

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 02816049.5

[51] Int. Cl.

C07D 401/04 (2006.01)

C07C 311/21 (2006.01)

C07C 311/16 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 41/06 (2006.01)

[45] 授权公告日 2009 年 8 月 19 日

[11] 授权公告号 CN 100528862C

[22] 申请日 2002.8.13 [21] 申请号 02816049.5

[30] 优先权

[32] 2001.8.15 [33] US [31] 60/312,423

[86] 国际申请 PCT/US2002/026959 2002.8.13

[87] 国际公布 WO2003/016300 英 2003.2.27

[85] 进入国家阶段日期 2004.2.16

[73] 专利权人 纳幕尔杜邦公司

地址 美国特拉华州

[72] 发明人 B·L·芬克尔斯泰因

G·P·拉姆 T·P·塞尔比

T·M·斯蒂芬森

[56] 参考文献

CN1225638A 1997.7.4

EP0289879A 1988.11.9

WO9605170A1 1996.2.22

审查员 张 锐

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 李连涛 谭明胜

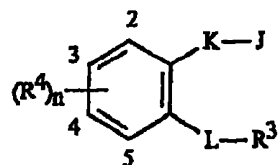
权利要求书 2 页 说明书 126 页

[54] 发明名称

用于控制无脊椎害虫的邻位取代的芳基酰胺化合物

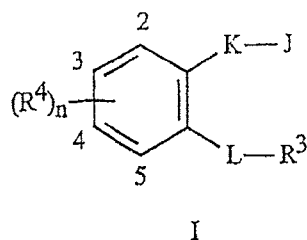
[57] 摘要

本申请公开了式 I 化合物及其 N-氧化物和农业上合适的盐, 其中 J 是苯环, 5-或 6-元杂芳环或芳族 8-、9-或 10-元稠合碳二环或杂二环环系, 其中每个环或环系被 1-4 个独立地选自 R⁵ 的取代基取代; 且 A、B、G、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 n 如说明书中所定义。本申请还公开了防治无脊椎害虫的方法, 包括将害虫或其环境与生物有效量的式 (I) 化合物和含有式 (I) 化合物的组合物接触。



(I)

1. 式 I 化合物:



其中

J 是苯环或者吡唑环, 其被 1-2 个独立地选自 R^5 的取代基取代;

K 是 $—NR^1C(=A)—$;

L 是 $—SO_2NR^2—$;

A 为 O;

R^1 是 H;

R^2 是 H 或 C_1-C_6 烷基;

R^3 是 C_1-C_6 烷基;

R^4 在 K-J 部分的邻位、苯环的 2-位连接在式 I 的其余部分上, 并选自 C_1-C_3 烷基、 CF_3 和卤素,;

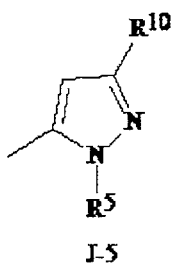
每个 R^5 独立地为 H、 C_1-C_6 卤代烷基、卤素或 C_1-C_4 卤代烷氧基; 或者每个 R^5 独立地为苯基或吡啶环, 每个环任选被 1-3 个独立地选自 R^9 的取代基取代;

每个 R^9 独立地为卤素; 和

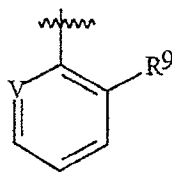
n 是 1。

2. 权利要求 1 的化合物, 其中

J 是 J-5,



R^5 是



;

V 是 N、CH、CF、CCl、CBr 或 Cl; 和

R¹⁰ 是 C₁-C₆ 卤代烷基或卤素。

3. 权利要求 2 的化合物, 其中 V 是 N。

4. 权利要求 2 的化合物, 其中 V 是 CH、CF、CCl 或 CBr。

5. 权利要求 3 或权利要求 4 的化合物, 其中

R¹⁰ 是 CF₃ 或卤素。

6. 权利要求 1 的化合物, 其中所述化合物是

1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[2-甲基-6-[[(1-甲基乙基) 氨基] 磺酰基] 苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-甲酰胺。

7. 防治无脊椎害虫的方法, 包括将无脊椎害虫或其环境与生物有效量的权利要求 1 的化合物接触。

8. 用于防治无脊椎害虫的组合物, 其中包含生物有效量的权利要求 1 的化合物与至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的另外的组分。

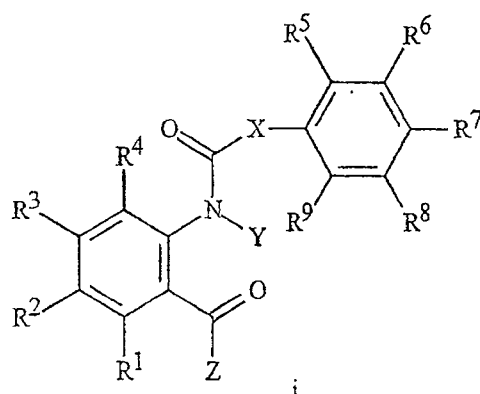
用于控制无脊椎害虫的邻位取代的芳基酰胺化合物

发明背景

本发明涉及适于包括下文列出的农业和非农业应用的一些邻位取代的芳基酰胺化合物、其 N-氧化物、盐和组合物，以及在农业和非农业环境中使用它们来控制无脊椎害虫的方法。

控制无脊椎害虫对于获得高农作物产量极其重要。无脊椎害虫对生长和贮藏的农作物的破坏可引起生产率显著降低，并由此导致消费者的费用增加。在林业、温室作物、观赏植物、苗圃作物、贮藏的食品以及纤维制品、牲畜、家庭、公众和动物健康中控制无脊椎害虫也很重要。对此有很多市售产品，但是仍然不断地需要更有效、成本更低、毒性更低、对于环境更安全或具有不同作用方式的新化合物。

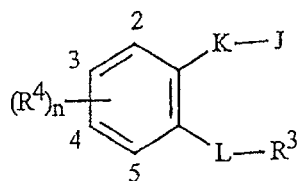
NL 9202078 公开了用作杀虫剂的式 i 的 N-酰基邻氨基苯甲酸衍生物



其中 X 是一个键；Y 是 H 或 C₁-C₆ 烷基；Z 是 NH₂、NH (C₁-C₃ 烷基) 或 N (C₁-C₃ 烷基)₂；且 R¹ - R⁹ 独立地为 H、卤素、C₁-C₆ 烷基、苯基、羟基、C₁-C₆ 烷氧基或 C₁-C₇ 酰氧基。

发明概述

本发明涉及式 I 化合物及其 N-氧化物和盐



I

其中

J 是苯环, 5-或 6-元杂芳环或芳族 8-, 9-或 10-元稠合碳二环或杂二
环环系, 其中每个环或环系被 1-4 个独立地选自 R^5 的取代基取代;

K 是 $-\text{NR}^1\text{C}(=\text{A})-$ 、 $-\text{N}=\text{C}(\text{GR}^6)-$ 或 $-\text{NR}^1\text{SO}_2-$;

L 是 $-\text{C}(=\text{B})\text{NR}^2-$ 、 $-\text{C}(\text{GR}^6)=\text{N}-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^2-$ 、 $-\text{C}(=\text{B})\text{O}-$ 或
 $-\text{C}(=\text{B})-$;

A 和 B 独立地为 O、S、 NR^8 、 NOR^8 、 $\text{NN}(\text{R}^8)_2$ 、 $\text{S}=\text{O}$ 、 $\text{N}-\text{CN}$ 或 $\text{N}-\text{NO}_2$; 每
个 G 独立地为 O、S 或 NR^8 ;

R^1 是 H; 或 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基或 C_3-C_6 环烷基, 所述基
团分别可任选被一个或多个独立地选自下列的取代基取代: 卤素、
 CN 、 NO_2 、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、
 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基
氨基和 C_3-C_6 环烷基氨基; 或者

R^1 是 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基或 C_3-C_8 二
烷基氨基羰基;

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

R^3 是 H; C_1-C_4 烷氧基; C_1-C_4 烷基氨基; C_2-C_8 二烷基氨基; C_3-C_6 环烷基
氨基; C_2-C_6 烷氧基羰基或 C_2-C_6 烷基羰基; 或 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、
 C_2-C_6 炔基或 C_3-C_6 环烷基, 所述基团分别可任选被一个或多个独立
地选自下列的取代基取代: 卤素、 CN 、 NO_2 、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4
卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、
 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基和苯基、
苯氧基或 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环可任选被 1-3 个独立地选
自 R^9 的取代基取代; 或者

R^2 和 R^3 可以与和它们所连接的氮一起形成包含 2-6 个碳原子和任选一

个选自氮、硫和氧的另外的原子的环,所述环可任选被1-4个独立地选自下列的取代基取代: C_1-C_2 烷基、卤素、CN、 NO_2 和 C_1-C_2 烷氧基;

每个 R^4 独立地为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 卤代烯基、 C_2-C_6 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、 NO_2 、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基或 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基;或者

每个 R^4 独立地为苯基、苄基或苯氧基环,所述每个环可任选被1-3个独立地选自 R^9 的取代基取代;

每个 R^5 独立地为H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 卤代烯基、 C_2-C_6 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基、 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基;或者

每个 R^5 独立地为苯基、苄基、苯甲酰基、苯氧基或5-或6-元杂芳环,或芳族8-、9-或10-元稠合杂二环环系,所述每个环或环系可任选被1-3个独立地选自 R^9 的取代基取代;或者

当连接在相邻碳原子上时, $(R^5)_2$ 可一起形成 $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ 或 $-OCF_2CF_2O-$;

每个 R^6 独立地为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基,所述基团分别可任选被一个或多个独立地选自下列的取代基取代:卤素、CN、 C_1-C_4 烷氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、(C_3-C_6 三烷基甲硅烷基) C_1-C_2 烷氧基或 R^7 ; C_3-C_6 环烷基; C_2-C_6 烷基羰基; C_2-C_6 烷氧基羰基; C_2-C_6 烷基氨基羰基; C_3-C_8 二烷基氨基羰基; C_1-C_4 烷基磺酰基; C_1-C_4 卤代烷基磺酰基或 C_3-C_9 三烷基甲硅烷基;或者

每个 R^6 独立地为苯环或5-或6-元杂芳环,所述每个环可任选被1-3个独立地选自 R^9 的取代基取代;

每个 R^7 独立地为苯基、苄氧基或 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自 R^9 的取代基取代;

每个 R^8 独立地为 H; C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基, 所述基团分别可任选被一个或多个独立地选自下列的取代基取代: 卤素、CN、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基或 R^7 ; C_3-C_6 环烷基; C_2-C_6 烷基羰基; C_2-C_6 烷氧基羰基; C_2-C_6 烷基氨基羰基; C_3-C_8 二烷基氨基羰基或 C_3-C_9 三烷基甲硅烷基; 或者

每个 R^8 独立地为苯环或 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自 R^9 的取代基取代;

每个 R^9 独立地为 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 卤代烯基、 C_2-C_4 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酸基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_4-C_8 (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; 且

n 是 1-4;

条件是: 当 K 是 $-NR^1C(=A)-$, 且 A 是 O 或 S 时, L 不是 $-C(=O)NR^2-$ 或 $-C(=S)NR^2-$ 。

本发明还涉及控制无脊椎害虫的方法, 包括将无脊椎害虫或其环境与生物有效量的式 I 化合物、其 N-氧化物或合适的盐 (例如以本文所述组合物的形式) 接触。本发明还涉及这样的方法, 其中是将无脊椎害虫或其环境与生物有效量的式 I 化合物、其 N-氧化物或合适的盐或包含式 I 化合物、其 N-氧化物或合适的盐的组合物和生物有效量的至少一种用于控制无脊椎害虫的另外的化合物或活性剂接触。

本发明还涉及用于控制无脊椎害虫的组合物, 其中包含生物有效量的式 I 化合物、其 N-氧化物或合适的盐与至少一种选自表面活性剂、固体稀释剂和液体稀释剂的另外的组分。本发明还涉及包含生物有效量的式 I 化合物、其 N-氧化物或合适的盐与有效量的至少一种另外的生物活性化合物或活性剂的组合物。

发明详述

在上面的叙述中, 单独使用或者在复合词例如 “烷硫基” 或 “卤

代烷基”中使用的“烷基”包括直链或支链烷基，例如甲基、乙基、正丙基、异丙基或不同的丁基、戊基或己基异构体。“烯基”包括直链或支链烯烃，例如1-丙烯基、2-丙烯基和不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。“烯基”还包括多烯例如1,2-丙二烯基和2,4-己二烯基。“炔基”包括直链或支链炔烃例如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。“炔基”还可以包括由多个三键构成的基团例如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。“烷硫基”包括直链或支链烷硫基，例如甲硫基、乙硫基以及不同的丙硫基和丁硫基异构体。“环烷基”包括例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。“三烷基甲硅烷基”包括 $(\text{CH}_3)_3\text{Si}$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_3\text{Si}$ 和 $[(\text{CH}_3)_3\text{C}](\text{CH}_3)_2\text{Si}$ 。

术语“芳族”是指每个环原子基本上在同一平面中，并且具有与环平面垂直的p-轨道，有 $(4n + 2)$ 个 π 电子参与环以符合Hückel's规则，其中 n 是0或正整数。术语“芳环系”是指全不饱和碳环和杂环，其中多环环系当中至少有一个环是芳环。芳族碳环或稠合碳二环环系包括全芳族碳环以及其中多环环系当中至少有一个环是芳环的碳环（例如苯基、萘基和1,2,3,4-四氢萘基）。术语“非芳族碳环”是指全饱和碳环以及其中环不符合Hückel规则的部分或全不饱和碳环。在与环或环系结合使用时，术语“杂”是指这样的环或环系，其中至少一个环原子不是碳，并且可含有1-4个独立地选自氮、氧和硫的杂原子，条件是：每个环含有不超过4个氮原子，不超过2个氧原子，以及不超过2个硫原子。术语“杂芳环或环系”和“芳族稠合杂二环环系”包括全芳族杂环以及其中多环环系当中至少有一个环是芳环的杂环（其中芳族是指满足Hückel规则）。术语“非芳族杂环或环系”是指全饱和杂环以及其中环系中的任何环都不满足Hückel规则的部分或全不饱和杂环。杂环或环系可通过置换碳或氮上的氢而经由任何可利用的碳或氮来连接。

单独使用或者在复合词例如“卤代烷基”中使用的术语“卤素”是指氟、氯、溴或碘。此外，当在复合词例如“卤代烷基”中使用时，所述烷基可以被可相同或不同的卤素原子部分或完全取代。“卤代烷基”的实例包括 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 和 CF_3CCl_2 。术语“卤代烯基”、

“卤代炔基”、“卤代烷氧基”等的定义类似于术语“卤代烷基”。

“卤代烯基”包括 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ 。“卤代炔基”的实例包括 $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 和 $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 。“卤代烷氧基”的实例包括 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。

“烷基羰基”的实例包括 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 和 $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 。“烷氧基羰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ 和不同的丁氧基羰基或戊氧基羰基异构体。“烷基氨基羰基”的实例包括 $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ 和不同的丁基氨基羰基或戊基氨基羰基异构体。“二烷基氨基羰基”的实例包括 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})$ 。

取代基中的碳原子总数目是用前缀“ $\text{C}_i\text{-C}_j$ ”表示的，其中 i 和 j 是 1-8 的整数。例如， $\text{C}_1\text{-C}_3$ 烷基磺酰基是指甲基磺酰基至丙基磺酰基； C_2 烷氧基烷基是指 CH_3OCH_2 ； C_3 烷氧基烷基是指例如 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 或 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ ； C_4 烷氧基烷基是指被含有总共 4 个碳原子的烷氧基取代的烷基的各种异构体，例如包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。

在上面的叙述中，当式 I 化合物含有杂环时，所有取代基是通过置换碳或氮上的氢而经由任何可利用的碳或氮连接在该环上。

当化合物被带有表明所述取代基的数目可超过 1 的下标的取代基取代时，所述取代基（当它们超过 1 时）是独立地选自所定义的取代基。此外，当下标指示一个范围，例如 $(\text{R})_{i-j}$ 时，则取代基数目可选自介于 i 与 j 之间，并包括 i 与 j 的整数。

术语“任选被取代”是表示该基团未被取代或被取代。术语“任选被 1-3 个取代基取代”等是表示该基团上有 1-3 个可被取代的位置可以被取代。当基团含有可以是氢的取代基例如 R^1 或 R^5 时，则当该取代基是氢时，应当认识到这相当于所述基团未被取代。

本发明化合物可以作为一种或多种立体异构体存在。各种立体异构体包括对映体、非对映体、阻转异构体和几何异构体。本领域技术人员应当认识到，当相对于其它立体异构体是富集的时或者当与其它立体异构体分离时，一种异构体可具有更强的活性和/或可表现出有

益作用。此外，本领域技术人员知道如何分离、富集和/或选择性地制备所述立体异构体。因此，本发明化合物可作为立体异构体的混合物、单独的立体异构体或旋光形式存在。某些本发明化合物可作为一种或多种互变异构体存在，并且这样的化合物的所有互变异构形式都是本发明一部分。因此，本发明化合物可作为互变异构体混合物或者单独的互变异构体存在。

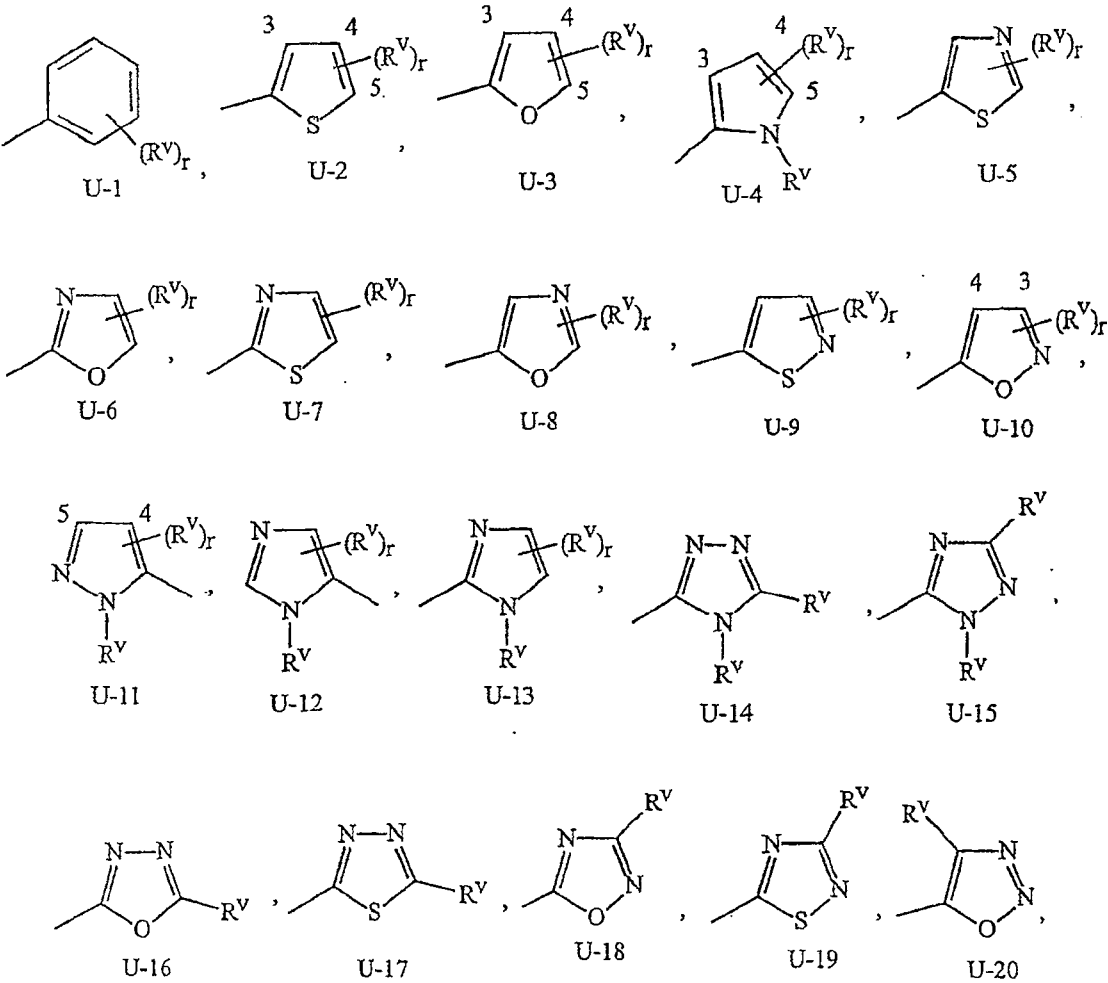
本发明包括式 I 化合物、其 N-氧化物以及合适的盐。本领域技术人员应当理解，不是所有含氮杂环都可以形成 N-氧化物，因为氮需要利用孤对电子来被氧化以形成氧化物；本领域技术人员应当能够确认可形成 N-氧化物的含氮杂环。本领域技术人员还应当认识到叔胺可形成 N-氧化物。用于制备杂环和叔胺的 N-氧化物的合成方法是本领域技术人员众所周知的，包括用过氧酸例如过乙酸和间氯过苯甲酸 (MCPBA)、过氧化氢、烷基过氧化氢例如叔丁基过氧化氢、过硼酸钠和双环氧乙烷例如二甲基双环氧乙烷将杂环和叔胺氧化。文献中已充分描述和总结了这些制备 N-氧化物的方法，参见例如：T. L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler 和 B. Stanovnik, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol. 3, pp 18-19, A. J. Boulton 和 A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett 和 B. R. T. Keene, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 43, pp 139-151, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler 和 B. Stanovnik, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky 和 A. J. Boulton, Eds., Academic Press; 和 G. W. H. Cheeseman 和 E. S. G. Werstiuk, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky 和 A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

