

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

C07D261/10

A01N 43/80



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 200510066670.4

[43] 公开日 2005 年 9 月 28 日

[11] 公开号 CN 1673221A

[22] 申请日 2002.2.7

[21] 申请号 200510066670.4

分案原申请号 02804675.7

[30] 优先权

[32] 2001.2.8 [33] JP [31] 2001-031784

[71] 申请人 组合化学工业株式会社

地址 日本东京都

共同申请人 庵原化学工业株式会社

[72] 发明人 中谷昌央 久语良太郎 宫崎雅弘

角康一郎 藤波周 上野良平

高桥智

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商
标事务所

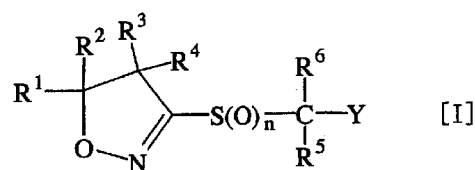
代理人 赵艳华

权利要求书 1 页 说明书 236 页

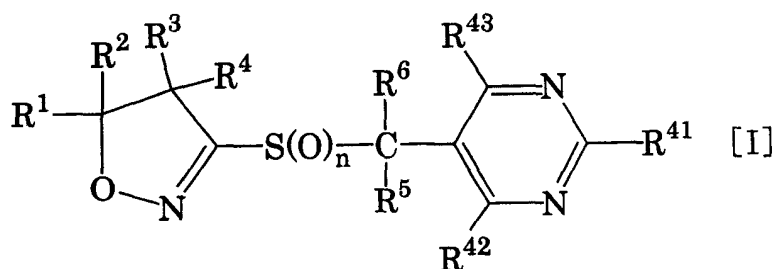
[54] 发明名称 异噁唑啉衍生物和含有它们作为活性组分的除草剂

[57] 摘要

通式 [I] 所代表的异噁唑啉衍生物：其中 R¹ 和 R² 可相同或不同，并分别是烷基；R³、R⁴、R⁵ 和 R⁶ 分别是氢原子；Y 代表任选被取代的含有选自氮原子、氧原子和硫原子的 5-6 元芳族杂环基或稠合芳族杂环基；且 n 是 0-2 的整数。所述异噁唑啉衍生物具有优良的除草作用和在农作物与杂草之间的优良选择性。



1. 下述通式[I]所代表的异噁唑啉衍生物或其可药用盐



其中 R^1 和 R^2 可相同或不同, 并为 C1-C10 烷基; R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 分别是氢原子; R^{41} 是氢原子、C1-C10 烷基、C1-C10 烷氧基、C1-C10 烷硫基、C1-C10 烷基磺酰基、氨基;

R^{42} 是氢原子、卤素原子、C1-C10 烷氧基、C1-C4 卤代烷氧基、氰基、C1-C10 烷硫基、C1-C10 烷基磺酰基、氨基, 其中其氮原子未被取代或被 C1-C10 烷基取代;

R^{43} 是氢原子、C1-C4 卤代烷基、C1-C10 烷氧基、C1-C10 烷基、C1-C4 卤代烷氧基;

n 是 0-2 的整数。

2. 除草剂, 其中含有权利要求 1 的异噁唑啉衍生物或其可药用盐作为活性组分。

异噁唑啉衍生物和含有它们作为活性组分的除草剂

本申请是2002年2月7日申请的中国发明专利“异噁唑啉衍生物和含有它们作为活性组分的除草”(申请号02804675.7)的分案申请。

发明背景

1. 发明领域

本发明涉及新的异噁唑啉衍生物,和含有所述异噁唑啉衍生物作为活性组分的除草剂。

2. 现有技术的描述

异噁唑啉衍生物的除草活性报道在例如 JP-A-8-22558、JP-A-9-328477 和 JP-A-9-328483 中。然而,在下文中详细描述的本发明化合物没有在这些文献中描述过。

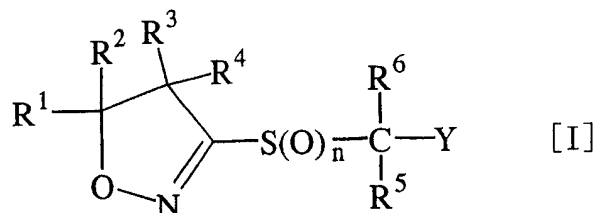
人们希望施加到有用农作物上的除草剂(a)可应用于土壤或叶子,(b)在低的组分量表现出足够的除草作用,和(c)在农作物与杂草之间表现出高度选择性。在上述文献中描述的化合物在这些方面不完全令人满意。

