉威和克线磷；杀细菌剂如链霉素；杀螨剂如杀螨脒、灭螨猛、乙酯杀螨醇、三环锡、开乐散、除螨灵、特苯噁唑、啶螨醚、杀螨锡、甲氰菊酯、啶螨酯、噻螨酮、克螨特、啞螨酮和吡螨胺；和生物制剂如苏云金杆菌，包括鮎泽亚种和库尔斯塔克亚种，苏云金杆菌 $\delta$ 毒素、杆状病毒以及食虫细菌、病毒和真菌。

有关这些农业保护剂的常规参考文献是 *The Pesticide Manual*, 第

12 版, C. D. S. Tomlin 出版, British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2000。

其中重要的组合物包括(除了式 I 组份和任意表面活性剂和/或稀释剂之外)至少一种选自以下的生物活性化合物或试剂: 阿维菌素、乙酰甲胺磷、吡虫啉、amidoflument、齐墩螨素、艾扎丁、保棉磷、氟氯菊酯、联苯肼酯、噻嗪酮、呋喃丹、氟啉虫啉、定虫隆、毒死蜱、甲基毒死蜱、chromafenozide、clothianidin、氟氯氰菊酯、 $\beta$ -氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、 $\lambda$ -氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、灭蝇胺、溴氰菊酯、杀螨硫隆、二嗪农、氟脲杀、乐果、噁茂醚、emamectin、硫丹、高杀灭菊酯、ethiprole、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、杀灭菊酯、锐劲特、flonicamid、氟氰戊菊酯、 $\tau$ -氟胺氰菊酯、氟虫脲、地虫磷、特丁苯肼、氟铃脲、吡虫啉、噁二唑虫、丙胺磷、氟丙氧脲、马拉硫磷、四聚乙醛、甲胺磷、杀扑磷、灭多虫、烯虫酯、甲氧滴滴涕、久效磷、甲氧苯酰肼、硝虫噻嗪、甲氨基威、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、拒嗪酮、pyridalyl、蚊蝇醚、鱼藤酮、艾克敌 105、乙丙硫磷、双苯酰肼、伏虫隆、七氟菊酯、特丁硫磷、杀虫畏、thiacloprid、thiamethoxam、硫双威、杀虫双、四溴菊酯、敌百虫和杀虫隆、涕灭威、甲氨基威、克线磷、杀螨脒、灭螨猛、乙酯杀螨醇、三环锡、开乐散、除螨灵、特苯噁唑、啞螨醚、杀螨锡、甲氰菊酯、啞螨酯、噻螨酮、克螨特、啞螨酮、吡螨胺; 苏云金杆菌, 包括鮎泽亚种和库尔斯塔克亚种, 苏云金杆菌 $\delta$ 毒素、杆状病毒以及食虫细菌、病毒和真菌。

用于与本发明化合物混合的优选的杀虫剂和杀螨剂包括拟除虫菊酯类, 如氯氰菊酯、氯氟氰菊酯、氟氯氰菊酯、 $\beta$ -氟氯氰菊酯, 高杀灭菊酯、杀灭菊酯和四溴菊酯; 氨基甲酸酯类如苯硫威、灭多虫、甲氨基威和硫双灭多虫; 类烟碱类如噁虫胺、吡虫啉和噁虫啉; 神经钠通道阻断剂如噁二唑虫、杀虫的大环内酯如艾克敌 105、阿维菌素、齐墩螨素和 emamectin;  $\gamma$ -氨基丁酸(GABA)拮抗剂如硫丹、ethiprole

和锐劲特；杀虫的脲类如氟虫脲和杀虫隆；保幼激素模拟物如噁茂醚和蚊蝇醚；拒嗉酮；和虫螨脲。用于与本发明化合物混合的优选生物制剂包括苏云金杆菌和苏云金杆菌 $\delta$ 毒素以及天然存在和遗传改性的病毒杀虫剂，包括杆状病毒类以及食虫真菌。

最优选的混合物包括本发明化合物与氟氯氰菊酯的混合物；本发明化合物与 $\beta$ -氯氟氰菊酯的混合物；本发明的化合物与高杀灭菊酯的混合物；本发明的化合物与灭多虫的混合物；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；本发明化合物与锐劲特的混合物；本发明化合物与氟虫脲的混合物；本发明化合物与蚊蝇醚的混合物；本发明化合物与拒嗉酮的混合物；本发明化合物与虫螨脲的混合物；本发明化合物与苏云金杆菌的混合物和本发明化合物与苏云金杆菌 $\delta$ 毒素的混合物。