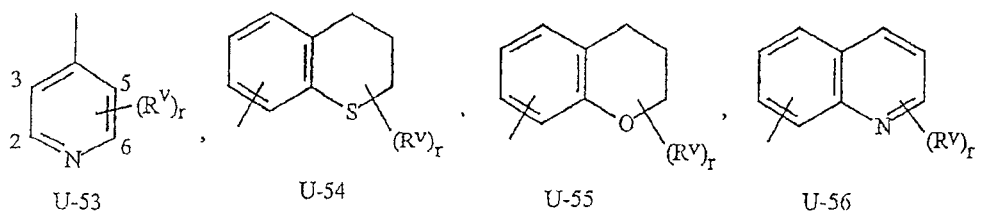
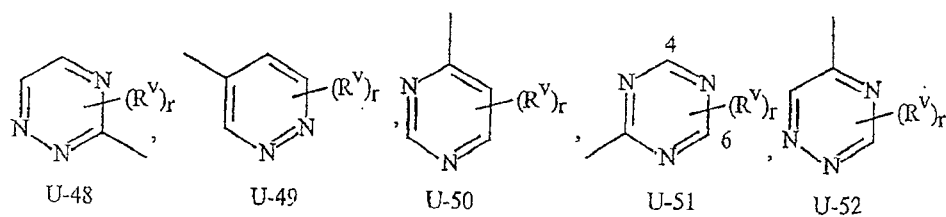
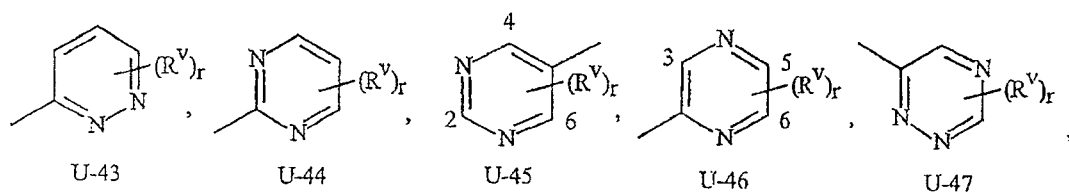
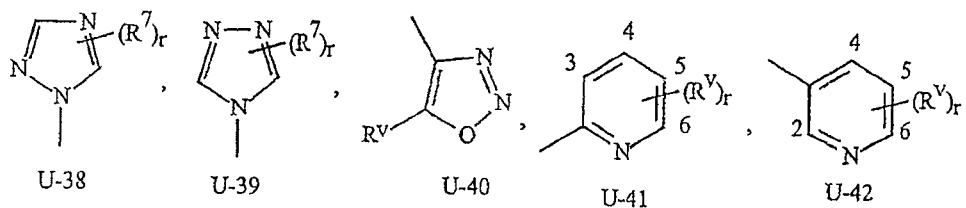
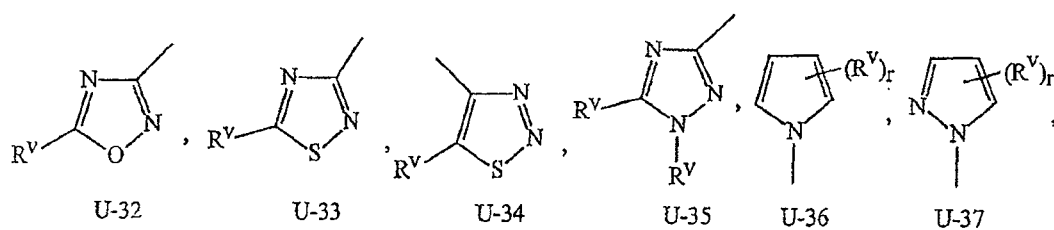
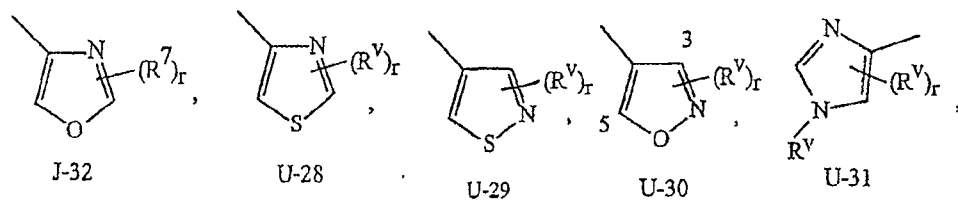
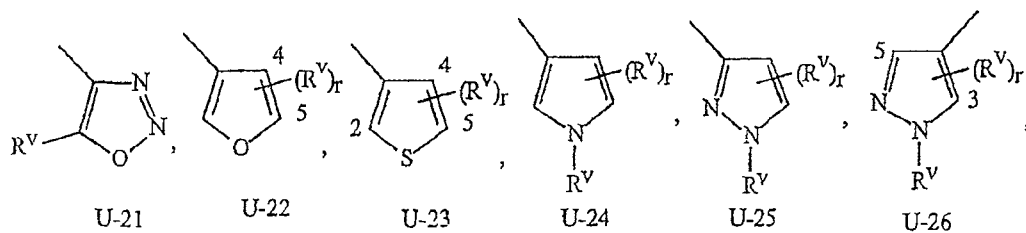
本发明化合物的盐包括与无机酸或有机酸形成的酸加成盐，所述无机酸或有机酸是例如氢溴酸、盐酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、富马酸、乳酸、马来酸、丙二酸、草酸、丙酸、水杨酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。当化合物含有酸性基团例如羧酸或酚时，本发明化合物的盐还包括与有机碱(例如吡啶、氨或三乙胺)或无机碱(例如钠、钾、锂、钙、镁或钡的氢化物、氢氧化物或碳酸盐)形成的盐。

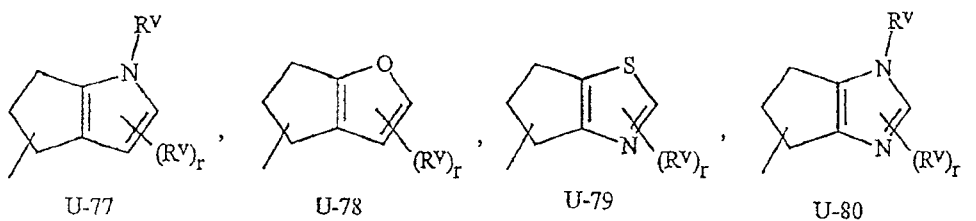
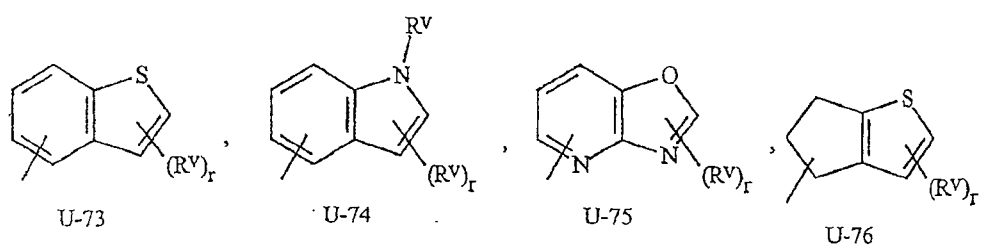
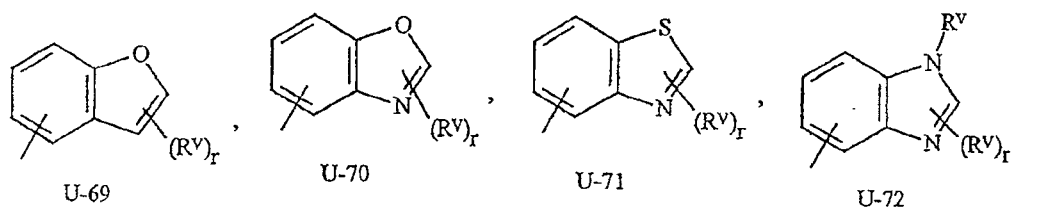
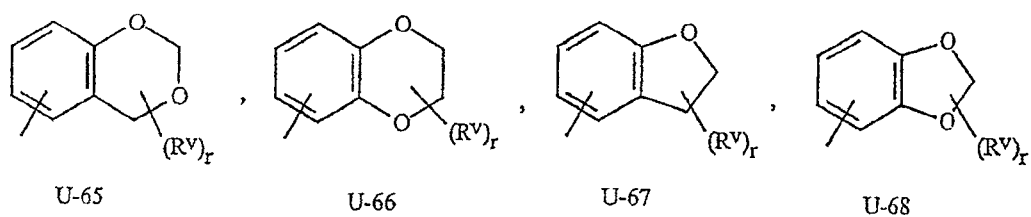
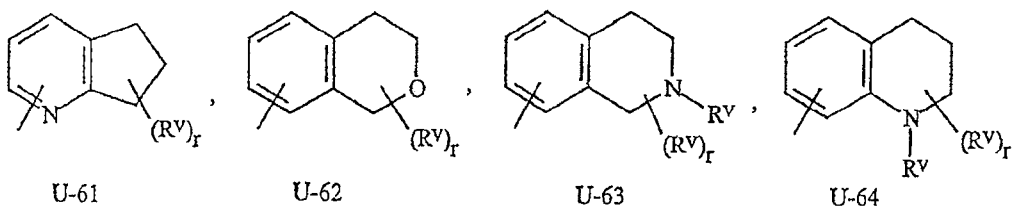
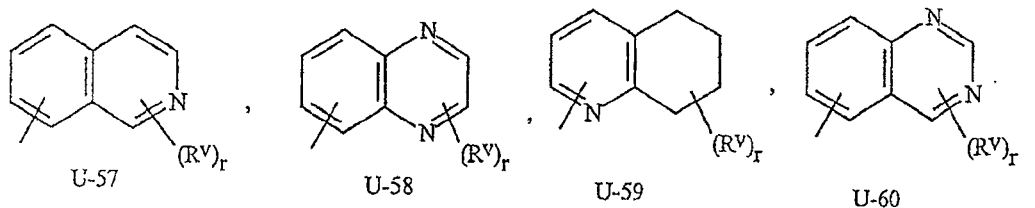
如上所述, 每个 J 独立地为苯环, 5-或 6-元杂芳环或芳族 8-、9-或 10-元稠合碳二环或杂二环环系, 其中每个环或环系被 1-4 个 R^s 取代。被 1-4 个 R^s 取代的苯基的一个实例是如在下文图示 (Exhibit) 1 中作为 U-1 显示的环, 其中 R^s 是 R^5 , 且 r 是 1-4 的整数。被 1-4 个 R^s 取代的芳族 8-、9-或 10-元稠合碳二环环系的实例包括如在于图示 1 中作为 U-85 显示的萘基, 和如在于图示 1 中作为 U-89 显示的 1, 2, 3, 4-四氢萘基, 其中 R^s 是 R^5 , 且 r 是 1-4 的整数。被 1-4 个 R^s 取代的 5-或 6-元杂芳环的实例包括在于图示 1 中显示的环 U-2-U-53, 其中 R^s 是 R^5 , 且 r 是 1-4 的整数。注意, 下面的 J-1-J-4 也表示 5-或 6-元杂芳环。注意, U-2-U-20 是 J-1 的实例, U-21-U-35 和 U-40 是 J-2 的实例, U-41-U-48 是 J-3 的实例, 且 U-49-U-53 是 J-4 的实例。被 1-4 个 R^s 取代的芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系的实例包括在于图示 1 中显示的 U-54-U-84, 其中 R^s 是 R^5 , 且 r 是 1-4 的整数。

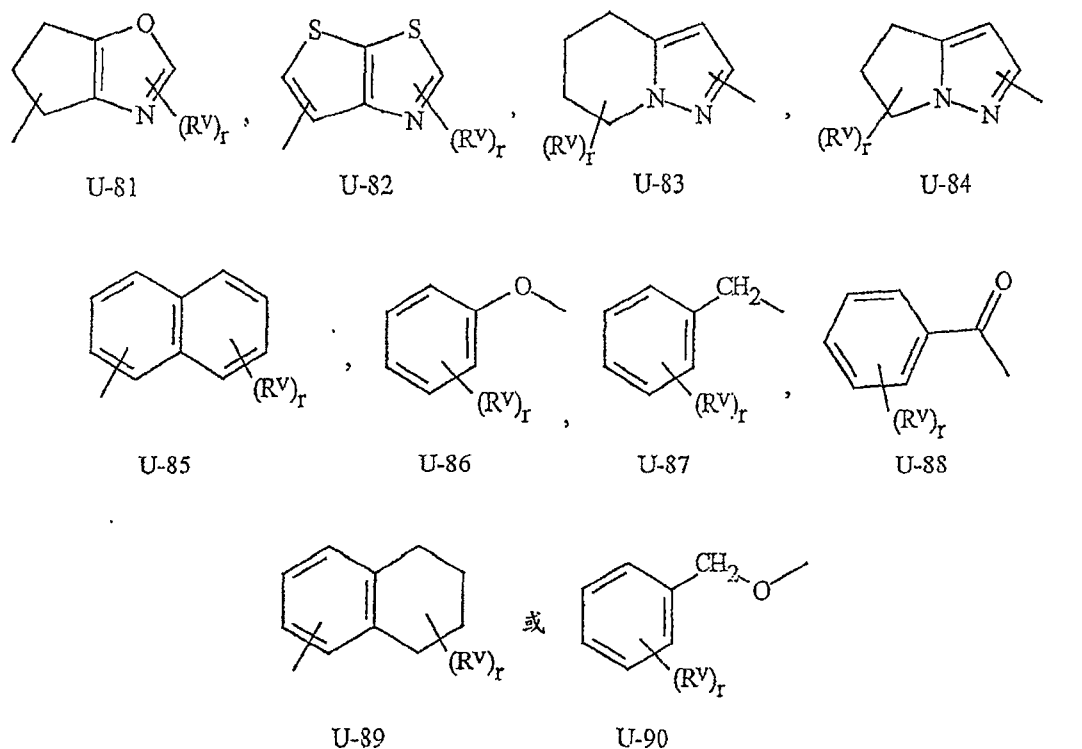
虽然在结构 U-1-U-90 中显示了 R^s 基团, 但是应当注意, 当它们是任选的取代基时, 它们不是必须存在的。注意, 当 R^s 是 H, 并且连接在原子上时, 这与所述原子未被取代是一样的。需要取代以满足其化合价的氮原子被 H 或 R^s 取代。注意, 某些 U 基团只能被少于 4 个的 R^s 取代 (例如 U-14、U-15、U-18-U-21 和 U-32-U-34 只能被一个 R^s 取代)。注意, 当在 $(R^s)_r$ 与 U 基团之间的连接点显示为浮动点时, $(R^s)_r$ 可连接在 U 基团的任何可利用的碳原子上。注意, 当 U 基团上的连接点显示为浮动点时, U 基团可通过置换氢原子而经由 U 基团的任何可利用的碳原子连接在式 I 的其余部分上。

图 1









如上所述,一些 R^1 、 R^3 、 R^6 和 R^8 基团可任选被一个或多个取代基取代。与这些 R^w 基团(其中 w 是 1、3、6 或 8)相关使用的术语“任选被取代的”是指未被取代或者具有至少一个非氢取代基的 R 基团。任选被取代的 R^w 基团的实例是这样的 R^w 基团,其任选被一个或多个(最高达任何特定 R^w 基团中可被置换的氢的总数目)独立地选自上文发明概述中列出的取代基的取代基通过置换掉 R^w 基团的碳原子上的氢而取代。虽然列出了取代基,但是注意,它们不是必须存在,因为它们只是任选的取代基。未被取代的 R^w 基团是值得特别关注的。被 1-5 个取代基取代的 R^w 基团是值得关注的。被一个取代基取代的 R^w 基团也是值得关注的。

如上所述, R^3 可以是 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基或 C_3 - C_6 环烷基,所述基团分别可任选被(尤其是)苯基、苯氧基或 5-或 6-元杂芳环取代,所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自 R^9 的取代基取代。这样的取代基环的实例包括在上面图示 1 中作为环 U-1 (苯基)、U-2-U-53 (5-或 6-元杂芳环)和 U-86 (苯氧基)显示的环,其中 R^9 是 R^9 ,且 r 是 1-3 的整数。

如上所述,每个 R^4 可独立地为(尤其是)苯基、苄基或苯氧基环,所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自 R^9 的取代基取代。这样的取代

基环的实例包括在上面图示 1 中作为环 U-1 (苯基)、U-87 (苄基) 和 U-86 (苯氧基) 显示的环, 其中 R^v 是 R^9 , 且 r 是 1-3 的整数。

如上所述, 每个 R^5 可独立地为 (尤其是) 苯基、苄基、苯甲酰基、苯氧基或 5-或 6-元杂芳环, 或芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系, 所述每个环或环系可任选被 1-3 个独立地选自 R^9 的取代基取代。这样的取代基环的实例包括在上面图示 1 中作为环 U-1 (苯基)、U-87 (苄基)、U-88 (苯甲酰基)、U-86 (苯氧基)、U-2-U-53 (5-或 6-元杂芳环) 和 U-54-U-84 (芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系) 显示的环, 其中 R^v 是 R^9 , 且 r 是 1-3 的整数。

如上所述, 每个 R^6 和每个 R^8 可独立地为 (尤其是) 苯环或 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自 R^9 的取代基取代。这样的 R^6 和每个 R^8 基团的实例包括在上面图示 1 中作为环 U-1 (苯基) 和 U-2-U-53 (5-或 6-元杂芳环) 显示的环, 其中 R^v 是 R^9 , 且 r 是 1-3 的整数。

如上所述, 每个 R^7 可独立地为苯基、苄氧基或 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自 R^9 的取代基取代。这样的 R^7 的实例包括在上面图示 1 中作为环 U-1 (苯基)、U-90 (苄氧基) 和 U-2-U-53 (5-或 6-元杂芳环) 显示的环, 其中 R^v 是 R^9 , 且 r 是 1-3 的整数。

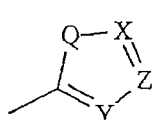
出于更好的活性和/或易于合成的原因而优选的化合物是:

优选 1. 其中 K 是 $-\text{NR}^1\text{C}(=\text{A})-$, 且 A 是 O 的式 I 化合物。

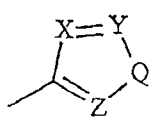
优选 2. 其中 L 是 $-\text{C}(=\text{B})\text{NR}^2-$, 且 B 是 O 的式 I 化合物。

优选 3. 优选 1 或优选 2 的化合物, 其中

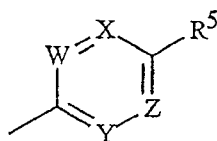
J 是苯环或选自 J-1、J-2、J-3 和 J-4 的 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环被 1-4 个独立地选自 R^5 的取代基取代,



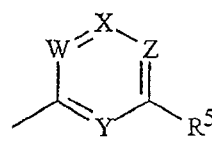
J-1



J-2



J-3



J-4

;

Q 是 O、S 或 NR^5 ;

W、X、Y 和 Z 独立地为 N 或 CR^5 ，条件是：在 J-3 和 J-4 中，W、X、Y 或 Z 当中至少有一个是 N；

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

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

R^3 是 H；或 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基或 C_3-C_6 环烷基，所述基团分别可任选被一个或多个独立地选自下列的取代基取代：卤素、CN、 C_1-C_2 烷氧基、 C_1-C_2 烷硫基、 C_1-C_2 烷基亚硫酰基和 C_1-C_2 烷基磺酰基；

一个 R^4 在苯环的 2-位或 5-位连接在式 I 的其余部分上，并且所述 R^4 是 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚硫酰基或 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基；

每个 R^5 独立地为 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基或 C_3-C_8 二烷基氨基羰基；或者

每个 R^5 独立地为苯基、苄基或 5-或 6-元杂芳环，所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自 R^9 的取代基取代；或者

当连接在相邻碳原子上时， $(R^5)_2$ 可一起形成 $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ 或 $-OCF_2CF_2O-$ ；

每个 R^6 独立地为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基，所述基团分别可任选被一个或多个独立地选自下列的取代基取代：卤素、CN、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基和 R^7 ；且

n 是 1 或 2。

其中 K 是 $-NR^1C(=O)-$ ，且 L 是 $-C(=O)NR^2-$ 的优选 3 的化合物是值得注意的。其中 K 是 $-NR^1C(=O)-$ ，且 L 是 $-C(=O)-$ 的优选 3 的化合物也是值得注意的。其中 L 是 $-C(=O)NR^2-$ ，且 K 是 $-N=C(=O)-$ 或 $-NR^1SO_2-$ 的优选 3 的化合物也是值得注意的。

优选 4. 优选 3 的化合物, 其中

R^1 和 R^2 分别独立地为 H 或 C_1-C_4 烷基;

R^3 是 C_1-C_4 烷基, 所述烷基可任选被卤素、CN、 OCH_3 或 $S(O)_pCH_3$ 取代;

每个 R^5 独立地为 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基或 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基或 C_3-C_8 二烷基氨基羰基; 或苯基、苄基或 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环可任选被下列基团取代: 卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基; 条件是: 一个 R^5 在 K 的邻位连接在 J 上, 并且至少一个 R^5 不是 H;

G 是 O 或 S; 且

p 是 0、1 或 2。

优选 5. 优选 4 的化合物, 其中 J 是苯基、吡唑、吡咯、吡啶或嘧啶环, 所述每个环被一个在 K 的邻位连接在 J 上的 R^5 以及任选一个或两个另外的 R^5 取代。

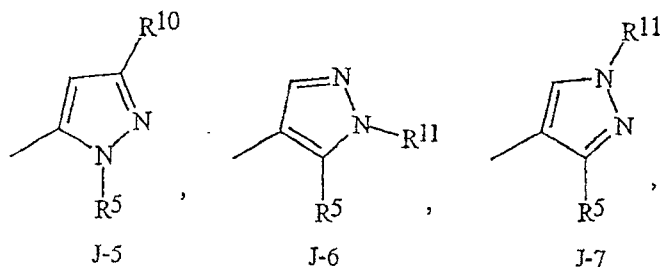
优选 6. 优选 5 的化合物, 其中

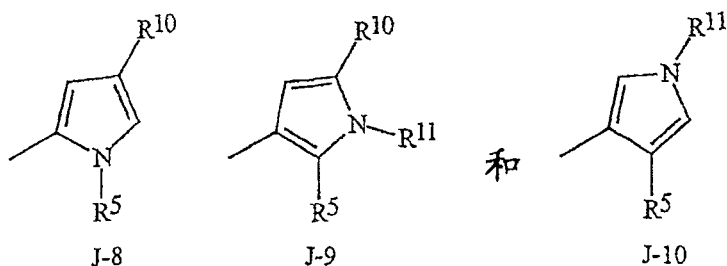
R^1 和 R^2 都是 H;

一个 R^4 在 K-J 部分的邻位、苯环的 2-位连接在式 I 的其余部分上, 并选自 C_1-C_3 烷基、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ 和卤素, 任选第二个 R^4 在 K-J 部分的对位、苯环的 4-位连接, 并选自卤素、 C_1-C_3 烷基和 C_1-C_3 卤代烷基。

优选 7. 优选 6 的化合物, 其中

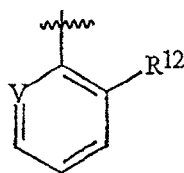
J 是选自 J-5、J-6、J-7、J-8、J-9 和 J-10 的吡唑或吡咯环, 所述每个环被 R^5 取代, 并任选被 R^{10} 和 R^{11} 取代;





;

R^5 是 H、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基或



;

V 是 N、CH、CF、CCl、CBr 或 Cl;