发明概述

鉴于上述状况,本发明者们研究了各种化合物的除草作用以及在农作物与杂草之间的选择性。结果本发明者们发现,新的异噁唑啉衍生物具有优良的除草作用以及在农作物与杂草之间的优良选择性。上述发现使本发明得以完成。

本发明提供了下列内容:

(1) 下述通式[I]所代表的异噁唑啉衍生物或其可药用盐



其中 R¹ 和 R² 可相同或不同,并分别是氢原子、C₁-C₁₀ 烷基、

C3 - C8 环烷基或 C3 - C8 环烷基 C1 - C3 烷基, 或者 R1 和 R2 可彼此键合以与它们键合的碳原子一起形成 C3 - C7 螺环;

R3 和 R4 可相同或不同, 并分别是氢原子、C1 - C10 烷基或 C3 - C8 环烷基; 或者 R3 和 R4 可彼此键合以与它们键合的碳原子一起形成 C3 - C7 螺环; 或者 R1、R2、R3 和 R4 可与它们键合的碳原子一起形成 5 - 8 元环;

R5 和 R6 可相同或不同, 并分别是氢原子或 C1 - C10 烷基;

Y 是具有一个或多个选自氮原子、氧原子和硫原子的杂原子的 5 - 6 元芳族杂环基或稠合的芳族杂环基; 所述杂环基可被 0 - 6 个相同或不同的选自下述取代基 α 的基团取代; 当杂环基在两个相邻位置被两个烷基、两个烷氧基、一个烷基与一个烷氧基、一个烷基与一个烷硫基、一个烷基与一个烷基磺酰基、一个烷基与一个一烷基氨基或者一个烷基与一个二烷基氨基取代, 其中所有这些基团都是选自取代基 α 时, 这两个基团可以与它们键合的原子一起形成 5 - 8 元环, 所述环可被 1 - 4 个卤素原子取代; 当所述杂环基的杂原子是氮原子时, 其可被氧化以形成 N-氧化物;

n 是 0 - 2 的整数。

[取代基 α]

羟基; 硫基; 卤素原子; C1 - C10 烷基; 分别被选自下述取代基 β 的基团单取代的 C1 - C10 烷基; C1 - C4 卤代烷基; C3 - C8 环烷基; C1 - C10 烷氧基; 分别被选自下述取代基 γ 的基团单取代的 C1 - C10 烷氧基; C1 - C4 卤代烷氧基; C3 - C8 环烷氧基; C3 - C8 环烷基 C1 - C3 烷氧基; C1 - C10 烷硫基; 分别被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1 - C10 烷硫基; C1 - C4 卤代烷硫基; C2 - C6 链烯基; C2 - C6 链烯氧基; C2 - C6 炔基; C2 - C6 炔氧基; C1 - C10 烷基亚磺酰基; 分别被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1 - C10 烷基亚磺酰基; C1 - C10 烷基磺酰基; 分别被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1 - C10 烷基磺酰基; C1 - C4 卤代烷基亚磺酰基; 分别被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1 - C10 烷基磺酰氧基; C1 - C4 卤代烷基磺酰基; C1 - C10 烷基磺

酰氧基; C1-C4 卤代烷基磺酰氧基; 任选被取代的苯基; 任选被取代的苯氧基; 任选被取代的苯硫基; 任选被取代的芳族杂环基; 任选被取代的芳族杂环氧基; 任选被取代的芳族杂环硫基; 任选被取代的苯基亚磺酰基; 任选被取代的苯基磺酰基; 任选被取代的芳族杂环基磺酰基; 任选被取代的苯基磺酰氧基; 酰基; C1-C4 卤代烷基羰基; 任选被取代的苄基羰基; 任选被取代的苯甲酰基; 羧基; C1-C10 烷氧基羰基; 任选被取代的苄氧基羰基; 任选被取代的苯氧基羰基; 氰基; 氨基甲酰基(其氮原子可被选自 C1-C10 烷基和任选被取代的苯基的相同或不同基团取代); C1-C6 酰氧基; C1-C4 卤代烷基羰基氧基; 任选被取代的苄基羰基氧基; 任选被取代的苯甲酰氧基; 硝基; 和氨基(其氮原子可被选自下列的相同或不同的基团取代: C1-C10 烷基、任选被取代的苯基、C1-C6 酰基、C1-C4 卤代烷基羰基、任选被取代的苄基羰基、任选被取代的苯甲酰基、C1-C10 烷基磺酰基、C1-C4 卤代烷基磺酰基、任选被取代的苄基磺酰基和任选被取代的苯基磺酰基)。