在某些情况下，和其它具有类似的防治谱，但作用方式不同的无脊椎害虫防治化合物或试剂混合将特别有利于抗性管理。因此，本发明的化合物还可以包括生物有效量的至少一种具有类似防治谱，但作用方式不同的其它无脊椎害虫防治化合物或试剂。将生物有效量的本发明化合物与经基因改性以表达植物保护化合物(例如蛋白质)的植物或该植物的部位接触，也可以提供更广谱的植物保护并有利于抗性管理。

在农业和非农业领域，通过将一种或多种有效量的本发明化合物施加于无脊椎害虫的环境（包括农业和/或非农业的害虫侵染地）、施用于被保护的区域，或者直接施用于被防治的害虫上，都可以防治无脊椎害虫。因此，本发明进一步包括一种防治农业和/或非农业领域中无脊椎害虫的方法，该方法包括用有效量的一种或多种本发明的化合物，或者用含有至少一种这种化合物的组合物或含有至少一种这种化合物和有效量的至少一种其它生物活性化合物或试剂的组合物与

这些无脊椎害虫或其环境接触。包括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试剂的适宜组合物的实例包括颗粒组合物，其中其它生物活性化合物存在于与本发明化合物相同的颗粒上，或者存在于于本发明化合物颗粒分开的颗粒上。

接触的优选方法是喷雾。此外，含有本发明化合物的颗粒组合物可施用于植物的叶面或土壤。本发明的化合物还通过以液体剂型进行土壤浸湿、以颗粒剂型用于土壤、在移植中用于护理盒处理或浸渍，将植物与含有本发明化合物的组合物接触，经植物摄取有效地供给。通过将含有本发明化合物的组合物局部施用到侵染部位也可以发挥化合物的效力。其它接触方法包括通过直接或滞留喷雾、飞机喷洒、凝胶、种子包衣、微胶囊化、全身性摄入、饵、耳标、丸剂、迷雾器、熏蒸剂、气雾剂、粉剂和许多其它方式施用本发明的化合物或组合物。本发明的化合物也可掺入制备无脊椎害虫防治设备(例如昆虫网捕)的材料中。

本发明化合物可掺入无脊椎害虫消耗的饵剂中或例如捕获器等设备中。含有 0.01-5%活性组分，0.05-10%保水剂和 40-99%蔬菜粉的颗粒或饵剂以非常低的施用比率防治土壤昆虫是有效的，特别是对于通过消化而不是通过直接接触致死的活性组分的剂量。

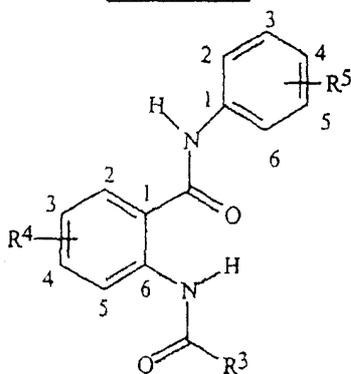
本发明的化合物可以它们的纯净状态被施用，但最普遍使用的是含有一种或多种化合物与适当的载体、稀释剂和表面活性剂的剂型，并可以与食品混合，这取决于预期的最终用途。优选的施用方法包括喷洒化合物的水分散液或精炼油溶液。与喷雾油、喷雾油浓制剂、铺展增稠剂、助剂、其它溶剂和增效剂如胡椒基丁醚一起，常常可提高化合物的功效。

有效防治所需的施药量(即“生物有效量”)取决于以下因素：被防治的无脊椎害虫的品系、害虫的生命周期、生命阶段、它的大小、地点、一年中的时期、寄生作物或动物、喂饲行为、交配行为、空气湿度、温度等。在通常环境下，每公顷大约 0.01-2 kg 有效成分的施

药量对农业生态系统中的害虫防治是足够的，但少至 0.0001 kg/公顷可能是有效的，或多至 8 kg/公顷可能是需要的。对于非农业应用，有效使用量范围是大约 1.0-50 mg/m<sup>2</sup>，但少至 0.1 mg/m<sup>2</sup>可能是有效的，或多至 150 mg/m<sup>2</sup>可能是需要的。本领域技术人员可以容易地确定对所需的无脊椎害虫的防治水平所需的生物有效量。