每个 R^{10} 和每个 R^{12} 独立地为 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、卤素、CN、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷硫基;
且

R^{11} 是 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 卤代烯基、 C_3 - C_6 炔基或 C_3 - C_6 卤代炔基。

注意, R^{10} 和 R^{11} 是 R^5 的子集。注意, 当 R^{12} 不是 H 时, 其是 R^9 的子集, 并且包括在 V 范围内的 F、Cl、Br 或 I 原子也是 R^9 的子集。注意, 所示的关于 R^5 的基团是经由用波浪线突出显示的键连接在 J 上。

优选 8. 优选 7 的化合物, 其中 V 是 N。

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

优选 10. 优选 8 或优选 9 的化合物, 其中

R^{12} 是 H、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、卤素或 CN;

R^{10} 是 H、CH₃、CF₃、OCH₂CF₃、OCHF₂ 或卤素; 且

R^{11} 是 CH₂CF₃、CHF₂ 或 CF₃。

优选 11. 优选 10 的化合物, 其中被 R^5 取代, 并任选被 R^{10} 取代的 J 是 J-5; R^{12} 是 Cl 或 Br; 且 R^{10} 是卤素、OCH₂CF₃、OCHF₂ 或 CF₃。

优选 12. 优选 10 的化合物, 其中被 R^5 取代, 并任选被 R^{11} 取代的 J 是 J-6; R^{12} 是 Cl 或 Br; 且 R^{11} 是 CH₂CF₃、CHF₂ 或 CF₃。

优选 13. 优选 10 的化合物, 其中被 R^5 取代, 并任选被 R^{11} 取代的 J 是 J-7; R^{12} 是 Cl 或 Br; 且 R^{11} 是 CH_2CF_3 、 CHF_2 或 CF_3 。

优选 14. 优选 10 的化合物, 其中被 R^5 取代, 并任选被 R^{10} 取代的 J 是 J-8; R^{12} 是 Cl 或 Br; 且 R^{10} 是卤素、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ 或 CF_3 。

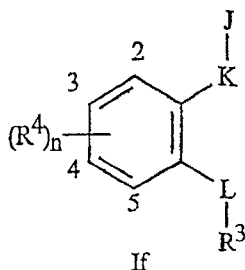
优选 15. 优选 10 的化合物, 其中被 R^5 取代, 并任选被 R^{10} 和 R^{11} 取代的 J 是 J-9; R^{12} 是 Cl 或 Br; R^{10} 是卤素、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ 或 CF_3 ; 且 R^{11} 是 CH_2CF_3 、 CHF_2 或 CF_3 。

优选 16. 优选 10 的化合物, 其中被 R^5 取代, 并任选被 R^{11} 取代的 J 是 J-10; R^{12} 是 Cl 或 Br; 且 R^{11} 是 CH_2CF_3 、 CHF_2 或 CF_3 。

最优选的式 I 化合物是

1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[2-甲基-6-[(1-甲基乙基)氨基]磺酰基]苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-甲酰胺。

值得注意的是式 If 化合物、其 N-氧化物以及在农业上合适的盐



其中

J 是苯环、萘基环系, 5-或 6-元杂芳环或芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系, 其中每个环或环系可任选被 1-4 个 R^5 取代;

K 是 $—NR^1C(=A)—$ 、 $—N=C(GR^6)—$ 或 $—NR^1SO_2—$;

L 是 $—C(=B)NR^2—$ 、 $—C(GR^6)=N—$ 、 $—SO_2NR^2—$ 或 $—C(=O)—$;

A 和 B 独立地为 O、S、 NR^6 、 NOR^6 、 $NN(R^6)_2$ 、 $S=O$ 、 $N-CN$ 或 $N-NO_2$;

每个 G 独立地为 O、S 或 NR^6 ;

R^1 是 H; 或 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基或 C_3-C_6 环烷基, 所述基团分别可任选被一个或多个选自下列的取代基取代: 卤素、 CN 、 NO_2 、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基和 C_3-C_6 环烷基氨基; 或者

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

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

R^3 是 H； C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基，所述基团分别可任选被一个或多个选自下列的取代基取代：卤素、CN、NO₂、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酸基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基或苯基、苯氧基或 5-或 6-元杂芳环，所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自下列的取代基取代： C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 卤代烯基、 C_2-C_4 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酸基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_3-C_6 (烷基) 环烷基氨基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基或 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基； C_1-C_4 烷氧基； C_1-C_4 烷基氨基； C_2-C_8 二烷基氨基； C_3-C_6 环烷基氨基； C_2-C_6 烷氧基羰基或 C_2-C_6 烷基羰基；或者

R^2 和 R^3 可以与它们所连接的氮一起形成包含 2-6 个碳原子和任选一个选自氮、硫和氧的另外的原子的环，所述环可任选被 1-4 个独立地选自下列的取代基取代： C_1-C_2 烷基、卤素、CN、NO₂ 和 C_1-C_2 烷氧基；

每个 R^4 独立地为 H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 卤代烯基、 C_2-C_6 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酸基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚硫酸基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基或 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基；或者

每个 R^4 独立地为苯基、苄基或苯氧基，所述基团分别可任选被下列基团取代： C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 卤代烯基、 C_2-C_4 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、NO₂、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基

亚硫酰基、 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;

每个 R^5 独立地为 H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、 C_2-C_6 卤代烯基、 C_2-C_6 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、羟基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷基硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 烷基氨基、 C_2-C_8 二烷基氨基、 C_3-C_6 环烷基氨基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基、 C_3-C_6 三烷基甲硅烷基; 或者

每个 R^5 独立地为苯基、苄基、苯甲酰基、苯氧基、5-或 6-元杂芳环或芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系, 所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自下列的取代基取代: C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 卤代烯基、 C_2-C_4 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 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; 或者

当连接在相邻碳原子上时, $(R^5)_2$ 可一起形成 $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ 或 $-OCF_2CF_2O-$;

每个 R^6 独立地为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基, 所述基团可任选被下列基团取代: 卤素、CN、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基或 R^7 ; C_3-C_6 环烷基; 或 C_2-C_4 烷氧基羰基; 或者

每个 R^6 独立地为苯环或 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自下列的取代基取代: C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 卤代烯基、 C_2-C_4 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 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；

每个 R^7 独立地为苯环或 5-或 6-元杂芳环，所述每个环可任选被 1-3 个独立地选自下列的取代基取代： C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 卤代烯基、 C_2-C_4 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 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；且

n 为 1-4；

条件是：当 K 是 $-NR^1C(=A)-$ ，且 A 是 O 或 S 时，则 L 不是 $-C(=O)NR^2-$ 或 $-C(=S)NR^2-$ 。

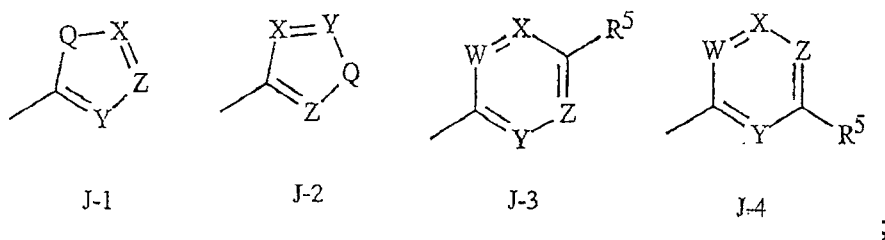
选择的式 I 化合物也是值得注意的

选择 A. 式 I 化合物，其中 K 是 $-NR^1C(=A)-$ ，且 A 是 O。

选择 B. 式 I 化合物，其中 L 是 $-C(=B)NR^2-$ ，且 B 是 O。

选择 C. 选择 B 或选择 C 的化合物，其中

J 是苯环或选自 J-1、J-2、J-3 和 J-4 的 5-或 6-元杂芳环，所述每个 J 环可任选被 1-3 个 R^5 取代，



Q 是 O、S 或 NR^5 ；

W 、 X 、 Y 和 Z 独立地为 N 或 CR^5 ，条件是：在 J-3 和 J-4 中， W 、 X 、 Y 或 Z 当中至少有一个是 N；

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

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

R^3 是 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基或 C_3-C_6 环烷基, 所述基团分别可任选被一个或多个选自下列的取代基取代: 卤素、CN、 C_1-C_2 烷氧基、 C_1-C_2 烷硫基、 C_1-C_2 烷基亚硫酰基和 C_1-C_2 烷基磺酰基;

一个 R^4 在 2-位或 5-位连接在苯环上, 并且所述 R^4 是 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚硫酰基或 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基;

每个 R^5 独立地为 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 烷基磺酰基、 C_1-C_4 卤代烷硫基、 C_1-C_4 卤代烷基亚硫酰基、 C_1-C_4 卤代烷基磺酰基或 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基; 或者

每个 R^5 独立地为苯基、苄基或 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环可任选被下列基团取代: C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 卤代烯基、 C_2-C_4 卤代炔基、 C_3-C_6 卤代环烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亚硫酰基、 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; 或者

当连接在相邻碳原子上时, $(R^5)_2$ 可一起形成 $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ 或 $-OCF_2CF_2O-$;

每个 R^6 独立地为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基, 所述基团可任选被下列基团取代: 卤素、CN、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基或 R^7 ; 且 n 是 1 或 2。

其中 K 是 $-NR^1C(=O)-$, 且 L 是 $-C(=NR^6)-$ 或 $-SO_2NR^2-$ 的选择 C 的化合物是值得注意的。其中 L 是 $-C(=O)NR^2-$, 且 K 是 $-N=C(=NR^6)-$ 或 $-NR^1SO_2-$ 的选择 C 的化合物也是值得注意的。

选择 D. 选择 C 的化合物, 其中

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 C_1-C_4 烷基, 其任选被下列基团取代: 卤素、CN、 OCH_3 或 $S(O)_2CH_3$;

一个 R^5 在 K 的邻位连接在 J 上, 并且所述 R^5 是 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷基硫基、 C_1 - C_4 烷基亚硫酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基硫基、 C_1 - C_4 卤代烷基亚硫酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基磺酰基或 C_2 - C_4 烷氧基羰基; C_3 - C_8 二烷基氨基羰基或苯基、苄基或 5-或 6-元杂芳环, 所述每个环可任选被下列基团取代: 卤素、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基;

并且任选第二个 R^5 独立地为 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、卤素、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 卤代烷氧基、 C_1 - C_4 烷基硫基、 C_1 - C_4 烷基亚硫酰基、 C_1 - C_4 烷基磺酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基硫基、 C_1 - C_4 卤代烷基亚硫酰基、 C_1 - C_4 卤代烷基磺酰基或 C_2 - C_4 烷氧基羰基; C_3 - C_8 二烷基氨基羰基或苯基、苄基或 5-或 6-元杂芳环, 每个环可任选被下列基团取代: 卤素、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基;

G 是 O 或 S; 且

p 是 0、1 或 2。

选择 E. 选择 D 的化合物, 其中 J 是苯基、吡唑、吡咯、吡啶或嘧啶, 所述每个基团被在 K 的邻位连接在 J 上的一个 R^5 和第二个任选的 R^5 取代。

选择 F. 选择 E 的化合物, 其中 R^1 和 R^2 分别是 H;
一个 R^4 连接在 2-位上 K-J 部分的邻位上, 并选自 C_1 - C_3 烷基、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ 和卤素, 并且任选第二个 R^4 连接在 4-位上即 K-J 部分的对位上连接, 并选自卤素、 C_1 - C_3 烷基和 C_1 - C_3 卤代烷基。

选择 G. 选择 E 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} ;

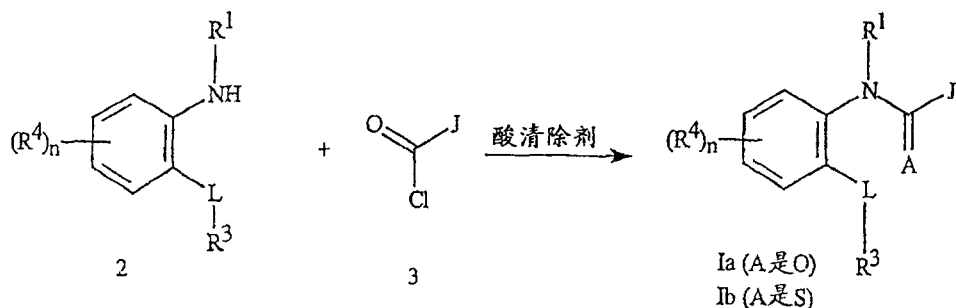
R^{5a} 是苯基或 2-吡啶基环, 其被一个或两个选自下列的取代基取代:
卤素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 卤代烷氧基; 且

R^{5b} 是卤素或 CF_3 。

如在反应方案 1-33 中描述的一种或多种下列方法以及变型可用于制备式 I 化合物。在下面的式 1-88 化合物中, A、B、J、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 和 n 如上文发明概述中所定义。式 Ia-e、2a-b、4a-s、5a-d 化合物是式 I、2、4 和 5 化合物的不同子集。

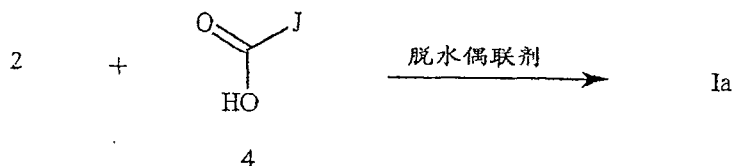
式 Ia 化合物(其中 K 是 $NR^1C(=O)$)可这样制得: 将式 2 胺与式 3 酰氯在酸清除剂存在下偶联, 以获得式 Ia 化合物。典型的酸清除剂包括胺类碱例如三乙胺、二异丙基乙胺和吡啶; 其它清除剂包括氢氧化物例如氢氧化钠和氢氧化钾, 和碳酸盐例如碳酸钠和碳酸钾。在一些实例中, 可使用以聚合物为载体的酸清除剂例如聚合物结合的二异丙基乙胺和聚合物结合的二甲基氨基吡啶。偶联可以在合适的惰性溶剂例如四氢呋喃、二噁烷、乙醚或二氯甲烷中进行, 以获得式 Ia 的 N-酰苯胺。在随后的步骤中, 可使用各种标准硫转移试剂, 包括五硫化磷和 Lawesson's 试剂将式 Ia 酰胺化合物转化成式 Ib 硫代酰胺化合物。

反应方案 1



制备式 Ia 化合物的另一种方法是将式 2 的胺与式 4 的酸在脱水剂例如二环己基碳化二亚胺(DCC)存在下偶联。同样可以使用以聚合物作为载体的试剂, 例如聚合物结合的二环己基碳化二亚胺。反应方案 1 和 2 的合成步骤仅是可用于制备式 I 化合物的方法的代表性实例, 合成文献对这类反应作了广泛描述。

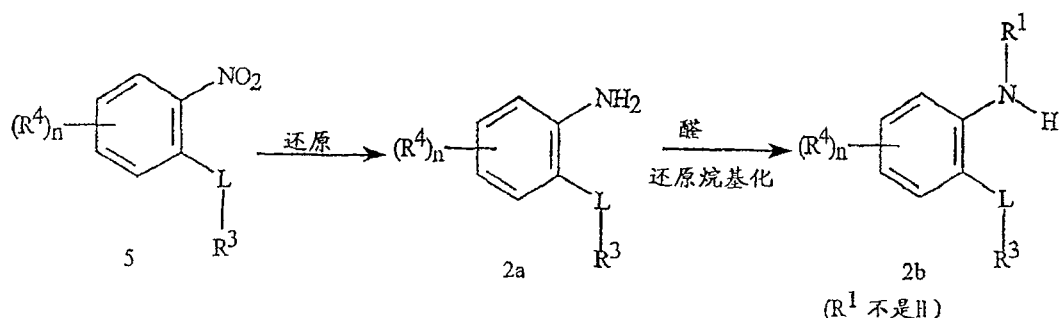
反应方案 2



本领域技术人员还应当认识到, 式 3 的酰氯可通过多种众所周知的方法由式 4 的酸制得。例如, 式 3 的酰氯可通过下述方法由式 4 的羧酸方便地制得: 将羧酸 4 的与亚硫酰氯或草酰氯在惰性溶剂例如甲苯或二氯甲烷中于催化量的 N,N-二甲基甲酰胺存在下反应。

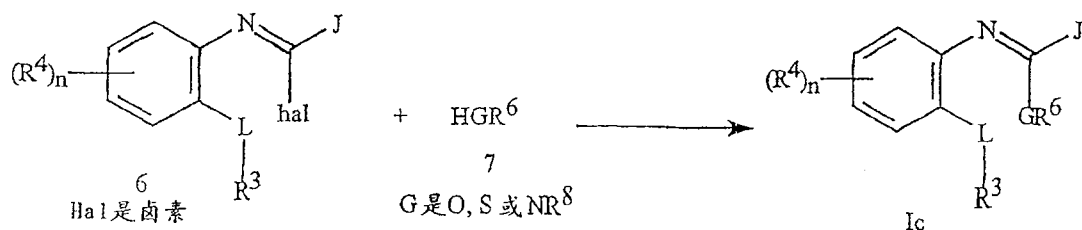
式 2a 的胺一般可通过将式 5 的相应的硝基化合物经硝基催化氢化来获得。典型方法包括在金属催化剂例如披钨炭或氧化铂存在下, 在羟基溶剂例如乙醇和异丙醇中用氢还原。它们还可以通过在乙酸中用锌还原来制得。化学文献中充分地描述了这些方法。 R^1 取代基例如烷基、取代的烷基等一般可在该阶段经由通常优选的胺的还原烷基化方法来引入。常用方法是将苯胺 2a 与醛在还原剂例如氰基硼氢化钠存在下反应生成其中 R^1 是烷基、烯基、炔基的式 2b 化合物或其取代的衍生物。

反应方案 3



式 Ic 化合物 (其中 K 是 $\text{N}=\text{C}(\text{GR}^6)$) 可通过将式 6 的亚氨基卤化物与式 7 的硫、氧和氮亲核试剂反应来制得。该反应一般在碱例如叔胺或碱金属氢氧化物存在下进行。

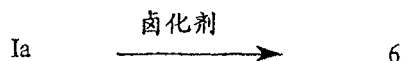
反应方案 4



式 6 化合物可通过将式 Ia 化合物与合适的卤化剂例如五氯化磷、

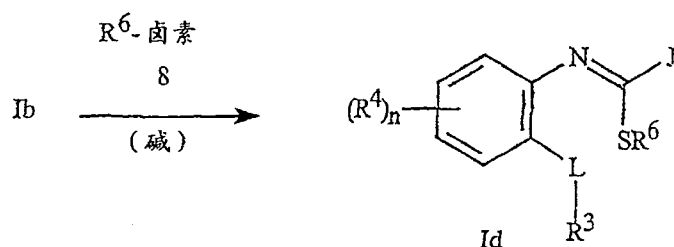
三氯化磷、亚硫酰氯或三苯基磷和四氯化碳反应来制得。

反应方案 5



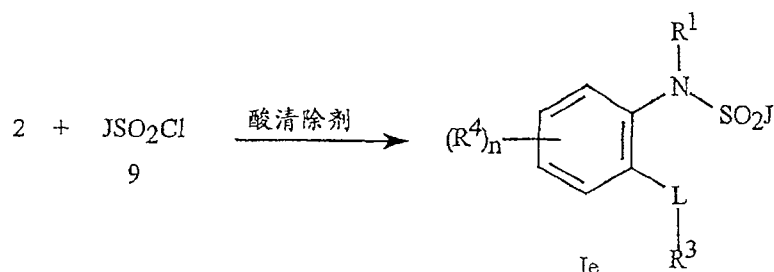
或者, 当 R^6 是烷基或取代的烷基时, 式 Id 化合物(其中 K 是 $N=C(SR^6)$)可通过将式 Ib 化合物与式 8 的烷基卤任选在碱例如叔胺或碱金属醇化物存在下反应来制得。

反应方案 6



式 1e 化合物(其中 K 是 NR^1SO_2)可通过将式 2 的胺与式 9 的磺酰氯在酸清除剂存在下反应来制得。典型的酸清除剂包括胺类碱例如三乙胺、二异丙基乙胺和吡啶; 其它清除剂包括氢氧化物例如氢氧化钠和氢氧化钾, 和碳酸盐例如碳酸钠和碳酸钾。在一些实例中, 可使用以聚合物为载体的酸清除剂例如聚合物结合的二异丙基乙胺和聚合物结合的二甲基氨基吡啶。

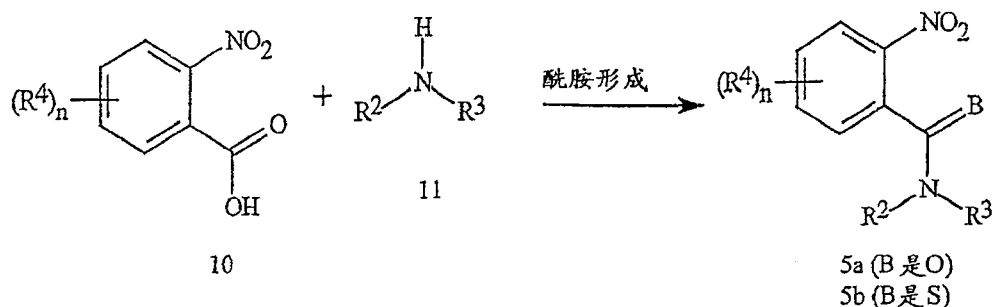
反应方案 7



式 5a 的硝基化合物(其中 L 是 $C(=O)NR^2$)可由市售 2-硝基苯甲酸方便地制得(反应方案 8)。可使用形成酰胺的典型方法。这些方法包括使用例如 DCC 将式 10 的酸与式 11 的胺直接脱水偶联, 和将酸转化成

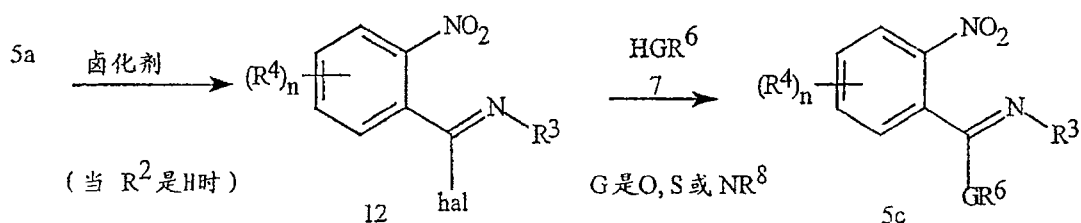
活化形式例如酰氯或酸酐，然后与胺偶联以形成式 5a 的酰胺。化学文献对这类反应作了广泛描述。通过使用市售硫转移试剂，例如五硫化磷和 Lawesson's 试剂，可容易地将式 5a 的酰胺化合物转化成式 5b 的硫代酰胺化合物。