[取代基β]

羟基; 可被卤素原子或烷基取代的 C3-C8 环烷基; C1-C10 烷氧基; C1-C10 烷硫基; C1-C10 烷基磺酰基; C1-C10 烷氧基羰基; C2-C6 卤代链烯基; 氨基(其氮原子可被选自下列的相同或不同基团取代: C1-C10 烷基、C1-C6 酰基; C1-C4 卤代烷基羰基、C1-C10 烷基磺酰基和 C1-C4 卤代烷基磺酰基); 氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的 C1-C10 烷基取代); C1-C6 酰基; C1-C4 卤代烷基羰基; C1-C10 烷氧基亚氨基; 氰基; 任选被取代的苯基; 和任选被取代的苯氧基。

[取代基γ]

C1-C10 烷氧基羰基; 任选被取代的苯基; 任选被取代的芳族杂环基; 氰基; 和氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的 C1-C10 烷基取代)。

(2) 根据(1)的异噁唑啉衍生物, 其中在可被 0-6 个相同或不同基

团取代的杂环上的取代基 α 包括羟基；卤素原子；C1-C10 烷基；分别被选自取代基 β 的基团单取代的 C1-C10 烷基；C1-C4 卤代烷基；C3-C8 环烷基；C1-C10 烷氧基；分别被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1-C10 烷氧基；C1-C4 卤代烷氧基；C3-C8 环烷氧基；C3-C8 环烷基 C1-C3 烷氧基；C1-C10 烷硫基；分别被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1-C10 烷硫基；C1-C4 卤代烷硫基；C2-C6 链烯基；C2-C6 链烯氧基；C2-C6 炔基；C2-C6 炔氧基；C1-C10 烷基磺酰基；C1-C4 卤代烷基磺酰基；任选被取代的苯基；任选被取代的苯氧基；任选被取代的苯硫基；任选被取代的芳族杂环基；任选被取代的芳族杂环氧基；任选被取代的芳族杂环硫基；任选被取代的苯基磺酰基；任选被取代的芳族杂环基 磺酰基；C1-C6 酰基；C1-C4 卤代烷基羧基；任选被取代的苄基羧基；任选被取代的苯甲酰基；羧基；C1-C10 烷氧基羧基；氰基；氨基甲酰基(其氮原子可被选自 C1-C10 烷基和任选被取代的苯基的相同或不同基团取代)；硝基；和氨基(其氮原子可被选自下列的相同或不同基团取代：C1-C10 烷基、任选被取代的苯基、C1-C6 酰基、C1-C4 卤代烷基羧基、任选被取代的苄基羧基、任选被取代的苯甲酰基、C1-C10 烷基磺酰基、C1-C4 卤代烷基磺酰基、任选被取代的苄基磺酰基和任选被取代的苯基磺酰基)；当杂环基在两个相邻位置被两个烷基、两个烷氧基、一个烷基与一个烷氧基、一个烷基与一个烷硫基、一个烷基与一个烷基磺酰基、一个烷基与一个一烷基氨基、或者一个烷基与一个二烷基氨基取代，其中所有这些基团都是选自取代基 α 时，这两个基团可以与它们键合的原子一起形成 5-8 元环，所述环可被 1-4 个卤素原子取代；

(3) 根据(2)的异噁唑啉衍生物，其中在可被 0-6 个相同或不同基团取代的杂环上的取代基 α 包括卤素原子；C1-C10 烷基；C1-C4 卤代烷基；C1-C10 烷氧基 C1-C3 烷基；可被卤素原子或烷基取代的 C3-C8 环烷基；C1-C10 烷氧基；C1-C4 卤代烷氧基；C3-C8 环烷基 C1-C3 烷氧基；任选被取代的苯氧基；C1-C10 烷硫基；C1-C10 烷基磺酰基；酰基；C1-C4 卤代烷基羧基；C1-C10 烷氧基羧