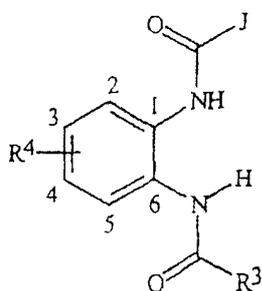
本发明生物学实施例的以下试验表明了本发明方法防止特定无脊椎害虫妨害植物的功效。“防治功效”代表对无脊椎害虫发育的抑制(包括死亡)，抑制会引起明显的摄食减少。由这些化合物产生的害虫防治保护并不限于这些品系。关于化合物的说明见索引表 A。在该索引表中采用的缩写如下：t 是叔，n 是正，i 是异，s 是仲，c 是环，Me 是甲基，Et 是乙基，Pr 是丙基，Bu 是丁基；因此 i-Pr 是异丙基，s-Bu 是仲丁基等。缩写“Ex.”代表“实施例”，其后跟着的数字表示化合物在该实施例中制备。

索引表 A



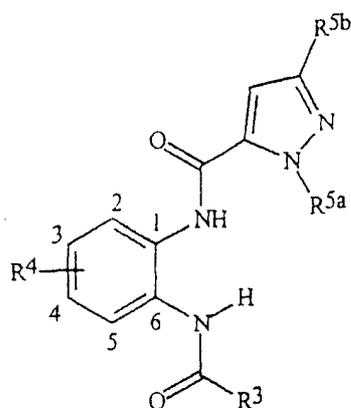
化合物	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	熔点 °C
1	<i>t</i> -Bu	H	2,3- <i>di</i> Me	208-209
2	<i>i</i> -Pr	H	4-OCF <sub>3</sub>	160-161
3 (Ex. 4)	<i>i</i> -Pr	5-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	230-233
4	Me	5-Me	4-OCF <sub>3</sub>	224-225
5	Me	5-Me	2-Me,4-Cl	114-116
6	<i>i</i> -Pr	5-Cl	2-Me,4-Cl	>250
7 (Ex. 3)	<i>i</i> -Pr	2-Me	2-Me,4-OCF <sub>3</sub>	230
8	<i>t</i> -Bu	2-Me	2-Me,4-OCF <sub>3</sub>	200-203
9 (Ex. 2)	<i>i</i> -Pr	2-Me	2-Me,4-CF <sub>3</sub>	230
10	<i>i</i> -Pr	5-NO <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	Solid
11	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Me	2-Me	>250

## 索引表 B



化合物	$R^3$	$R^4$	J	熔点 $^{\circ}\text{C}$
12	<i>t</i> -Bu	H	2,3- <i>di</i> Me-Ph	161-164
13	<i>t</i> -Bu	H	2-CF <sub>3</sub> -Ph	173-174
14	<i>i</i> -Pr	H	2,4-F-Ph	148
15	<i>i</i> -Pr	H	2,3- <i>di</i> Me-Ph	169-171
16	<i>t</i> -Bu	H	2,4- <i>di</i> F-Ph	146-149
17	<i>i</i> -Pr	5-Me	2,3- <i>di</i> Me-Ph	202-205
18	<i>i</i> -Pr	5-Me	2,6- <i>di</i> Cl-Ph	230
19	<i>i</i> -Pr	5-Me	2,4- <i>di</i> F-Ph	196
20	Me	H	2-F-Ph	固体
21	<i>i</i> -Pr	5-Cl	2-Me,4-Cl,6-NC(O)CF <sub>3</sub>	203
22	<i>i</i> -Pr	5-Cl	2-Me,4-Cl,6-NC(O)CH <sub>3</sub>	>250
23	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	固体
24	<i>t</i> -Bu	5-Me	2-F,5-CF <sub>3</sub> -Ph	固体
25	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	固体
26	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-OCF <sub>3</sub> -Ph	固体
27	<i>i</i> -Pr	5-Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	固体
28	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	固体
29	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	固体
30	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-OCF <sub>3</sub> -Ph	固体
31	<i>i</i> -Pr	5-Me	2-F,5-CF <sub>3</sub> -Ph	固体
32	<i>i</i> -Pr	5-Me	4-OCF <sub>3</sub> -Ph	固体
33	<i>i</i> -Pr	5-Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	固体
34	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	固体