反应方案 8



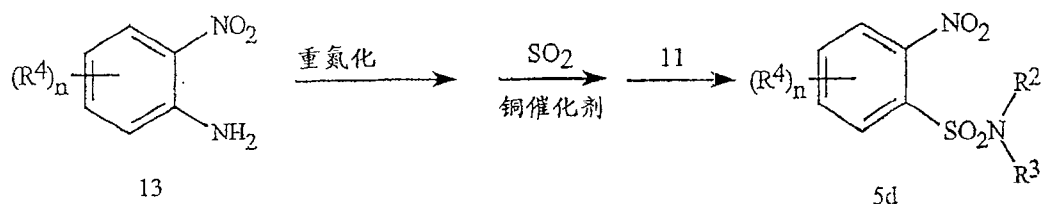
式 5c 硝基化合物 (其中 L 是 C(GR⁶)=N) 可按照类似于反应方案 4 和 5 中描述的方法由式 5a 的化合物经由式 12 的亚氨基卤制得。

反应方案 9



式 5d 的硝基化合物 (其中 L 是 SO₂NR³) 可这样制得: 用试剂例如亚硝酸钠或亚硝酸烷基酯将式 13 的胺重氮化, 与二氧化硫在铜催化剂存在下反应 (参见例如 Courtin, A. Helv. Chim. Acta, 1976, 59, 379-387), 然后与式 11 的胺反应 (参见反应方案 8)。式 13 的胺的合成是本领域众所周知的。

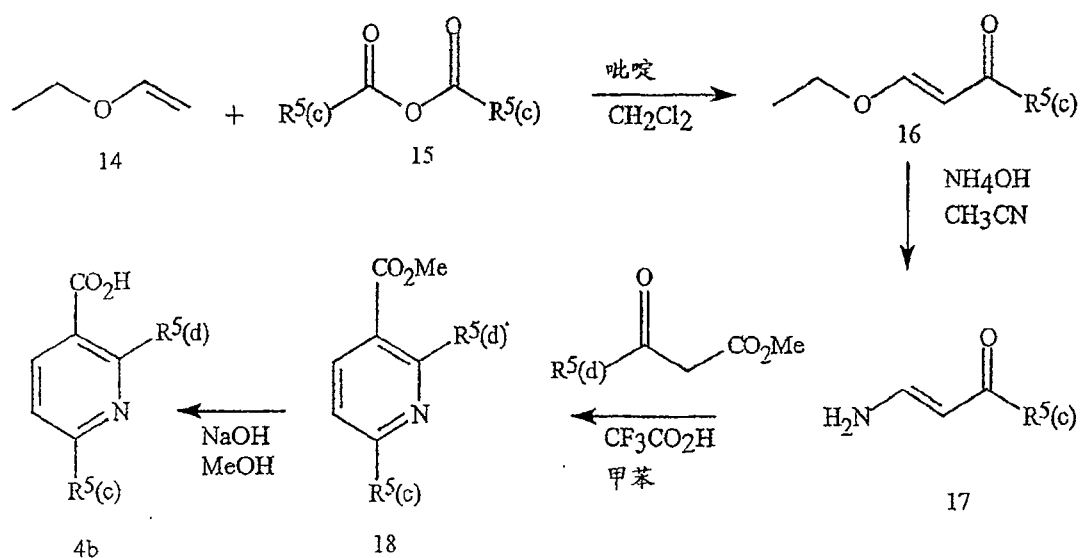
反应方案 10



式 4a 的苯甲酸 (其中 J 是任选被取代的苯环的式 4 化合物) 是本领域众所周知的。反应方案 11-16 中描述了一些式 4 的杂环酸的制备。多种不同的杂环酸以及合成它们的一般方法可参见世界专利申请 W0 98/57397。

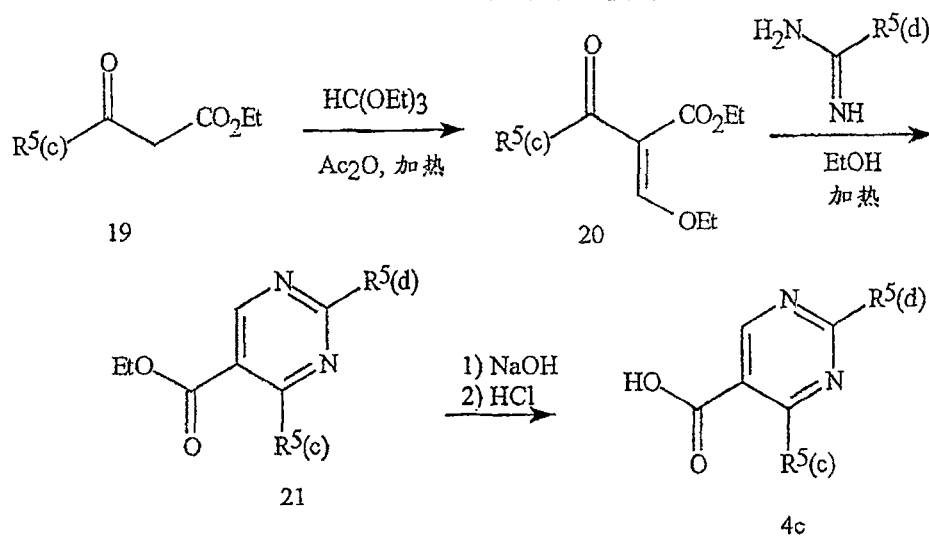
反应方案 11 中描述了代表性吡啶酸 (4b) 的合成。该方法包括已知的由 β -酮基酯和 4-氨基丁烯酮 (17) 合成吡啶的方法。取代基 $R^5(c)$ 和 $R^5(d)$ 包括例如烷基和卤代烷基。

反应方案 11



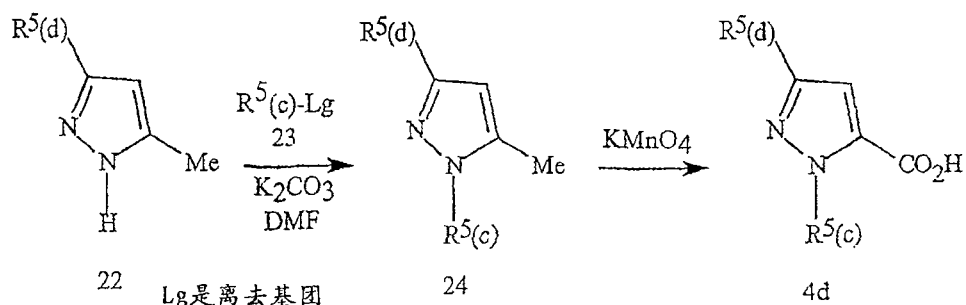
反应方案 12 中描述了代表性嘧啶酸 (4c) 的合成。该方法包括已知的由亚乙烯基- β -酮基酯 (20) 和脒合成嘧啶的方法。取代基 $R^5(c)$ 和 $R^5(d)$ 包括例如烷基和卤代烷基。

反应方案 12



反应方案 13-16 中描述了代表性吡唑酸 (4d-4g) 的合成。反应方案 13 中 4d 的合成包括经由吡唑的烷基化引入 R⁵(c) 取代基这一关键步骤。烷基化剂 R⁵(c)-Lg (其中 Lg 是离去基团例如 Cl、Br、I、磺酸酯例如对甲苯磺酸酯或甲磺酸酯或硫酸酯例如-SO₂OR⁵(c)) 包含 R⁵(c) 基团例如 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₆ 卤代烷基、C₂-C₆ 卤代烯基、C₂-C₆ 卤代炔基、C₃-C₆ 卤代环烷基、C₂-C₆ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₃-C₈ 二烷基氨基羰基、C₃-C₆ 三烷基甲硅烷基；或苯基、苄基、苯甲酰基、5-或 6-元杂芳环或芳族 8-、9-或 10-元稠合杂二环环系，所述每个环或环系可任选被取代。将甲基氧化可获得吡唑羧酸。某些更优选的 R⁵(d) 基团包括卤代烷基。

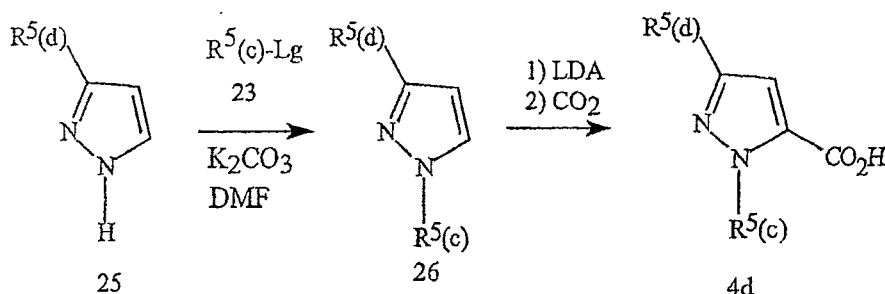
反应方案 13



某些式 4d 的吡唑酸可经由作为关键步骤的式 26 的吡唑的金属化和羧基化来制得 (反应方案 14)。R⁵(c) 基团是按照类似于反应方案 13

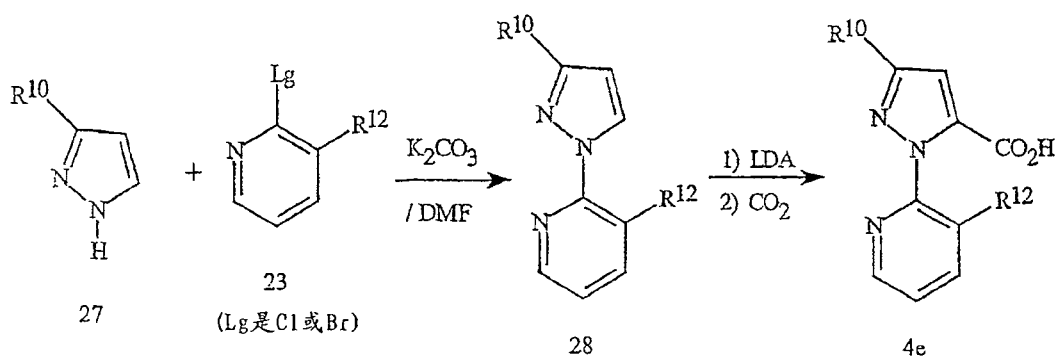
的方式引入的,即用 $R^5(c)$ 烷化剂烷基化。代表性 $R^5(d)$ 基团包括例如氟基和卤代烷基。

反应方案 14



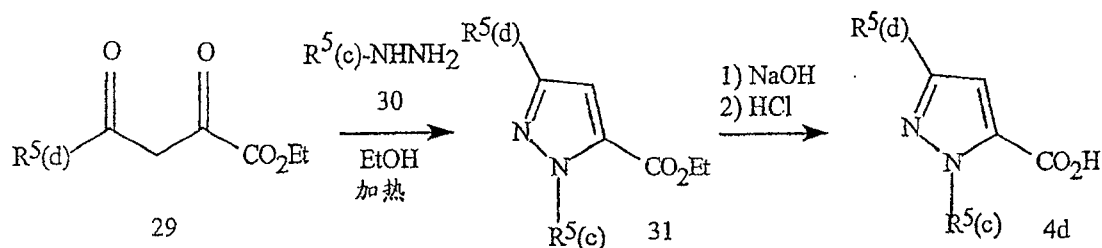
如反应方案 15 所示,该方法可特别用于制备涉及优选的基团 J-5, 其中 R^5 是取代的 2-吡啶基环的式 4e 的 1-(2-吡啶基)吡唑甲酸。将式 27 吡唑与式 23 的 2,3-二卤代吡啶反应,以良好产率获得了式 28 所示 1-吡啶基吡唑,其具有所需立体化学的良好特异性。用二异丙基氨基锂(LDA)将 28 金属化,然后用二氧化碳中止锂盐反应,以获得式 4e 所示 1-(2-吡啶基)吡唑甲酸。

反应方案 15



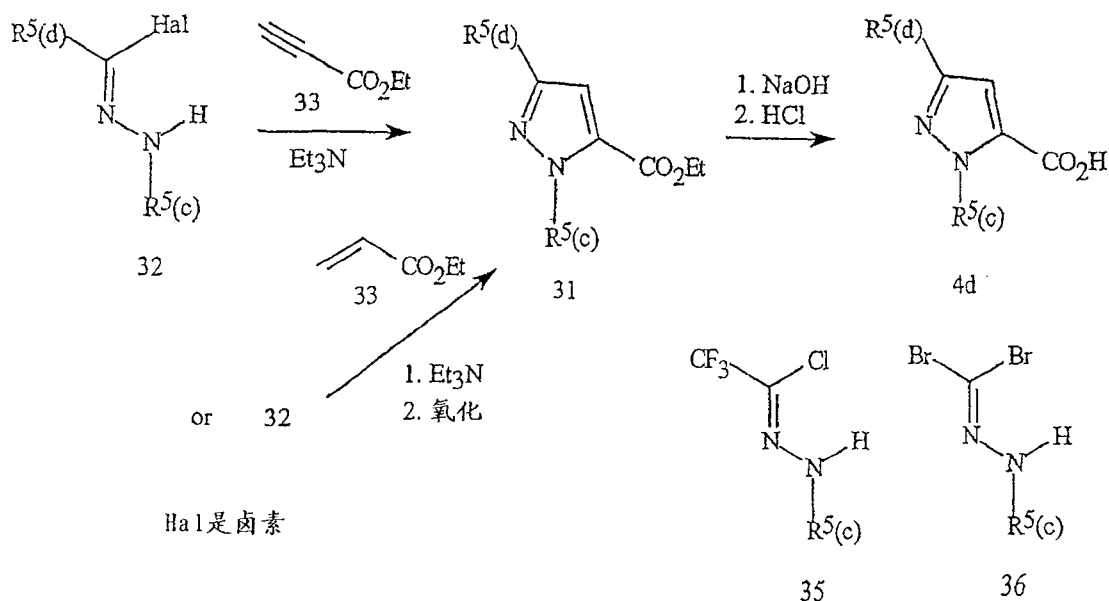
其它式 4d 的吡唑可这样制得: 将式 30 的任选被取代的苯基肼与式 29 的丙酮酸酯反应生成式的 31 吡唑酯(反应方案 16)。将该酯水解,获得了吡唑酸 4d。该方法可特别用于制备其中 $R^5(c)$ 是任选被取代的苯基,且 $R^5(d)$ 是卤代烷基的化合物。

反应方案 16



式 4d 吡唑酸还可以通过式 32 适当被取代的次氨基亚胺 (nitrilimine) 与式 33 的被取代的丙炔酸酯或式 34 的丙烯酸酯的 3+2 环加成来制得 (反应方案 17)。与丙烯酸酯的环加成还需要将中间体吡唑啉氧化成吡唑。将式 31 的酯水解, 获得吡唑酸 4d。对于该反应, 优选的亚氨基卤包括三氟甲基亚氨基氯 (35) 和亚氨基二溴 (36)。化合物例如 35 是已知的 (J. Heterocycl. Chem. 1985, 22 (2), 565-8)。化合物例如 36 可通过已知方法获得 (Tetrahedron Letters 1999, 40, 2605)。这些方法可特别用于制备其中 $R^5(c)$ 是任选被取代的苯基, 且 $R^5(d)$ 是卤代烷基或溴的化合物。

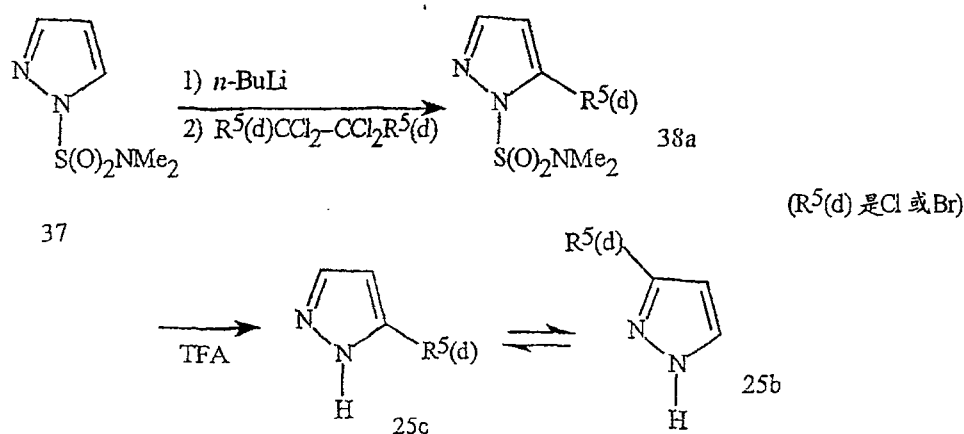
反应方案 17



式 25 的原料吡唑是已知化合物或者可依据已知方法制得。式 25a

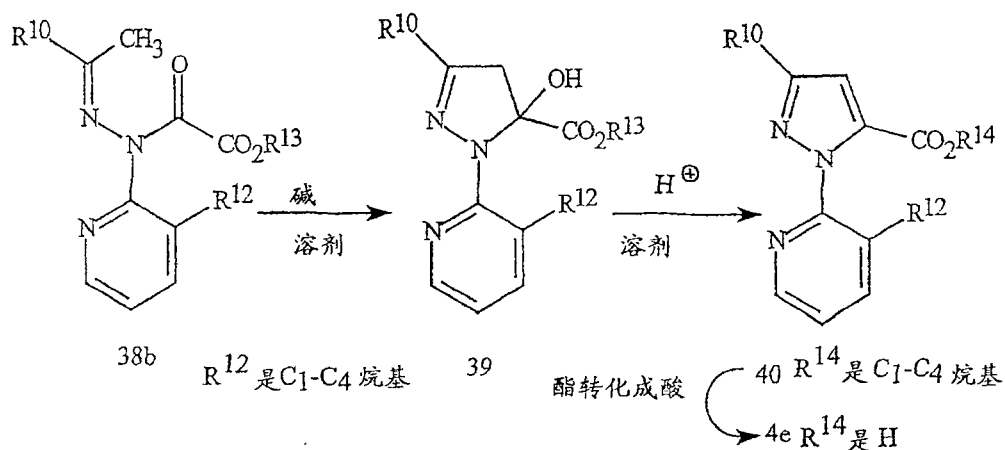
吡唑(其中 $R^5(d)$ 是 CF_3 的式 25 的化合物)可通过文献方法制得(J. Fluorine Chem. 1991, 53(1), 61-70)。式 25b 的吡唑(其中 $R^5(d)$ 是 Cl 或 Br 的式 25 的化合物)可通过文献方法制得(Chem. Ber. 1966, 99(10), 3350-7)。反应方案 18 中描述了可用于制备化合物 25b 的另一种方法。用正丁基锂将式 37 的氨基磺酰基吡唑金属化, 然后用六氯乙烷($R^5(d)$ 是 Cl)或 1,2-二溴四氯乙烷(对于 $R^5(d)$ 是 Br)将该阴离子直接卤化, 以获得式 38a 的卤化衍生物。在室温用三氟乙酸(TFA)除去氨基磺酰基的反应顺利地进行了, 以良好产率获得了式 25c 的吡唑。本领域技术人员应当认识到, 式 25c 是式 25b 的互变异构体。

反应方案 18



其中 R^{10} 是 CF_3 的式 4f 的吡唑羧酸可通过反应方案 19 中描述的方法制得。

反应方案 19

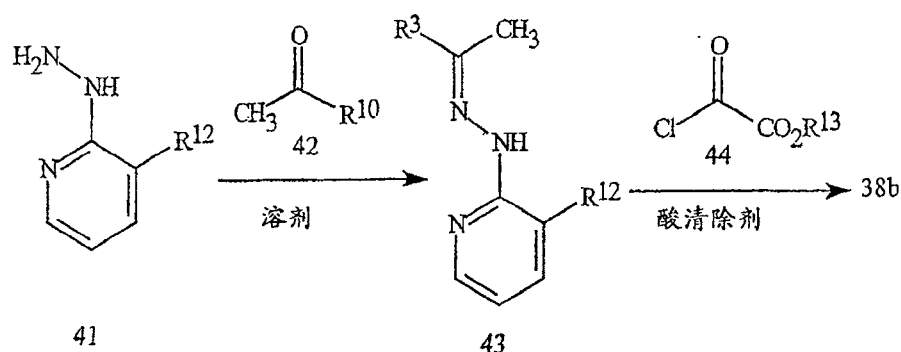


将其中 R^{12} 是 C_1 - C_4 烷基的式 38b 化合物与合适的碱在适当的有机溶剂中反应, 用酸例如乙酸中和后, 获得了式 39 的环合产物。合适的碱是例如但不限于氢化钠、叔丁醇钾、二甲基亚砷基钠 ($CH_3S(O)CH_2^-Na^+$)、碱金属(例如锂、钠或钾)碳酸盐或氢氧化物、氟化四烷基(例如甲基、乙基或丁基)铵或氢氧化铵或 2-叔丁基亚氨基-2-二乙基氨基-1, 3-二甲基-全氢-1, 3, 2-二氮杂磷杂环己烯(diazaphosphonine)。合适的有机溶剂例如但不限于丙酮、乙腈、四氢呋喃、二氯甲烷、二甲亚砷或 *N,N*-二甲基甲酰胺。该环合反应通常是在约 0-120℃ 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对于减少副产物的形成很重要。优选的碱是氟化四丁基铵。

将式 39 的化合物脱水以生成式 40 的化合物, 然后将羧酸酯官能团转化成羧酸, 获得式 4f 的化合物。脱水是用催化量的合适的酸进行的。催化的酸可以是例如但不限于硫酸。该反应一般是用有机溶剂进行的。本领域技术人员应当认识到, 脱水反应可在多种溶剂中, 在一般是约 0-200℃、更优选约 0-100℃ 的温度下进行。对于反应方案 19 方法中的脱水, 包含乙酸的溶剂以及约 65℃ 的温度是优选的。可通过多种方法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的亲核裂解或者使用酸或碱的水解方法(参见 T.W. Greene 和 P.G.M. Wuts, 有机合成中的保护基, 第二版, John Wiley & Sons, Inc., New York, 1991, pp. 224-269 关于方法的综述)。对于反应方案 19 的方法, 碱催化的水解方法是优选的。合适的碱包括碱金属(例如锂、钠或钾)氢氧化物。例如, 可将该酯溶解在水与醇例如乙醇的混合物中。通过用氢氧化钠或氢氧化钾处理, 酯被皂化以生成羧酸的钠盐或钾盐。用强酸例如盐酸或硫酸酸化, 生成了式 4f 的羧酸。可通过本领域技术人员已知的方法, 包括结晶、萃取和蒸馏来分离该羧酸。

式 38b 化合物可通过反应方案 20 中描述的方法制得。

反应方案 20

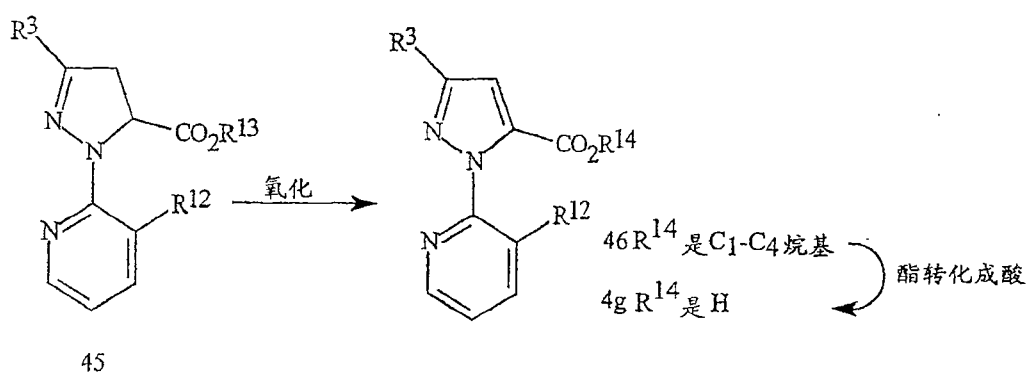


其中 R^3 是 CF_3 ，且 R^{13} 是 C_1-C_4 烷基。

在溶剂例如水、甲醇或乙酸中用式 42 的酮处理式 41 的胍化合物，以生成式 43 的脒。本领域技术人员应当认识到，该反应可能需要用任选的酸进行催化，并且还可能需要高温，这取决于式 43 的脒的分子取代方式。在合适的有机溶剂例如但不限于二氯甲烷或四氢呋喃中，在酸清除剂例如三乙胺存在下，将式 43 的脒与式 44 的化合物反应，以获得式 38 的化合物。该反应通常在约 $0-100^\circ C$ 温度下进行。式 98 的胍化合物可通过标准方法，例如通过将式 23 相应的卤代化合物(反应方案 15)与胍接触来制得。

其中 R^{10} 是 Cl 或 Br 的式 4g 的吡唑羧酸可通过反应方案 21 中描述的方法制得。

反应方案 21



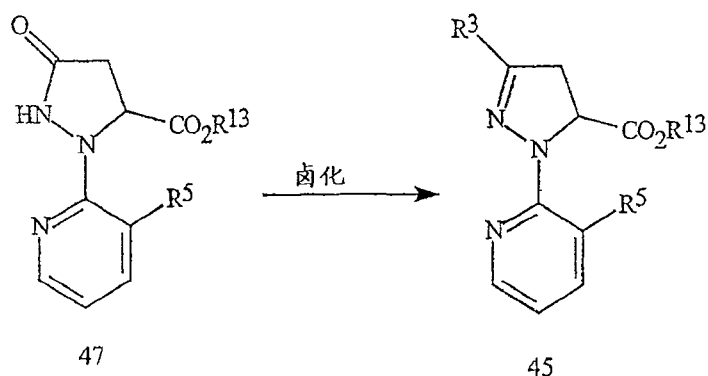
其中 R^{13} 是 C_1-C_4 烷基。

任选在酸存在下将式 45 的化合物氧化以生成式 46 的化合物，然后将羧酸酯官能团转化成羧酸，以获得式 4g 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。为了完全转化,相对于式 45 的化合物,应当使用至少 1 当量,优选约 1-2 当量氧化剂。该氧化反应一般在溶剂存在下进行。溶剂可以是醚例如四氢呋喃、对二氧杂环己烷等,有机酯例如乙酸乙酯、碳酸二甲酯等,或极性非质子有机溶剂例如 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。在使用时,相对于式 45 的化合物,酸的用量应当大于 0.1 当量。为了完全转化,可使用 1-5 当量酸。优选的氧化剂是过硫酸钾,并且该氧化反应优选在硫酸存在下进行。该反应可这样进行:将式 45 的化合物在所需溶剂以及(如果使用的话)酸中混和。然后可以以适宜速度加入氧化剂。反应温度一般从低至约 0℃ 到最高达溶剂的沸点,以获得合理的反应时间来完成该反应,反应时间优选小于 8 小时。可通过本领域技术人员已知的方法,包括结晶、萃取和蒸馏来分离出所需产物—式 46 的化合物。反应方案 19 中已经描述了适于将式 46 的酯转化成式 4g 的羧酸的方法。

式 45 化合物可如反应方案 22 所示由相应的式 47 化合物制得。

反应方案 22



其中 R¹³ 是 C₁-C₄ 烷基。

通常在溶剂存在下,用卤化试剂处理式 47 化合物,以获得式 45 相应的卤代化合物。可使用的卤化试剂包括三卤氧磷、三卤化磷、五卤化磷、亚硫酰氯、二卤代三烷基正膦、二卤代二苯基正膦、草酰氯和光气。三卤氧磷和五卤化磷是优选的。为了完全转化,相对于式 47 化合物,应当使用至少 0.33 当量,优选约 0.33-1.2 当量三卤氧磷。为了完全转化,相对于式 47 化合物,应当使用至少 0.20 当量,优选

约 0.20–1.0 当量五卤化磷。对于该反应，其中 R^{13} 是 C_1 – C_4 烷基的式 47 化合物是优选的。对于该卤化反应，典型的溶剂包括卤代烷烃例如二氯甲烷、氯仿、氯丁烷等，芳族溶剂例如苯、二甲苯、氯苯等，醚例如四氢呋喃、对二氧杂环己烷、乙醚等，和极性非质子溶剂例如乙腈、 N,N -二甲基甲酰胺等。可任选加入有机碱例如三乙胺、吡啶、 N,N -二甲基苯胺等。加入催化剂例如 N,N -二甲基甲酰胺也是一个选择。其中溶剂是乙腈，且不存在碱的方法是优选的。通常，当使用乙腈溶剂时，既不需要碱也不需要催化剂。优选的方法是这样进行：将式 47 化合物在乙腈中混和。然后用适宜时间加入卤化试剂，之后将该混合物在所需温度下保持直至反应完全。该反应温度一般为 20°C –乙腈的沸点，反应时间一般少于 2 小时。然后用无机碱例如碳酸氢钠、氢氧化钠等，或有机碱例如乙酸钠将该反应混合物中和。可通过本领域技术人员已知的方法，包括结晶、萃取和蒸馏来分离出所需产物—式 45 化合物。

或者，其中 R^{10} 是 Br 或 Cl 的式 45 化合物可通过分别用溴化氢或氯化氢处理其中 R^{10} 是不同卤素（例如 Cl，为了制备其中 R^{10} 是 Br 的式 45 化合物）或磺酸酯基例如对甲苯磺酸酯基的相应的式 45 化合物来制得。通过该方法，式 45 化合物上的 R^{10} 卤素或磺酸酯取代基分别被溴化氢或氯化氢中的 Br 或 Cl 置换。该反应是在合适的溶剂例如二溴甲烷、二氯甲烷或乙腈中进行。该反应可在耐压容器中于接近常压或常压以上的压力下进行。当式 45 原料化合物中的 R^{10} 是卤素例如 Cl 时，该反应优选以这样的方式进行，其中通过鼓泡或其它适当手段将反应所生成的卤化氢除去。该反应可在约 0 – 100°C ，最适宜地在接近室温（例如约 10 – 40°C ）的温度下，更优选在约 20 – 30°C 进行。加入路易斯酸催化剂（例如三溴化铝，为了制备其中 R^{10} 是 Br 的式 45 化合物）可促进该反应。可通过本领域技术人员已知的方法，包括萃取、蒸馏和结晶来分离出式 45 产物。

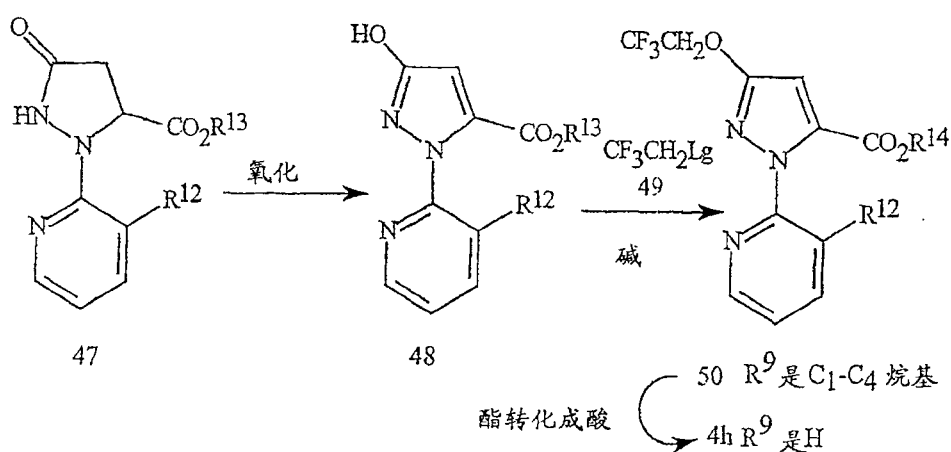
其中 R 是 Cl 或 Br 的式 45 原料化合物可由上述式 47 相应化合物制得。其中 R^{10} 是磺酸酯基的式 45 原料化合物可通过标准方法例如通过用磺酰氯（例如对甲苯磺酰氯）和碱例如叔胺（例如三乙胺）在合适的溶剂例如二氯甲烷中处理而由式 47 相应化合物制得。

其中 R^{10} 是 OCH_2CF_3 的式 4h 吡唑羧酸可通过反应方案 23 中描述的

方法制得。在该方法中，将如反应方案 22 中所示的被卤化代之以将式 47 化合物氧化成式 48 化合物。反应方案 21 中在描述将式 45 化合物转化成式 46 化合物时已描述了该氧化的反应条件。

然后通过碱存在下与烷化剂 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{Lg}$ (49) 接触来将式 48 化合物烷基化，以形成式 50 化合物。在烷化剂 49 中，Lg 是亲核反应离去基团例如卤素（例如 Br、I）、 $\text{OS}(\text{O})_2\text{CH}_3$ （甲磺酸酯）、 $\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $\text{OS}(\text{O})_2\text{Ph-p-CH}_3$ （对甲苯磺酸酯）等；甲磺酸酯是非常合适的。该反应在至少 1 当量碱存在下进行。合适的碱包括无机碱例如碱金属（例如锂、钠或钾）碳酸盐和氢氧化物，和有机碱例如三乙胺、二异丙基乙基胺和 1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯。该反应一般在溶剂中进行，所述溶剂可包括醇例如甲醇和乙醇，卤代烷烃例如二氯甲烷，芳族溶剂例如苯、甲苯和氯苯，醚例如四氢呋喃，和极性非质子溶剂例如乙腈、N,N-二甲基甲酰胺等。当使用无机碱时，醇和极性非质子溶剂是优选的。优选的是，使用碳酸钾作为碱，并且使用乙腈作为溶剂。该反应一般在约 0–150℃ 进行，最通常在室温–100℃ 进行。式 50 产物可通过常规技术例如萃取来分离。然后可通过反应方案 19 中在描述将式 40 化合物转化成式 4f 化合物时所述的方法将式 50 的酯转化成式 4h 的羧酸。

反应方案 23

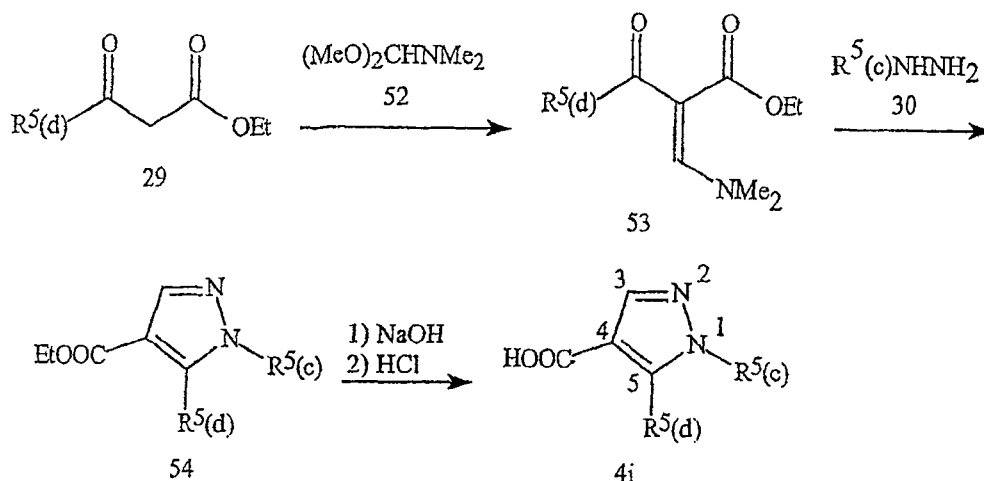


其中 R^8 是 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基，且 Lg 是离去基团。

式 47 化合物可如反应方案 24 所示由式 41 化合物制得（反应方案 20）。

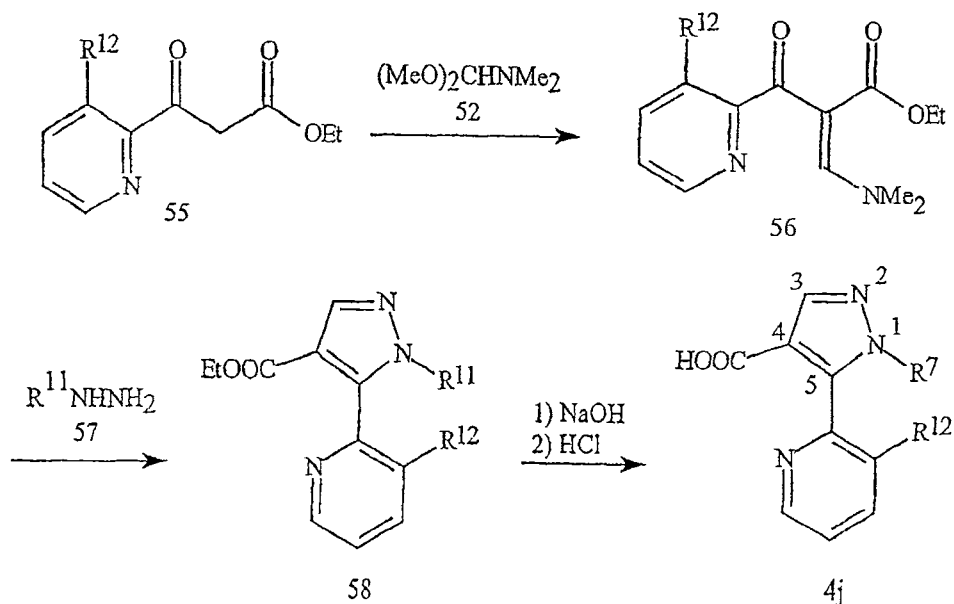
甲基氨基亚甲基酮酯与式 30 取代的肼反应以获得式 54 的吡唑。优选的 $R^5(c)$ 取代基包括烷基和卤代烷基, 其中 2,2,2-三氟乙基是特别优选的。通过标准水解方法将式 54 酯转化成式 4i 的酸。

反应方案 25



反应方案 26 中描述了式 4j 的吡唑酸的合成, 该吡唑酸涉及优选的基团 J-6, 其中 R^5 是连接在吡唑环的 5-位上的取代的 2-吡啶基。该合成是依据反应方案 27 中描述的一般合成进行的。

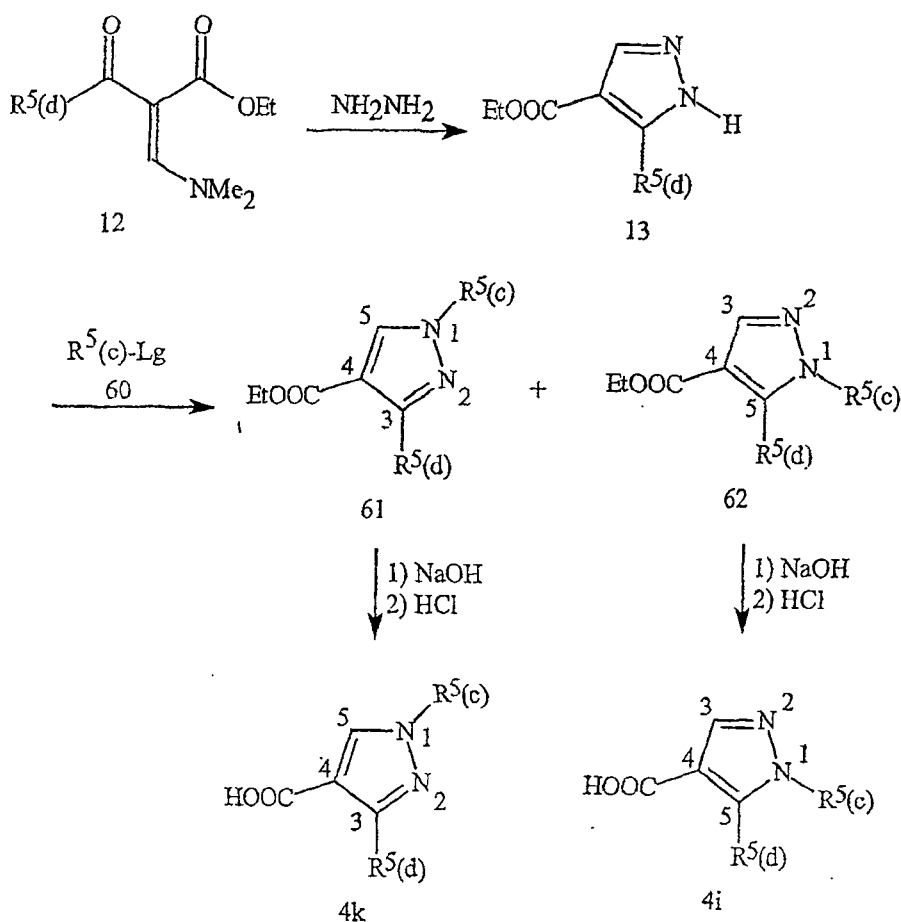
反应方案 26



反应方案 27 中描述了代表性式 4k 的吡唑酸的合成以及式 4i 的另

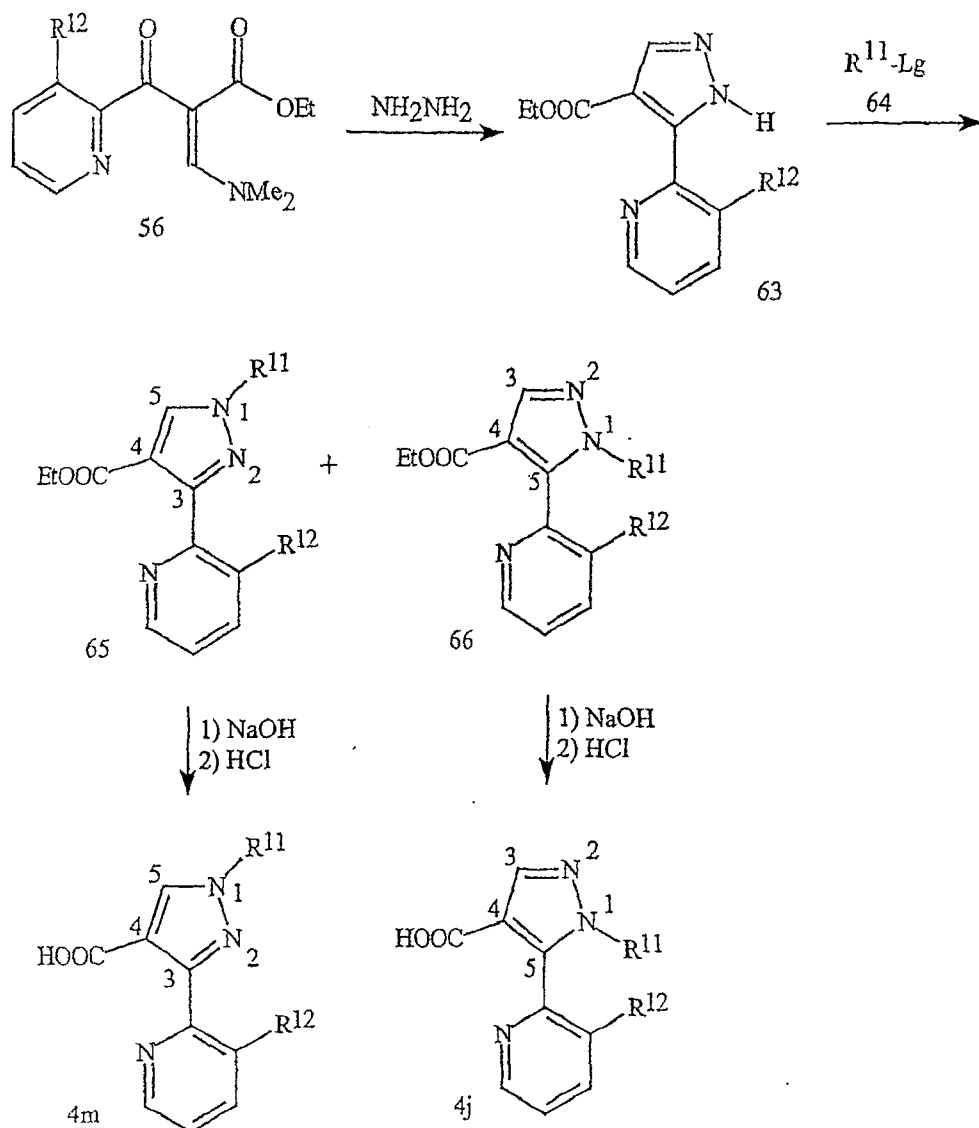
一合成。将式 53 的二甲基氨基亚甲基酮酯与肼反应以获得式 59 的吡唑。将吡唑 59 与式 60 的烷化剂 ($R^5(c)$ -Lg, 其中 Lg 是离去基团例如卤素 (例如 Br、I)、 $OS(O)_2CH_3$ (甲磺酸酯)、 $OS(O)_2CF_3$ 、 $OS(O)_2Ph-p-CH_3$ (对甲苯磺酸酯) 等) 反应以获得式 61 与 62 的吡唑的混合物。该吡唑异构体的混合物易于通过色谱法分离, 和转化成相应的酸。优选的 $R^5(c)$ 取代基包括烷基和卤代烷基。