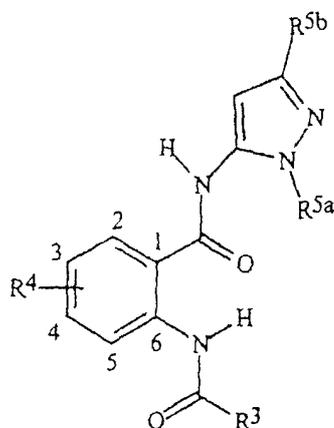
## 索引表 C



化合物	<u>R<sup>3</sup></u>	<u>R<sup>4</sup></u>	<u>R<sup>5a</sup></u>	<u>R<sup>5b</sup></u>	熔点 °C
35 (Ex. 1)	<i>i</i> -Pr	5-Me	2-Cl-Ph	CF <sub>3</sub>	Solid
36	Me	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	204-205
37 (Ex. 6)	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	219-220
38	NHEt	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	185-186
39	NH <i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	191-192
40	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	205-206
41	Me	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	201-202
42	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	229-230
43	NHEt	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	187-188
44	NH <i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	195-196
45	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	201-202
46	Me	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	176-177
47	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	237-238
48	NHEt	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	176-177
49	NH <i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	192-193
50	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	196-197
51	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	190-191
52	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	185-186
53 (Ex. 5)	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	215-217
54	Me	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	167-168

其中, pyridyl 为吡啶基

## 索引表 D



化合物	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5a</sup>	R <sup>5b</sup>	熔点 °C
55	Me	5-Me	2-Cl-Ph	CF <sub>3</sub>	194-195
56	<i>i</i> -Pr	5-Me	2-Cl-Ph	CF <sub>3</sub>	244-246
57	<i>t</i> -Bu	5-Me	2-Cl-Ph	CF <sub>3</sub>	260
58	Et	5-Me	2-Cl-Ph	CF <sub>3</sub>	236-237
59	<i>i</i> -Pr	2-Me	2-Cl-Ph	CF <sub>3</sub>	203-205
60	<i>t</i> -Bu	2-Me	2-Cl-Ph	CF <sub>3</sub>	232-233
61	Et	2-Me	2-Cl-Ph	CF <sub>3</sub>	170-172
62	Me	2-Me	2-Cl-Ph	CF <sub>3</sub>	212-213
63	Me	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	192-193
64	Me	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	236
65 (Ex. 7)	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF <sub>3</sub>	198

其中, pyridyl 为吡啶基

## 本发明的生物实施例

## 试验

为了评价对菜蛾(*Plutella xylostella*)的防治, 试验单元由小开口容器组成, 其中装有 12-14-天大的萝卜植物。预先对该单元进行侵染: 用核芯取样器从生长有许多幼虫的硬化害虫饲料薄片上取下一芯杆, 其上的害虫饲料带有 10-15 只婴幼儿虫, 将带有幼虫和饲料的芯杆转移

到试验单元。随着饲料芯杆的干透，幼虫转移到试验植物上。

除非另有说明，试验化合物被配制成一溶液，其中含有 10%丙酮、90%水和 300 ppm 含有烷基芳基聚氧乙烯、游离脂肪酸、二醇和异丙醇的 X-77® Spreader Lo-Foam Formula 非离子表面活性剂(Loveland Industries, Inc.)。将经配制的化合物以 1 mL 液体的形式，通过 SUJ2 雾化喷嘴喷出，其中 1/8JJ 通体(Spraying Systems Co.)被固定在每个试验单元的顶部上方 1.27 cm(0.5 英寸)处。本筛选中的所有试验化合物都以 50 ppm 喷雾，重复 3 次。将配制的试验化合物喷洒之后，将每个试验单元干燥 1 小时，然后将一个黑色筛帽放于上面。这些试验单元在 25°C 和 70%相对湿度的生长室内保持 6 天。然后目测植物受到的侵食危害。

以下试验的化合物提供了优异的植物保护水平 (30%或更低的侵食危害): 11, 37, 39, 43, 47, 48, 51, 52, 53 和 63。