反应方案 27



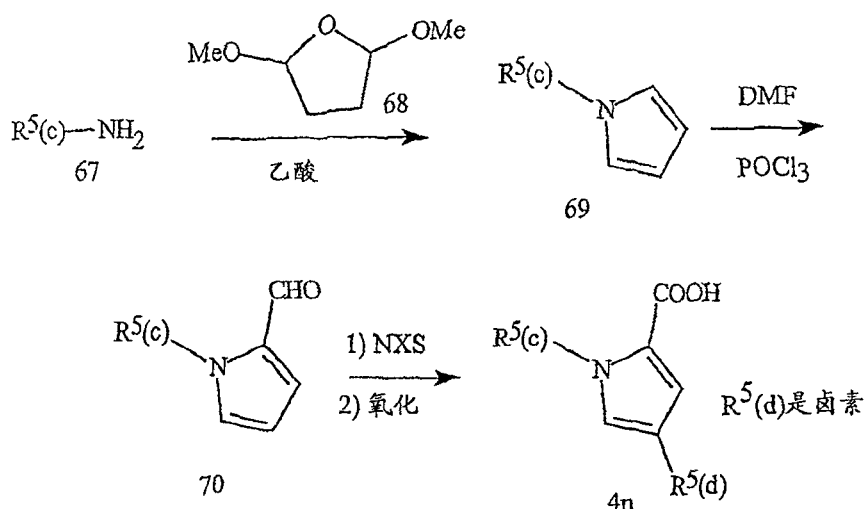
反应方案 28 中描述了式 4m 的吡啶基吡唑酸的合成以及式 4j 的另一合成, 其中式 4m 的吡啶基吡唑酸涉及 J-7, 其中 R^5 是取代的 2-吡啶基, 并连接在吡唑环的 3-位。该合成是依据反应方案 27 中描述的一般合成来进行的。

反应方案 28



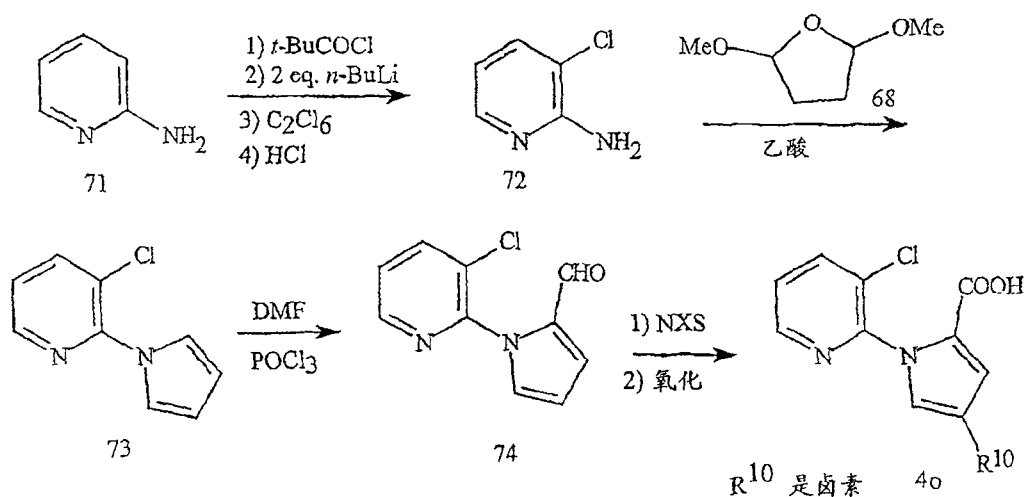
反应方案 29 中描述了式 4n 的吡唑酸的一般合成。用 2,5-二甲氧基四氢呋喃(68)处理式 67 化合物, 获得了式 69 的吡咯。使用标准 Vilsmeier-Haack 甲酰化条件例如 N,N-二甲基甲酰胺(DMF)和三氯氧化磷将吡咯 69 甲酰化以获得式 70 的醛。用 N-卤代琥珀酰亚胺(NXS)例如 N-氯代琥珀酰亚胺或 N-溴代琥珀酰亚胺将式 70 化合物卤化的反应优选在吡咯环的 4-位发生。将该卤代醛氧化, 以获得式 4n 的吡唑酸。该氧化可通过使用各种标准氧化条件来完成。

反应方案 29



反应方案 30 中描述了一些式 4o 的吡啶基吡咯酸的合成, 所述式 4o 吡啶基吡咯酸涉及式 J-8, 其中 R^5 是 2-吡啶基, 并连接在吡咯环的氮上。式 72 化合物—3-氯-2-氨基吡啶是已知化合物 (参见 J. Heterocycl. Chem. 1987, 24(5), 1313-16)。由式 71 的 2-氨基吡啶适当地制备式 72 化合物包括保护、邻位金属化、氯化以及随后脱保护。其余合成是依据反应方案 29 中描述的一般合成来进行的。

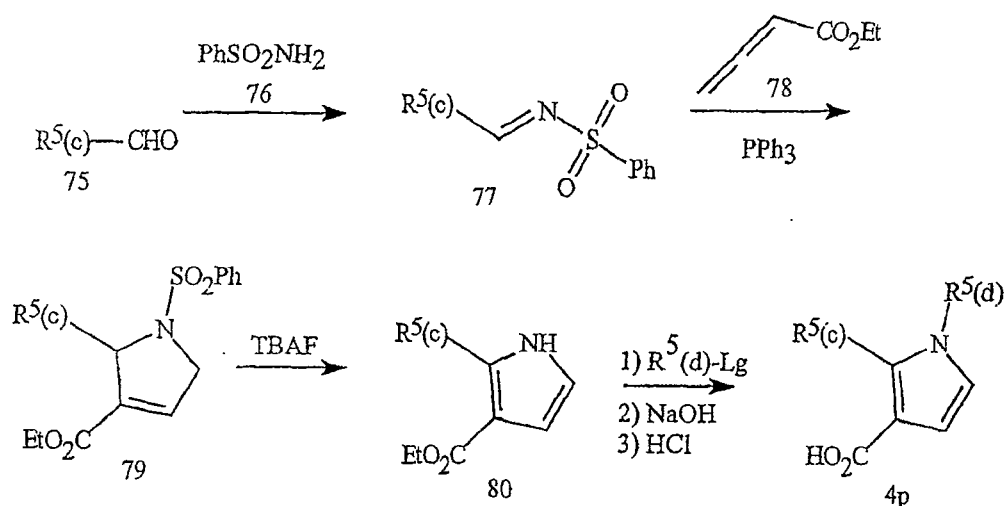
反应方案 30



反应方案 31 中描述了式 4p 的吡咯酸的合成。将式 78 的丙二烯与式 77 的苯基磺酰肼环加成 (参见 Pavri, N.P.; Trudell, M.L. J Org. Chem. 1997, 62, 2649-2651), 以获得式 79 的吡咯啉。用氟化四丁

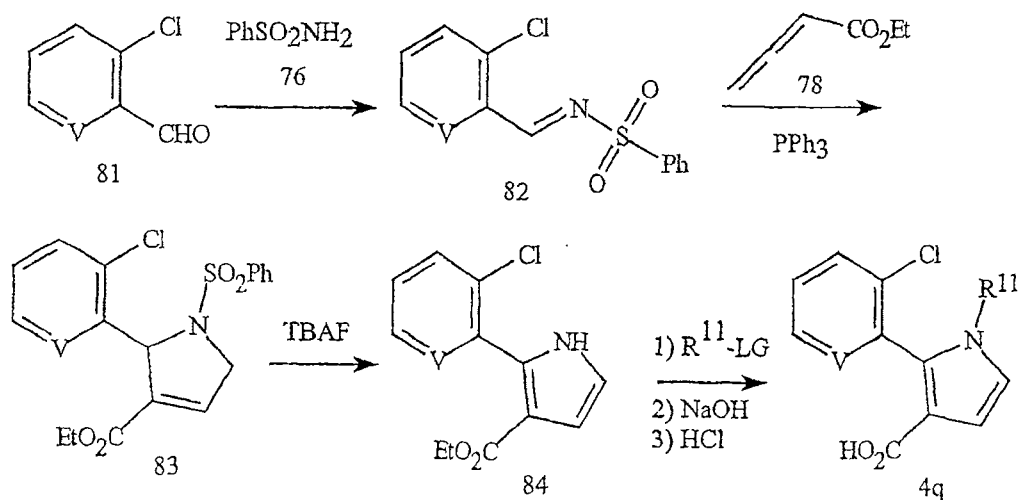
基铵 (TBAF) 处理式 79 吡咯啉, 以获得式 80 吡咯。将吡咯 80 与烷化剂 $R^5(d)-Lg$ (其中 Lg 是如上所定义的离去基团) 反应, 然后水解, 获得了式 4p 的吡唑酸。

反应方案 31



反应方案 32 中描述了式 4q 的吡唑酸的合成, 所述式 4q 的吡唑酸涉及式 J-9, 其中 R^5 是苯基或 2-吡啶基, 并且连接在吡唑环的 2-位。该合成是依据反应方案 31 中描述的一般方法来进行的。

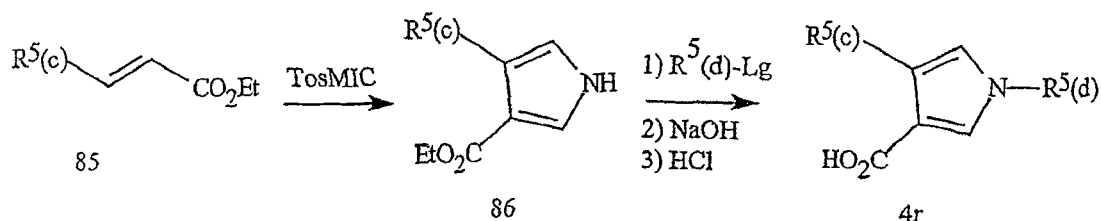
反应方案 32



反应方案 33 中描述了式 4r 的吡唑酸的合成。将式 85 所示 α, β -不饱和酯与对甲苯基磺酰基甲基异氰化物 (TosMIC) 反应, 获得了式 86

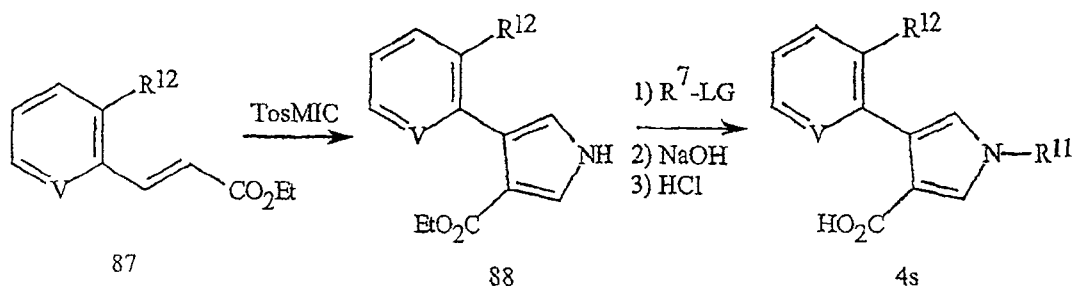
的吡咯。对于主要参考文献, 参见 Xu, Z. 等人, J. Org. Chem., 1988, 63, 5031-5041。将式 86 的吡咯与烷化剂 $R^5(d)-Lg$ (其中 Lg 是如上所定义的离去基团) 反应, 然后水解, 以获得式 4r 的吡咯酸。

反应方案 33



反应方案 35 中描述了式 4s 的吡咯酸的合成, 其中所述式 4s 的吡咯酸涉及式 J-6, 其中 R^5 是取代的苯基或取代的 2-吡啶基环。该合成是依据反应方案 33 中描述的一般方法来进行的。

反应方案 33



应当认识到, 上述用于制备式 I 化合物的某些试剂和反应条件可能与中间体中存在的一些官能团不相容。在这些实例中, 向合成中引入保护/脱保护顺序或官能团相互转换将有助于获得所需产物。保护基的应用和选择对于化学合成领域技术人员来说是显而易见的(参见例如 Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. 有机合成中的保护基, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991)。本领域技术人员应当认识到, 在某些情况下, 在如任何个别反应方案所述引入给定试剂之后, 可能需要进行没有详细描述另外的常规合成步骤来完成式 I 化合物的合成。本领域技术人员还应当认识到, 可能需要以不同于所示特定顺序的顺序联合进行上述反应方案中描述的步骤, 以制备式 I 化合物。

本领域技术人员还应当认识到, 可对本文描述的式 I 化合物和中间体进行各种亲电、亲核、自由基、有机金属、氧化和还原反应以加

上取代基或修饰已有取代基。

不用进一步解释，但是据信，通过使用上面的描述，本领域技术人员可在最大限度上利用本发明。因此，下列实施例仅是举例说明性的，并不是以任何方式限制本申请的公开内容。除了对于色谱用溶剂混合物或者除非另有说明，百分比是指重量百分比。除非另有说明，否则对于色谱用溶剂混合物来说，份数和百分比是按体积计的。¹H NMR 色谱是以相对于四甲基硅烷的 ppm 低场表示的；s 是指单峰，d 是指双峰，t 是指三重峰，q 是指四重峰，m 是指多重峰，dd 是指双双峰，dt 是指双三重峰，br s 是指宽的单峰，且 br d 是指宽的双峰。

实施例 1

制备 [2-甲基-6-[[(1-甲基乙基) 氨基] 磺酰基] 苯基]-4-(三氟甲氧基)

苯甲酰胺

步骤 A: 制备 3-甲基-N-(1-甲基乙基)-2-硝基苯磺酰胺

在 0℃，向异丙基胺 (13 mL, 155 mmol) 在 60 mL 二氯甲烷内的溶液中滴加 5.3 g 3-甲基-2-硝基苯磺酰氯 (依据 Courtin, A. Helv. China. Acta, 1976, 59, 379-387 制得的) 在 60 mL 二氯甲烷中的溶液。将该反应混合物在室温搅拌 2 小时。加入水，分离各层。将有机层干燥 (硫酸钠)，用旋转蒸发仪除去挥发性组分。通过中压液相色谱 (MPLC) 纯化该残余物，使用 20-40% 乙酸乙酯在己烷中的混合物洗脱，获得了 4.3 g 本标题化合物，为黄色固体。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.12 (d, 6H), 2.39 (s, 1H), 3.56 (m, 1H), 4.65 (br d, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.91 (dd, 1H).

步骤 B: 制备 2-氨基-3-甲基-N-(1-甲基乙基) 苯磺酰胺

向 4.13 g 步骤 A 产物与 0.25 g 10% 披钨炭的混合物中加入 150 mL 乙醇。将该反应混合物在氢气球气氛下搅拌 3 天。将该混合物经由硅藻土过滤，用旋转蒸发仪除去溶剂，获得了 3.65 g 本标题化合物，为棕色油状物。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.03 (d, 6H), 2.21 (s, 1H), 3.60 (m, 1H), 4.57 (br d, 1H), 4.86 (br s, 2H), 6.73 (dd, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.64 (d, 1H).

步骤 C: 制备 N-[2-甲基-6-[[(1-甲基乙基) 氨基] 磺酰基] 苯基]-4-(三

氟甲氧基)苯甲酰胺

向在 5 mL 氯仿内的 0.30 g (1.4 mmol) 步骤 B 产物中加入 0.28 mL (3.5 mmol) 吡啶和 0.27 mL (1.7 mmol) 4-(三氟甲氧基)苯甲酰氯。将该反应混合物在室温搅拌过夜, 然后加热回流 5 小时。冷却至室温后, 用 1N HCl 将该反应混合物洗涤, 干燥(硫酸钠), 并过滤。用旋转蒸发仪除去挥发性物质。通过 MPLC 纯化该残余物(使用 5-25% 乙酸乙酯在己烷中的混合物洗脱), 获得了 0.10 g 本标题化合物——一种本发明化合物, 为白色固体, 熔点为 104-107℃。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 0.99 (d, 6H), 2.36 (s, 1H), 3.32 (m, 1H), 4.07 (br d, 1H), 7.35 (m, 3H), 7.56 (d, 1H), 7.89 (d, 1H), 8.05 (d, 2H), 8.78 (br s, 1H).

实施例 2

制备 2-[[[1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-基]磺酰基]氨基]-3-甲基-N-(1-甲基乙基)苯甲酰胺

步骤 A: 制备 3-氯-2-[3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]吡啶

向 2, 3-二氯吡啶(99.0 g, 0.67 mol)和 3-三氟甲基吡唑(83 g, 0.61 mol)在无水 N,N-二甲基甲酰胺(300 mL)内的混合物中加入碳酸钾(166.0 g, 1.2 mol), 然后将该混合物在 110-125℃ 加热 48 小时。将该反应冷却至 100℃, 经由硅藻土滤器过滤以除去固体。通过在常压下蒸馏来除去 N,N-二甲基甲酰胺和过量二氯吡啶。将产物减压蒸馏(b. p. 139-141℃, 7 mm), 获得了所需中间体, 为澄清的黄色油状物(113.4 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 6.78 (s, 1H), 7.36 (t, 1H), 7.93 (d, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.45 (d, 1H).

步骤 B: 制备 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-亚磺酸锂

在 -78℃, 向异丙基胺(2.5 mL, 30 mmol)在 25 mL 四氢呋喃内的溶液中滴加 7.1 mL (18 mmol) 2.5M 正丁基锂的己烷溶液。在 -78℃, 将该溶液经由插管加到 4.0 g 3-氯-2-[3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]吡啶(即步骤 A 的标题产物)在 50 mL 四氢呋喃内的溶液中。该反应混合物变为橙色。15 分钟后, 再加入 20 mL 四氢呋喃。向该溶液中通入

二氧化硫 5 分钟。橙色消失。15 分钟后，将该反应混合物过滤，用旋转蒸发仪将溶剂从滤液中除去。用乙醚研制残余物，获得了 4.53 g 本标题化合物，为灰白色固体。

$^1\text{H NMR}$ (D_2O) δ 7.08 (s,1H), 7.72 (dd,1h), 8.24 (dd,1h), 8.55 (dd,1h).

步骤 C: 制备 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-磺酸

向 100 mL pH 6 缓冲液(通过将 1.2 g (10 mmol)磷酸二氢钠溶解在 100 mL 水中，并加入 11.2 mL 1N 氢氧化钠来制得的)中加入 3.52 g (11.1 mmol)步骤 B 标题产物。将该溶液在冰浴中冷却，加入 75 mL 乙酸乙酯和 1.48 g (11.1 mmol) N-氯琥珀酰亚胺。30 分钟后，分离各层。将有机层干燥(硫酸钠)，用旋转蒸发仪除去溶剂。向残余物中加入四氯化碳，通过过滤除去固体。用旋转蒸发仪将溶剂从滤液中除去，获得了 2.84 g 本标题化合物，为琥珀色油状物。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 7.45 (s,1H), 7.58 (dd,1h), 8.01 (dd,1h), 8.58 (dd,1h).

步骤 D: 制备 3-甲基-N-(1-甲基乙基)-2-硝基苯甲酰胺

将 3-甲基-2-硝基苯甲酸(2.00 g, 11.0 mmol)和三乙胺(1.22 g, 12.1 mmol)在 25 mL 二氯甲烷中的溶液冷却至 10℃。小心地加入氯甲酸乙酯，形成了固体沉淀。将该混合物搅拌 30 分钟后，加入异丙基胺(0.94 g, 16.0 mmol)，形成了均匀溶液。将该反应混合物再搅拌 1 小时，倒入水中，用乙酸乙酯萃取。用水洗涤该有机萃取液，用硫酸镁干燥，减压蒸发，获得了 1.96 g 所需中间体，为白色固体，熔点为 126 - 128℃。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 1.24 (d,6H), 2.38 (s,3H), 4.22 (m,1H), 5.80 (br s,1H), 7.4 (m,3H).

步骤 E: 制备 2-氨基-3-甲基-N-(1-甲基乙基)苯甲酰胺

在 40 mL 乙醇中，在 5%披钨炭存在下，将步骤 D 的 2-硝基苯甲酰胺(1.70 g, 7.6 mmol)在 345 kPa (50 psi)压力下氢化。当氢的摄取停止时，将该反应经由硅藻土过滤器过滤，用乙醚洗涤硅藻土。将滤液减压蒸发，获得了 1.41 g 本标题化合物，为固体，熔点为 149 - 151℃。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.24 (dd, 6H), 2.16 (s, 3H), 4.25 (m, 1H), 5.54 (br s, 2H), 5.85 (br s, 1H), 6.59 (t, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.17 (d, 1H).

步骤 F: 制备 2-[[[1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-基]磺酰基]氨基]-3-甲基-N-(1-甲基乙基)苯甲酰胺

向在 70 mL 二氯甲烷内的 2.84 g (10.2 mmol) 1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-5-磺酸(即步骤 C 标题产物)中加入 1.96 g (10.2 mmol) 2-氨基-3-甲基-N-(1-甲基乙基)苯甲酰胺(即步骤 E 标题产物)、1.78 mL (10.2 mmol) 二异丙基乙胺和约 5 mg 4-(二甲氨基)吡啶。将该反应混合物搅拌 9 小时,然后用水洗涤,并干燥(硫酸钠)。用旋转蒸发仪除去溶剂。通过 MPLC 纯化该残余物(使用 20-40% 乙酸乙酯在己烷中的混合物洗脱),获得了 0.50 g 本标题化合物,为泡沫状白色固体,熔点为 69-72℃。

^1H NMR (CDCl_3) δ 0.112 (d, 6H), 2.32 (s, 1H), 3.85 (m, 1H), 5.96 (brd, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.35 (m, 3H), 7.39 (dd, 1H), 7.89 (dd, 1H), 8.20 (dd, 1H), 9.26 (s, 1H).

实施例 3

制备 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[2-甲基-6-(3-甲基-1-氧代丁基)苯基]-1H-吡唑-5-甲酰胺

步骤 A: 制备 3-溴-N,N-二甲基-1H-吡唑-1-磺酰胺

在-78℃,向 N,N-二甲基氨基磺酰基吡唑(44.0 g, 0.251 mol)在无水四氢呋喃(500 mL)内的溶液中滴加正丁基锂溶液(2.5 M 己烷溶液, 105.5 mL, 0.264 mol),同时将温度保持在-60℃以下。在加入期间形成了浓厚的固体。加入完成后,将该反应混合物再保持 15 分钟,然后滴加 1,2-二溴-四氯乙烷(90 g, 0.276 mol)在四氢呋喃(150 mL)中的溶液,同时将温度保持在-70℃以下。该反应混合物变为澄清的橙色,继续搅拌 15 分钟。移去该-78℃浴,用水(600 mL)中止该反应。用二氯甲烷萃取该反应混合物(4×),用硫酸镁将有机萃取液干燥,并浓缩。通过硅胶色谱进一步纯化该粗产物,使用二氯甲烷-己烷(50:50)洗脱,获得了本标题化合物,为澄清的无色油状物(57.04 g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.07 (d, 6H), 6.44 (m, 1H), 7.62 (m, 1H).

步骤 B: 制备 3-溴吡唑

向三氟乙酸 (70 mL) 中缓慢地加入 3-溴-N,N-二甲基-1H-吡唑-1-磺酰胺 (即步骤 A 的溴代吡唑产物) (57.04 g)。将该反应混合物在室温搅拌 30 分钟, 然后减压浓缩。将残余物置于己烷中, 过滤出不溶固体, 将己烷蒸发, 获得了粗产物。通过硅胶色谱进一步纯化该粗产物, 使用乙酸乙酯/二氯甲烷 (10:90) 洗脱, 获得了油状物。将该油状物置于二氯甲烷中, 用碳酸氢钠水溶液中和, 用二氯甲烷萃取 (3×), 用硫酸镁干燥, 并浓缩, 获得了本标题化合物, 为白色固体 (25.9 g), m. p. 61 - 64 °C。

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

步骤 C: 制备 2-(3-溴-1H-吡唑-1-基)-3-氯吡啶

向 2,3-二氯吡啶 (27.4 g, 185 mmol) 和 3-溴吡唑 (即步骤 B 产物) (25.4 g, 176 mmol) 在无水的 N,N-二甲基甲酰胺 (88 mL) 内的混合物中加入碳酸钾 (48.6 g, 352 mmol), 将该反应混合物在 125 °C 加热 18 小时。将该反应混合物冷却至室温, 并倒入冰水 (800 mL) 内。形成了沉淀。将沉淀固体的水混合物搅拌 1.5 小时, 过滤, 并用水 (2×100 mL) 洗涤。将固体滤饼置于二氯甲烷中, 依次用水、1N 盐酸、饱和碳酸氢钠水溶液和盐水洗涤。然后用硫酸镁将有机萃取液干燥, 浓缩, 获得了 39.9 g 粉红色固体。将固体粗产物悬浮在己烷中, 剧烈搅拌 1 小时。将固体过滤, 用己烷洗涤, 获得了本标题化合物, 为灰白色粉末 (30.4 g), 通过 NMR 测定纯度大于 > 94%。该产物不用进一步纯化而直接用于步骤 D 中。

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

步骤 D: 制备 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酸

在 -76 °C, 向 2-(3-溴-1H-吡唑-1-基)-3-氯吡啶 (即步骤 C 的吡唑产物) (30.4 g, 118 mmol) 在无水的四氢呋喃 (250 mL) 内的溶液中以把温度保持在 -71 °C 以下的速度滴加二异丙基氨基锂 (118 mmol) 在四氢呋喃中的溶液。将反应混合物在 -76 °C 搅拌 15 分钟, 然后通入 10 分钟的二氧化碳, 这使温度升至 -57 °C。将该反应混合物温热至 -20 °C,

用水中止反应。将该反应混合物浓缩，然后置于水(1 L)和乙醚(500 mL)中，加入 1N 氢氧化钠水溶液(20 mL)。用乙醚萃取该水萃取液，用盐酸酸化。过滤出沉淀的固体，用水洗涤，干燥，获得了本标题化合物，为黄褐色固体(27.7 g)。

(以类似方法获得的另一批产物的熔点为 200 - 201 °C)

^1H NMR (DMSO- d_6) δ 7.25 (s, 1H), 7.68 (dd, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.56 (d, 1H).

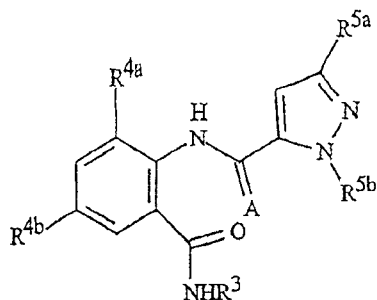
步骤 E: 制备 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-N-[2-甲基-6-(3-甲基-1-氧代丁基)苯基]-1H-吡唑-5-甲酰胺

向 3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酸(即步骤 D 的吡唑产物)(500 mg, 1.65 mmol)在二氯甲烷(10 mL)内的溶液中加入 1 滴 N,N-二甲基甲酰胺。加入草酰氯(0.43 mL, 5 mmol)，将该混合物在 23 °C 搅拌 1 小时。减压除去溶剂，将残余物用乙腈(20 mL)稀释，再次减压除去溶剂。将残余物溶解在四氢呋喃(10 mL)中，用依据 Chem. Pharm. Bull., 2000, 48, 1-15 制得的 1-(2-氨基-3-甲基苯基)-3-甲基-1-丁酮(330 mg, 1.6 mmol)处理，最后用三乙胺(0.45 mL, 3.2 mmol)处理。将该混合物在 60 °C 加热 1 小时。将该冷却的反应混合物用乙酸乙酯(50 mL)和水(50 mL)稀释。将有机层用水(2×30 mL)和 1N 盐酸(2×30 mL)洗涤。用硫酸镁将分离出来的有机层干燥，减压蒸发至干。通过硅胶色谱纯化该残余物，用乙酸乙酯/己烷(3:7)洗脱。将合适的级份合并，除去溶剂后，获得了本标题化合物——一种本发明化合物(210 mg)，为黄色固体，熔点为 119 - 120 °C。

^1H NMR (CDCl_3) δ 0.97 (d, 6H), 2.21 (s, 3H), 2.84 (d, 2H), 7.06 (s, 1H), 7.21 (m, 1H), 7.4 (m, 2H), 7.62 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 8.42 (d, 1H), 10.6 (br, 1H).

通过本文所述方法以及本领域已知方法，可制得下表 1-12 中的化合物。在下表中使用下列缩写：i 是指异-，Me 是指甲基，Pr 是指丙基，i-Pr 是指异丙基，Ph 是指苯基，OMe 是指甲氧基，SMe 是指甲硫基，CN 是指氰基，NO₂ 是指硝基。

表1



A是NOMe					A是NNMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基

A是NOMe					A是NNMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基

A是NOMe					A是NNMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基

A是NOMe					A是NNMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

A是S=O					A是N-CN				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基

A是S=O					A是N-CN				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

A是S=O					A是N-CN				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

A是S=O					A是N-CN				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

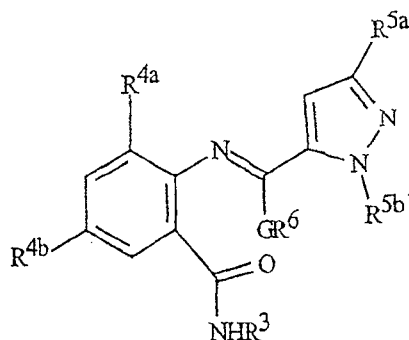
A是N-NO ₂					A是NMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基

A是N-NO ₂					A是NMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Br	i-Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	i-Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基

A是N-NO ₂					A是NMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

A是N-NO ₂					A是NMe				
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

表2



GR ⁶ 是OMe					GR ⁶ 是SMe				
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

GR ⁶ 是OMe					GR ⁶ 是SMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

GR ⁶ 是OMe					GR ⁶ 是SMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

GR ⁶ 是OMe					GR ⁶ 是SMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

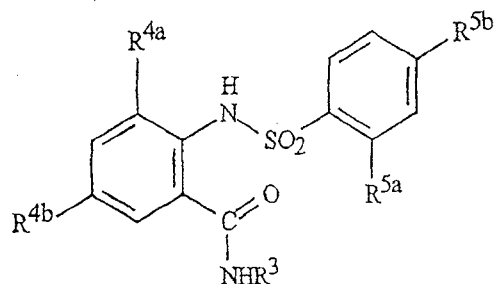
GR ⁶ 是OMe					GR ⁶ 是SMe				
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
GR ⁶ 是SCH ₂ Ph					GR ⁶ 是NMe ₂				
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基

GR ⁶ 是SCH ₂ Ph					GR ⁶ 是NMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基

GR ⁶ 是SCH ₂ Ph					GR ⁶ 是NMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

GR ⁶ 是SCH ₂ Ph					GR ⁶ 是NMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

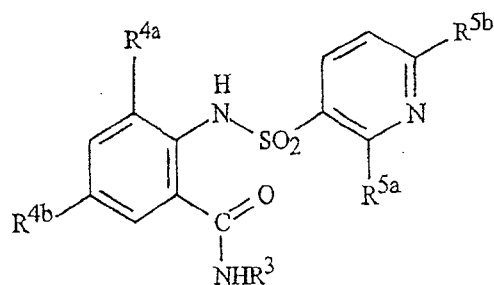
表3



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

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Br	Me	Me	CF ₃	Me	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Br	Me	Me	CF ₃	Cl	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	H	Me	Me	OCF ₃	Cl	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Me	Me	OCF ₃	Me	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	Me	Me	OCF ₃	Cl	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Br	Me	Me	OCF ₃	Me	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	Me	Me	OCF ₃	Cl	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂

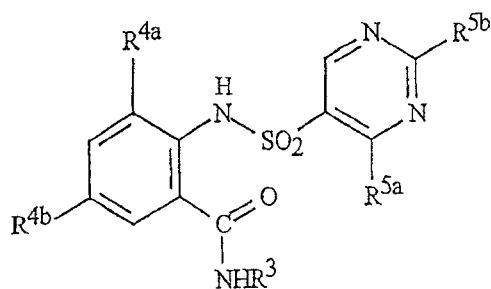
表 4



<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	H	Me	Me	CF ₃	Cl	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Cl	Me	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Me	Me	CF ₃	Cl	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Br	Me	Me	CF ₃	Me	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Br	Me	Me	CF ₃	Cl	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	H	Me	Me	OCF ₃	Cl	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Me	Me	OCF ₃	Me	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	Me	Me	OCF ₃	Cl	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Br	Me	Me	OCF ₃	Me	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	Me	Me	OCF ₃	Cl	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂

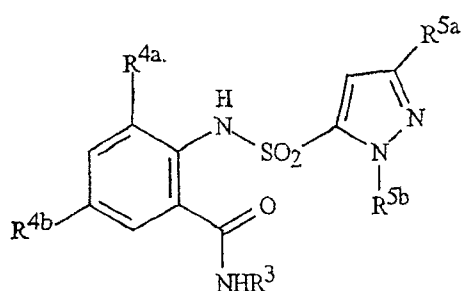
表5



<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	H	Me	Me	CF ₃	Cl	H	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Cl	Me	Me	CF ₃	Me	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Cl	Me	Me	CF ₃	Cl	Cl	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Br	Me	Me	CF ₃	Me	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Cl	Br	Me	Me	CF ₃	Cl	Br	Me	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	OCF ₃	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	H	Me	Me	OCF ₃	Cl	H	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Me	Me	OCF ₃	Me	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Cl	Me	Me	OCF ₃	Cl	Cl	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Br	Me	Me	OCF ₃	Me	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂
Cl	Br	Me	Me	OCF ₃	Cl	Br	Me	Me	CF(CF ₃) ₂

表6



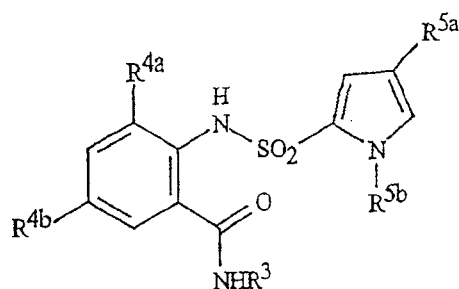
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基

<u>R4a</u>	<u>R4b</u>	<u>R3</u>	<u>R5a</u>	<u>R5b</u>	<u>R4a</u>	<u>R4b</u>	<u>R3</u>	<u>R5a</u>	<u>R5b</u>
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

表7



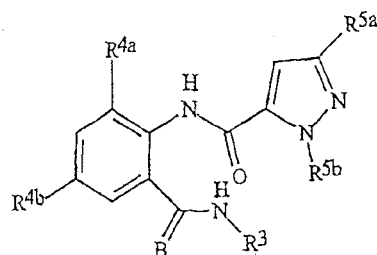
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

表8



<u>B是NOMe</u>					<u>B是NNMe₂</u>				
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

B是NOMe					B是NNMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

B是NOMe					B是NNMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

B是NOMe					B是NNMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

B是NOMe					B是NNMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

B是S=O					B是N-CN				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基

B是S=O					B是N-CN				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基

B是 S=O					B是 N-CN				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基

B是S=O					B是N-CN				
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

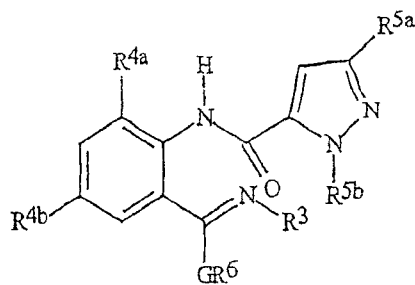
B是N-NO ₂					B是NMe				
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基

B是N-NO ₂					B是NMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基

B是N-NO ₂					B是NMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基

B是N-NO ₂					B是NMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

表9



GR ⁶ 是OMe					GR ⁶ 是SMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基

GR ⁶ 是OMe					GR ⁶ 是SMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基

GR ⁶ 是OMe					GR ⁶ 是SMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基

GR ⁶ 是OMe					GR ⁶ 是SMe				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2- 吡啶基

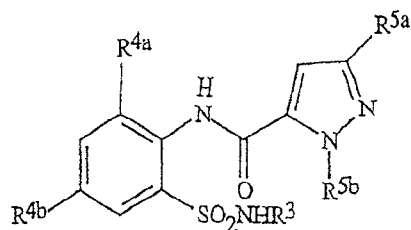
GR ⁶ 是SCH ₂ Ph					GR ⁶ 是NMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基

GR ⁶ 是SCH ₂ Ph					GR ⁶ 是NMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2- 吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基

GR ⁶ 是SCH ₂ Ph					GR ⁶ 是NMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基

GR ⁶ 是 SCH ₂ Ph					GR ⁶ 是 NMe ₂				
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

表10



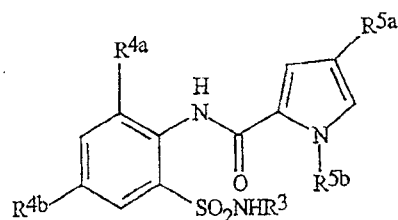
R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl-苯基

<u>R4a</u>	<u>R4b</u>	<u>R3</u>	<u>R5a</u>	<u>R5b</u>	<u>R4a</u>	<u>R4b</u>	<u>R3</u>	<u>R5a</u>	<u>R5b</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl-苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基

<u>R4a</u>	<u>R4b</u>	<u>R3</u>	<u>R5a</u>	<u>R5b</u>	<u>R4a</u>	<u>R4b</u>	<u>R3</u>	<u>R5a</u>	<u>R5b</u>
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

表11



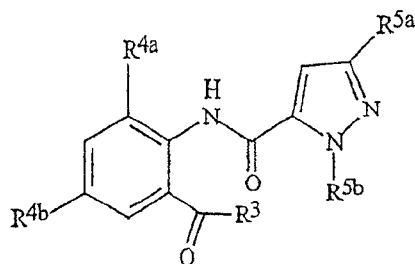
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ³	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

表12



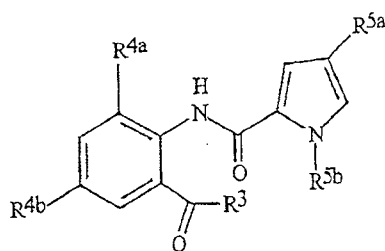
<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl-苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

表13



<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	2-Cl-苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	CF ₃	3-Cl-2-吡啶基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Br	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Br	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	Cl	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	Cl	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基

<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	<i>i</i> -Pr	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	H	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Cl-2-吡啶基
Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	H	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Me	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	2-Cl- 苯基
Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	H	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Cl	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Me	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基
Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基	Cl	Br	Me	OCHF ₂	3-Cl-2-吡啶基

制剂/用途

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

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

重量百分比			
	活性组分	稀释剂	表面活性剂
水可分散和水溶性粒剂、片剂和粉末剂	5 - 90	0 - 94	1 - 15
悬浮液、乳液、溶液(包括可乳化的浓缩液)	5 - 50	40 - 95	0 - 15
粉剂	1 - 25	70 - 99	0 - 5
粒剂和丸剂	0.01 - 99	5 - 99.99	0 - 15
高强度组合物	90 - 99	0 - 10	0 - 2

在 Watkins 等的《Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers》(杀虫剂粉末吸收剂和载体手册)第二版(Dorland Books, Caldwell, New Jersey)中对典型的固体稀释剂作了描述。在 Marsden 的《Solvents Guide》(溶剂指南)第二版(Interscience, New York, 1950)中对典型的液体稀释剂作了描述。在《McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual》(McCutcheon 洗涤剂 and 乳化

剂年报, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey) 以及 Sisely 和 Wood 的《Encyclopedia of Surface Active Agents》(表面活性剂百科全书, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964) 中列举了表面活性剂和推荐的应用。所有的制剂可含有少量的添加剂, 以减缓泡沫、结块、腐蚀、微生物生长等, 或含有增稠剂, 以增加粘度。

表面活性剂包括例如: 聚乙氧基化的醇、聚乙氧基化的烷基酚、聚乙氧基化的脱水山梨糖醇脂肪酸酯、磺基琥珀酸二烷基酯、烷基硫酸盐、烷基苯磺酸盐、有机硅氧烷、N,N-二烷基牛磺酸盐、木质素磺酸盐、萘磺酸盐甲醛缩合物、聚羧酸盐和聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物。固体稀释剂包括例如粘土如膨润土、蒙脱土、硅镁土和高岭土, 淀粉、糖、二氧化硅、滑石、硅藻土、尿素、碳酸钙、碳酸钠和碳酸氢钠以及硫酸钠。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、亚麻子油、桐油、芝麻油、玉米油、花生油、棉籽油、豆油、油菜籽油、椰子油、脂肪酸酯, 酮类如环己酮、2-庚酮、异佛尔酮和 4-羟基-4-甲基-2-戊酮, 以及醇类如甲醇、环己醇、癸醇和四氢糠醇。

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

有关制剂领域的进一步信息, 参见 T.S. Woods 的“The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture

(制剂工作者工具箱－现代农业的产品形式)”，收于《Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food－Environment Challenge》(杀虫剂化学和生物科学，食品－环境挑战)，T. Brooks 和 T.R. Roberts 编辑，第9届国际杀虫剂化学大会科研报告集，剑桥，1999年，第120－133页。另外参见：U.S. 3,235,361 第6栏第16行至第7栏第19行及实施例10－41；U.S. 3,309,192 第5栏第43行至第7栏第62行及实施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138－140、162－164、166、167和169－182；U.S. 2,891,855 第3栏第66行至第5栏第17行及实施例1－4；Klingman 著《Weed Control as a Science》(杂草控制科学)，John Wiley and Sons 公司出版，纽约，1961年，第81－96页；和 Hance 等著《Weed Control Handbook》(杂草控制手册)第8版，Blackwell Scientific Publications 出版，牛津，1989年。

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

实施例 A

可湿润的粉末剂

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

实施例 B

颗粒剂

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

实施例 C

挤压成形的丸剂

化合物 1	25.0%
无水硫酸钠	10.0%
粗木质素磺酸钙	5.0%

烷基萘磺酸钠	1.0%
钙/镁膨润土	59.0%

实施例 D

可乳化的浓缩液

化合物 1	20.0%
油溶性磺酸盐和聚氧乙烯醚 的掺合物	10.0%
异佛尔酮	70.0%

实施例 E

颗粒剂

化合物 1	0.5%
纤维素	2.5%
乳糖	4.0%
玉米粉	93.0%

本发明化合物的特征在于有利的代谢和/或土壤残留模式，且显示对一定范围的农业和非农业无脊椎害虫的防治活性。（在本发明的说明书范围内，“无脊椎害虫防治”意味着抑制无脊椎害虫的生长（包括致死），显著减少其摄食量或害虫引起的其它伤害；相关的表述定义类似）。就本说明书而言，术语“无脊椎害虫”包括具有经济重要性的节肢类、腹足类、线虫类害虫。术语“节肢类”包括昆虫、螨、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、百足虫、球潮虫和总和纲（symphylans）。术语“腹足类”包括蜗牛、蛞蝓（slugs）和其它柄眼目（Stylommatophora）。术语“线虫类”包括所有的蠕虫，如：蛔虫，犬心虫，植食性线虫类（线虫纲），吸虫（Tematoda），棘头虫纲，以及绦虫（多节绦虫纲）。本领域的技术人员应认识到，并非所有的化合物对于所有的害虫具有相同的效力。本发明的化合物显示了对经济上具重要性的农业和非农业害虫的活性。术语“农业”是指田野农作物生产例如用于食物和纤维的农作物生产，包括谷类作物（例如小麦、燕麦、大麦、黑麦、稻米、玉米）、豆类作物、蔬菜作物（例如莴苣、卷心菜、番茄、黄豆）、土豆、甘薯、葡萄、棉花和树生水果（例如梨果、核果和柑橘类水果）的生长。

术语“非农业”是指其它园艺（例如林业、温室、苗圃或不在田野生长的观赏性植物）、公共(人)和动物健康、家用和商用建筑、家用品和贮存品的应用或害虫。由于无脊椎害虫防治范围和在经济上的重要性，通过控制无脊椎害虫来保护（不受无脊椎害虫的破坏或损伤）棉花、玉米、豆类、稻米、蔬菜作物、土豆、甘薯葡萄和树生水果的农作物是本发明的优选实施方案。农业或非农业害虫包括鳞翅目的幼虫，如夜蛾科族的粟蚕蛾幼虫（armyworms），切根虫（cutworms），尺蠖（loopers），以及 heliothines（例如：秋粟蚕蛾幼虫（*Spodoptera fugiperda* J.E. Smith），甜菜粟蚕蛾幼虫（*Spodoptera exigua*. Hübner），黑切根虫（*Agrotis ipsilon* Hufnagel），卷心菜尺蠖（粉斑夜蛾，*Trichoplusia ni* Hübner），烟草蚜虫（*Heliothis virescens* Fabricius））；螟蛾科族的蛀虫，鞘蛾，结网毛虫，锥形虫（coneworms），卷叶菜虫和骨化虫（skeletonizers）（例如：欧洲玉米钻孔虫（*Ostrinia nubilalis* Hübner），脐橙虫（*Amyelois transitella* Walker），玉米根结网毛虫（*Crambus caliginosellus* Clemens），草地结网毛虫（*Herpetogramma licarsisli* Walker））；卷蛾科族的叶滚虫（leafrollers），蚜虫，种子虫（seed worms），以及果虫（fruit worms）（例如：苹果蠹蛾（*Cydia pomonella* Linnaeus），葡糖浆果蠹蛾（*Endopiza viteana* Clemens），东方果蠹蛾（*Grapholita molesta* Busck））；以及许多其它经济上重要的鳞翅目（例如菱纹背蛾（*Plutella xylostella* Linnaeus），红铃虫（*Pectinophora gossypiella* Saunders），舞毒蛾（*Lymantria dispar* Linnaeus））；Blattodea 目的稚虫和成虫，包括 Blattellidae 和蜚蠊科族的蟑螂（例如东方蟑螂（*Blatta orientalis* Linnaeus），亚洲蟑螂（*Blattella asahinai* Mizukubo），德国蟑螂（*Blattella germanica* Linnaeus），褐带蟑螂（*Supella longipalpa* Fabricius），美洲蟑螂（*Periplaneta americana* Linnaeus），褐色蟑螂（*Periplaneta brunnea* Burmeister），马得拉岛蟑螂（*Leucophaea maderae* Fabricius））；鞘翅目的摄叶幼虫和成虫，包括长角象虫科、豆象科和象虫科族的象鼻虫（例如棉籽象鼻虫（*Anthonomus grandis* Boheman），米水象鼻虫（rice water weevil, *Lissorhoptrus*

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

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

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

本发明的化合物对下列各目的害虫具有特别高的活性: 鳞翅目 (例如 *Alabama argillacea* Hübner (棉叶波纹夜蛾), *Archips argyrospila* Walker (果黄卷蛾), *A. rosana* Linnaeus (European

leaf roller) 和其它 Archips 种类, Chilo suppressalis Walker (二化螟), Cnaphalocrosis medinalis Guenee (rice leaf roller), Crambus caliginosellus Clemens (玉米根网螟), Crambus teterrellus Zincken (早熟禾草螟), Cydia pomonella Fabricius (苹蠹蛾), Earias insulana Boisduval (棉斑实蛾), Earias vittella Fabricius (spotted bollworm), Helicoverpa virescens Hübner (American bollworm), Helicoverpa zea Boddie (玉米穗蛾), Heliothis virescens Fabricius (烟芽夜蛾), Herpetogramma licarsisalis Walker (sod webworm), Lobesia botrana Denis & Schiffermüller (葡糖小卷蛾), Pectinophora gossypiella Saunders (pink bollworm), Phyllocnistis citrella Stainton (橘红潜叶甲), Pieris brassicae Linnaeus (大菜粉蝶), Pieris papae Linnaeus (小菜粉蝶), Plutella xylostella Linnaeus (小菜蛾), Spodoptera exigua Hübner (甜菜夜蛾), Spodoptera litura Fabricius (斜纹夜蛾, cluster caterpillar), Spodoptera frugiperda J.E. Smith (草地粘虫), Trichoplusia ni Hübner (粉纹夜蛾) 和 Tuta absoluta Meyrick (tomato leafminer)。本发明的化合物对同翅目的成员也有商业上明显的活性, 包括: Acyrthosiphon pisum Harris (豌豆蚜), Aphis craccivora Koch (豇豆蚜), Aphis fabae Scopoli (黑豆蚜), Aphis gossypii Glover (棉蚜, 瓜蚜), Aphis pomi De Geer (苹蚜), Aphis spiraeicola Patch (绣线菊蚜), Aulacorthum solani Kaltenbach (指顶花无网蚜), Chaetosiphon fragaefolii Cockerell (草莓中瘤钉毛蚜), Diuraphis noxia Kurdjumov/Mordvilko (俄罗斯麦长管蚜), Dysaphis plantaginea Paaserini (车前圆尾蚜), Eriosoma lanigerum Hausmann (苹绵蚜), Hyalopterus pruni Geoffroy (桃大尾蚜), Lipaphis erysimi Kaltenbach (芜菁蚜), Metopolophium dirrhodum Walker (谷蚜), Macrosiphum euphorbiae Thomas (马铃薯长管蚜), Myzus persicae Sulzer (peach-potato aphid, 桃蚜), Nasonovia ribisnigri Mosley (莴苣蓇长管蚜), Pemphigus spp. (根蚜和葡糖根疣蚜), Phopalosiphum maidis Fitch (玉米蚜), Rhopalosiphum padi Linnaeus (bird cherry-oat aphid),

Schizaphis graminum Rondani (麦二叉蚜), *Sitobion avenae* Fabricius (麦长管蚜), *Therioaphis maculata* Buckton (苜蓿斑蚜), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (桔声蚜), 和 *Toxoptera citricida* Kirkaldy (热带桔二岔蚜); *Adelges* spp. (球蚜); *Phylloxera devastatrix* Pergande (美核桃根瘤蚜); *Bemisia tabaci* Gennadius (烟草粉虱, 甘薯粉虱); *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (silverleaf whitefly), *Dialeurodes citri* Ashmead (柑桔粉虱) 和 *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (温室粉虱); *Empoasca fabae* Harris (蚕豆微叶蝉), *Laodelphax striatellus* Fallen (小褐稻虱), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (六点叶蝉), *Nephotettix cincticeps* Uhler (茶微叶蝉), *Nephotettix nigropictus* Stål (黑尾叶蝉), *Nilaparvata lugens* Stål (稻褐飞虱), *Peregrinus maidis* Ashmead (玉米蜡蝉), *Sogatella furcifera* Horvath (白背稻虱), *Sogatodes orizicola* Muir (rice delphacid), *Typhlocyba pomaria* McAtee (苹白小叶蝉), *Erythroneoura* spp. (葡糖斑叶蝉); *Magicidada septendecim* Linnaeus (期蝉); *Icerya purchasi* Maskell (吹绵蚧), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (梨圆盾蚧); *Planococcus citri* Risso (柑桔粉蚧); *Pesudococcus* spp. (其它粉蚧复合体); *Cacopsylla pyricola* Foerster (梨黄木虱), *Trioza diospyri* Ashmead (柿木虱)。这些化合物还对半翅目的成员具有活性, 包括: *Acrosternum hilare* Say (稻绿蝽), *Anasa tristis* De Geer (南瓜绿蝽), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (麦长蝽), *Corythuca gossypii* Fabricius (棉网蝽 (cotton lace bug)), *Cyrtopeltis modesta* Distant (tomato bug), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (棉黑翅红蝽), *Euchistus servus* Say (褐臭蝽), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (一点褐蝽), *Graptosthetus* spp. (蚜虫复合体), *Leptoglossus corculus* Say (松籽喙缘蝽), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (牧草盲蝽), *Nezara viridula* Linnaeus (稻绿蝽), *Oebalus pugnax* Fabricius (稻褐蝽), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (大马利筋长蝽), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (棉

跳盲蝽)。其它被本发明化合物防治的害虫目包括: 缨翅目(例如 *Frankliniella occidentalis* Pergande(苜蓿蓟马), *Scirtothrips citri* Moulton(桔实蓟马), *Sericothrips variabilis* Beach(大豆蓟马), 和 *Thrips tabaci* Lindeman(葱蓟马)), 和鞘翅目(例如 *Leptinotarsa decemlineata* Say(马铃薯甲虫), *Epilachna varivestis* Mulsant(墨西哥豆瓢虫), 以及 *Agriotes*、*Athous* 和 *Limonius* 种的铁线虫)。

本发明的化合物还可与一种或多种其它生物活性化合物或活性剂混合, 以形成多成分的杀虫剂, 产生更广的农用范围, 所述其它生物活性化合物或活性剂包括: 杀虫剂, 杀真菌剂, 杀线虫剂, 杀菌剂, 杀螨剂, 生长调节剂(如扎根刺激剂(*rooting stimulants*)), 化学灭菌剂, 化学信息物(*semiochemicals*), 驱虫剂, 诱引剂, 信息素, 摄食刺激剂(*feeding stimulants*), 其它生物活性化合物或昆虫病原细菌、病毒或真菌。因此, 本发明的组合物可进一步包含生物有效量的至少一种另外的生物活性化合物或活性剂。本发明的化合物可与如下各例生物活性化合物或活性剂进行配制: 杀虫剂, 如阿维菌素(*abamectin*)、高灭磷、吡虫清、齐墩螨素(*avermectin*)、艾扎丁、谷硫磷、氟氯菊酯、联苯肼酯、噻嗪酮、虫螨威、氟唑虫清、定虫隆、毒死蜱、甲基毒死蜱、*chromafenozide*、*clothianidin*、氯氟氰菊酯、 β -氯氟氰菊酯、(RS)氯氟氰菊酯、 λ -氯氟氰菊酯、氯氰菊酯、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、高氟戊菊酯、*ethiprole*、苯硫威、双氧威、甲氰菊酯、唑螨酯、杀灭菊酯、锐劲特、*flonicamid*、氟氰戊菊酯、氟胺氰菊酯、氟虫脲、地虫磷、特丁苯酰肼、氟铃脲、吡虫啉、噁二唑虫、丙胺磷、氟丙氧脲、马拉松、蜗牛敌、甲胺磷、杀扑磷、灭多虫、蒙五一五、甲氧滴滴涕、久效磷、甲氧苯酰肼、硝虫噻嗪、双苯氟脲、甲氧叉威、一六零五、甲基一六零五、氯菊酯、三九一一、伏杀磷、亚胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、拒嗪酮、*pyridalyl*、蚊蝇醚、鱼藤酮、艾克敌 105、乙丙硫磷、双苯酰肼、伏虫隆、七氟菊酯、特丁磷、杀虫畏、噻虫啉(*thiacloprid*)、*thiamethoxam*、硫双灭多威、杀虫双、四溴菊酯、敌百虫和杀虫隆; 杀真菌剂, 例如噻二唑素、腈嘧菊酯、苯菌灵、灭瘟素、波尔多液

(碱式硫酸铜)、糠菌唑、氯环丙酰胺、captafol、克菌丹、多菌灵、地茂散、百菌清、王铜、铜盐、cyflufenamid、清菌脲、环唑醇、环丙嘧啶、(S)-3,5-二氯-N-(3-氯-1-乙基-1-甲基-2-氧代丙基)-4-甲基苯甲酰胺(RH 7281)、diclocymet(S-2900)、啉菌清、氯硝胺、噁茂唑、(S)-3,5-二氢-5-甲基-2-甲基硫基-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、克瘟散、氧唑菌、噁唑铜菌、fenamidone、异噻菌醇、腈苯唑、fencaramide(SZX0722)、拌种咯、苯锈啉、丁苯吗啉、薯瘟锡、毒菌锡、氟啶胺、氟联苯菌(RPA 403397)、喹唑菌酮、氟硅唑、氟酰胺、粉唑醇、灭菌丹、藻菌磷、呋氯丙灵、呋吡唑灵(S-82658)、己唑醇、环戊唑醇、异丙定、富士一号、春雷霉素、亚胺菌、代森锰锌、代森锰、mefenoxam、丙氧灭锈胺、甲霜灵、环戊唑菌、叉氯苯酰胺(SSF-126)、腈菌唑、甲肿铁铵(甲基肿酸铁)、噁霜灵、戊菌唑、戊菌隆、丙氯灵、百维灵、环丙唑、啉斑肱、pyraclostrobin、二甲噻菌胺、咯嗪酮、喹氧灵、螺噁茂胺、硫磺粉、戊唑醇、氟醚唑、涕必灵、溴氟唑菌、甲基托布津、福美双、tiadinil、三唑酮、唑菌醇、三环唑、trifloxystrobin、戊叉唑菌、有效霉素和烯菌酮；杀线虫剂，如涕灭威、甲氧叉威和克线磷；杀菌剂，例如链霉素；杀螨剂，例如虫螨脒、灭螨猛、乙酯杀螨醇、三环锡、开乐散、除螨灵、特苯噁唑、喹螨醚、杀螨锡、甲氟菊酯、唑螨酯、噻螨酮、克螨特、啉螨酮和吡螨胺；以及生物试剂，如苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)，包括泽亚种(aizawai)和库尔斯塔克亚种(kurstaki)，苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素，杆状病毒，以及食虫细菌、病毒和真菌。本发明化合物及其混合物可施用于进行了基因转化以表达出对无脊椎害虫有毒性的蛋白(例如苏云金芽孢杆菌毒素)的植物上。外部施加的本发明的防治无脊椎害虫的化合物可以与这些表达的内毒素蛋白协同作用。

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

用于与本发明的化合物混合的优选杀虫剂和杀螨剂包括：合成

除虫菊酯类，例如氯氰菊酯、(RS)氯氟氰菊酯、氟氯氰菊酯、 β -氟氯氰菊酯、高氰戊菊酯、杀灭菊酯和四溴菊酯；氨基甲酸酯类，例如 fenothicarb、灭多虫、甲氧叉威、和硫双灭多威；neonicotinoids，例如 clothianidin、吡虫啉和噻虫啉；神经元钠通道阻断剂例如噁二唑虫；杀虫大环内酯类、如艾克敌 105、阿维菌素、齐墩螨素、和 emamectin； γ -氨基丁酸 (GABA) 拮抗剂 (antagonists)，例如硫丹、ethiprole 和锐劲特；杀虫剂尿素类，如氟虫脲和杀虫隆；保幼激素 juvenile hormone mimics，如噁茂醚和蚊蝇醚；拒嗉酮；以及虫螨脲。用于与本发明的化合物混合的优选生物活性剂包括苏云金芽孢杆菌和苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素，以及天然存在的和遗传改良的病毒杀虫剂，包括杆状病毒目 (Baculoviridae) 的成员以及食昆虫的真菌。

最优选的混合物包括：本发明的化合物与 (RS) 氯氟氰菊酯的混合物；本发明的化合物与 β -氟氯氰菊酯的混合物；本发明的化合物与高氰戊菊酯的混合物；本发明的化合物与灭多虫的混合物；本发明的化合物与吡虫啉的混合物；本发明的化合物与噻虫啉的混合物；本发明的化合物与噁二唑虫的混合物；本发明的化合物与阿维菌素的混合物；本发明的化合物与硫丹的混合物；本发明的化合物与 ethiprole 的混合物；本发明的化合物与锐劲特的混合物；本发明的化合物与氟虫脲的混合物；本发明的化合物与蚊蝇醚的混合物；本发明的化合物与拒嗉酮的混合物；本发明的化合物与虫螨脲的混合物；本发明的化合物与苏云金芽孢杆菌的混合物；以及本发明的化合物与苏云金芽孢杆菌 δ -内毒素的混合物。

在某些情况下，与具有相似防治范围但不同作用方式的其它无脊椎害虫防治化合物或活性剂的结合对于抗性控制 (resistance management) 是特别有利的。因此，本发明的组合物可进一步包含生物有效量的至少一种另外的具有相似防治范围但不同作用方式的无脊椎害虫防治化合物或活性剂。使遗传改良以表达植物防护化合物 (例如蛋白质) 的植物或该植物的处所与生物有效量的本发明化合物相接触，也可提供更广的植物防护范围，并对于抗性控制是特别有利的。

通过向害虫的环境 (包括害虫出现的农业和/或非农业处所)、

向需防护的区域、或直接向需要防治的害虫以生物有效量施用一种或多种本发明的化合物，可在农业和非农业应用中防治无脊椎害虫。因此，本发明还包括在农业和非农业应用中防治无脊椎害虫的方法，包括使无脊椎害虫或其环境与生物有效量的一种或多种本发明的化合物接触，或与含至少一种所述化合物的组合物或含至少一种所述化合物和至少一种另外的生物活性化合物或活性剂的组合物接触。包含本发明化合物和有效量的至少一种另外的生物活性化合物或活性剂的适当组合物的实例包括颗粒状组合物，其中所述另外的生物活性化合物或活性剂与本发明化合物存在于相同颗粒上或者与本发明化合物存在于不同颗粒上。

优选的接触方法是通过喷洒来接触。或者，可向植物叶或土壤施用含本发明化合物的颗粒状组合物。通过由植物与含本发明化合物的组合物接触而引起的植物吸收，本发明的化合物得以有效释放，所述组合物是作为液体制剂的土壤浸润、用于土壤的颗粒制剂、保育箱处理或移植浸渍而施用的。本发明化合物还可以通过将含有本发明化合物的组合物局部施用于害虫所在部位来实现其有效作用。其它接触方法包括通过直接或滞留性喷雾、航空喷洒、凝胶、种子涂层、微胶囊、系统吸收、饵诱、耳标 (ear tags)、大丸药、喷雾器、熏蒸剂、气溶胶、粉尘和许多其它方法而施用本发明的化合物或组合物。还可以将本发明化合物浸渗到用于制备无脊椎害虫防治装置例如(例如虫网)的材料内。

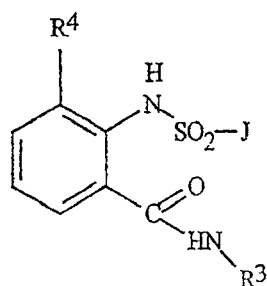
可将本发明的组合物掺入无脊椎害虫食用的诱饵，或掺入装置如捕集器等中。含有 0.01 - 5% 的活性成分、0.05 - 10% 的(一种或多种)保湿剂以及 40 - 99% 的植物粉的颗粒或诱饵能以很低的施用率有效地防治土壤害虫，特别是对于通过摄食而非直接接触而致命的活性成分剂量而言。

本发明的化合物可以以其纯态施用，但更为经常施用的是一种制剂，其含有一种或多种化合物与合适的载体、稀释剂和表面活性剂，且根据所考虑的终用途可能与食物结合。优选的施用方法涉及喷雾所述化合物的水分散体或精制油溶液。与喷淋油、喷淋油浓缩物、粘展剂、辅料、其它溶剂以及增效剂如增效醚结合通常增强化合物的效力。

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

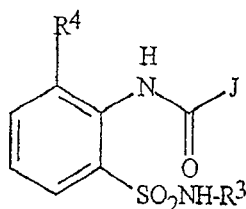
下列试验证实了本发明化合物对于特定害虫的防治效力。“防治效力”表示引起显著降低摄食的无脊椎害虫的发育抑制（包括死亡）。然而，所述化合物提供的害虫防治保护作用并不局限于这些种类。对于化合物的描述，参见索引表 A 和 B。在所述索引表中使用了以下缩写：“Me”是指甲基，“i”是指异，“Pr”是指丙基，i-Pr 是指异丙基。缩写“Ex.”代表“实施例”，其后的数字表明所述化合物是在哪个实施例中制备的。

索引表 A



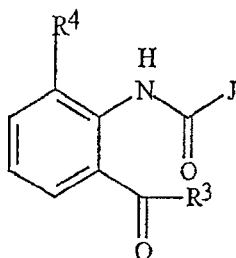
化合物	R ⁴	R ³	J	m.p. °C
1	Me	i-Pr	4-Cl-苯基	208-210
2 (Ex. 2)	Me	i-Pr	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-CF ₃ -5-吡唑基	69-72

索引表 B



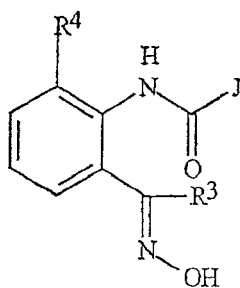
化合物	R ⁴	R ³	J	m.p. °C
B1	Me	i-Pr	4-CF ₃ -苯基	139-142
B2 (Ex. 1)	Me	i-Pr	4-OCF ₃ -苯基	104-107
B3	Me	i-Pr	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-CF ₃ -5-吡唑基	69-73

索引表 C



化合物	R ⁴	R ³	J	m.p. °C
C1	Me	<i>i</i> -Bu	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-CF ₃ -5-吡唑基	138-140
C2 (Ex. 3)	Me	<i>i</i> -Bu	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-Br-5-吡唑基	119-120
C3	Me	Et	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-Br-5-吡唑基	185-186
C4	Me	Me	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-Br-5-吡唑基	133-135
C5	Me	Me	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-CF ₃ -5-吡唑基	113-114
C6	Me	<i>i</i> -Pr	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-Br-5-吡唑基	102-104
C7	Me	<i>i</i> -Pr	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-CF ₃ -5-吡唑基	124-125

索引表 D



化合物	R ⁴	R ³	J	m.p. °C
D1	Me	Et	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-Br-5-吡唑基	152-154
D2	Me	Me	1-(3-Cl-2-吡啶基)-3-Br-5-吡唑基	181-182

本发明的生物实施例

试验 A

为了评估对菱纹背蛾 (*Plutella xylostella*) 的防治, 试验装

置由小开口容器组成，其中装有 12-14 天大小的萝卜植物。已用 10-15 条新生幼虫对该萝卜预先进行了害虫感染，幼虫是在一片害虫饵料上，用取样器从有许多幼虫在其上生长的硬化了的害虫饵料片上移取一小块试样，然后将该含幼虫和饵料的试样转移到试验装置中。作为饵料试样而移到试验设备上的幼虫将变干。

除非另作说明，用含下列物质的溶液配制试验化合物：10% 的丙酮，90% 的水和 300ppm 的 X-77® Spreader Lo-Foam Formula 非离子型表面活性剂，该表面活性剂含有烷基芳基聚氧乙烯、游离脂肪酸、二醇和异丙醇 (Loveland Industries, Inc.)。通过 SUJ2 雾化喷嘴施用 1ml 的所述配制化合物液体，该雾化喷嘴位于各试验装置上方 1.27cm (0.5 英寸) 处，带有 1/8 JJ 定制的箱体 (Spraying System Co.)。在这一筛选中的所有实验化合物均以 250ppm (或更低) 喷洒，并重复喷洒 3 次。在喷洒所述配制的试验化合物后，使各试验装置干燥 1 小时，然后在顶部加盖黑色遮蔽盖。在 25℃、70% 相对湿度的成长室中将试验装置放置 6 天。然后目测植物摄食损坏度。

在所试验的化合物中，下列提供了极佳的植物防护程度 (10% 或更低的摄食损坏)：1*、B3*、C2**、C5* 和 C6*。

试验 B

为了评估对秋粟蚕蛾幼虫 (*Spodoptera frugiperda*) 的防治，试验装置由小开口容器组成，其中装有 4-5 天大小的玉米植物。已用 10-15 条 1 天龄的幼虫对该玉米预先进行了害虫感染，幼虫是在一片害虫饵料上，使用了如试验 A 所述的取样器。

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

在所试验的化合物中，下列提供了极佳的植物防护程度 (20% 或更低的摄食损坏)：C2* 和 C5*。

试验 C

为了评估对烟草夜蛾幼虫 (*Heliothis virescens*) 的防治，试验装置由小开口容器组成，其中装有 6-7 天大小的棉花植物。已用 8 条 2 天龄的幼虫对该棉花植物预先进行了害虫感染，幼虫是在一片

害虫饵料上，使用了如试验 A 所述的取样器。

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

在所试验的化合物中，下列提供了极佳的植物防护程度（20 % 或更低的摄食损坏）：C2*和 C6*。

*以 50 ppm 试验的

**以 10 ppm 试验的。