基；氰基和氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的 C1 - C10 烷基取代)。

(4) 依据(1)、(2)或(3)任一项的异噁唑啉衍生物，其中 R1 和 R2 可相同或不同，并分别是甲基或乙基；且 R3、R4、R5 和 R6 分别是氮原子。

(5) 依据(1)、(2)、(3)或(4)任一项的异噁唑啉衍生物，其中 Y 是具有选自氮原子、氧原子和硫原子的杂原子的 5 或 6 元芳族杂环基。

(6) 依据(5)的异噁唑啉衍生物，其中 Y 是噻吩基、吡唑基、异噁唑基、异噻唑基、吡啶基或嘧啶基。

(7) 依据(6)的异噁唑啉衍生物，其中 Y 是噻吩-3-基、吡唑-4-基、吡唑-5-基、异噁唑-4-基、异噻唑-4-基、吡啶-3-基或嘧啶-5-基。

(8) 依据(7)的异噁唑啉衍生物，其中 Y 是噻吩-3-基，并且该噻吩环在 2-和 4-位上被取代基 α 取代。

(9) 依据(7)的异噁唑啉衍生物，其中 Y 是吡唑-4-基，并且该吡唑环在 3-和 5-位上被取代基 α 取代，在 1-位上被下列基团取代：氮原子、C1 - C10 烷基、被选自取代基 β 的基团单取代的 C1 - C10 烷基、C1 - C4 卤代烷基、C3 - C8 环烷基、C2 - C6 链烯基、C2 - C6 炔基、C1 - C10 烷基亚磺酰基、C1 - C10 烷基磺酰基、被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1 - C10 烷基磺酰基、C1 - C4 卤代烷基磺酰基、任选被取代的苯基、任选被取代的芳族杂环基、任选被取代的苯基磺酰基、任选被取代的芳族杂环基磺酰基、酰基、C1 - C4 卤代烷基羰基、任选被取代的苄基羰基、任选被取代的苯甲酰基、C1 - C10 烷氧基羰基、任选被取代的苄氧基羰基、任选被取代的苯氧基羰基、氨基甲酰基(其氮原子可被选自 C1 - C10 烷基和任选被取代的苯基的相同或不同基团取代)或氨基(其氮原子可被选自下列的相同或不同基团取代：C1 - C10 烷基、任选被取代的苯基、酰基、C1 - C4 卤代烷基羰基、任选被取代的苄基羰基、任选被取代的苯甲酰基、C1 - C10 烷基磺酰基、C1 - C4 卤代烷基磺酰基、任选被取代的苄基磺酰基和任选被取代的苯基磺酰基)。

(10) 依据(7)的异噁唑啉衍生物, 其中 Y 是吡唑-5-基, 并且该吡唑环在 4-位上被取代基 α 取代, 在 1-位上被下列基团取代: 氢原子、C1 - C10 烷基、被选自取代基 β 的基团单取代的 C1 - C10 烷基、C1 - C4 卤代烷基、C3 - C8 环烷基、C2 - C6 链烯基、C2 - C6 炔基、C1 - C10 烷基亚磺酰基、C1 - C10 烷基磺酰基、被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1 - C10 烷基磺酰基、C1 - C4 卤代烷基磺酰基、任选被取代的苯基、任选被取代的芳族杂环基、任选被取代的苯基磺酰基、任选被取代的芳族杂环基磺酰基、酰基、C1 - C4 卤代烷基羰基、任选被取代的苄基羰基、任选被取代的苯甲酰基、C1 - C10 烷氧基羰基、任选被取代的苄氧基羰基、任选被取代的苯氧基羰基、氨基甲酰基(其氮原子可被选自 C1 - C10 烷基和任选被取代的苯基的相同或不同基团取代)或氨基(其氮原子可被选自下列的相同或不同基团取代: C1 - C10 烷基、任选被取代的苯基、酰基、C1 - C4 卤代烷基羰基、任选被取代的苄基羰基、任选被取代的苯甲酰基、C1 - C10 烷基磺酰基、C1 - C4 卤代烷基磺酰基、任选被取代的苄基磺酰基和任选被取代的苯基磺酰基)。

(11) 依据(7)的异噁唑啉衍生物, 其中 Y 是异噁唑-4-基, 并且该异噁唑环在 3-和 5-位上被取代基 α 取代。

(12) 依据(7)的异噁唑啉衍生物, 其中 Y 是异噻唑-4-基, 并且该异噻唑环在 3-和 5-位上被取代基 α 取代。

(13) 依据(7)的异噁唑啉衍生物, 其中 Y 是吡啶-3-基, 并且该吡啶环在 2-和 4-位上被取代基 α 取代。

(14) 依据(7)的异噁唑啉衍生物, 其中 Y 是嘧啶-5-基, 并且该嘧啶环在 4-和 6-位上被取代基 α 取代。

(15) 依据(1) - (14)任一项的异噁唑啉衍生物, 其中 n 是整数 2。

(16) 依据(1) - (14)任一项的异噁唑啉衍生物, 其中 n 是整数 1。

(17) 依据(1) - (14)任一项的异噁唑啉衍生物, 其中 n 是整数 0。

(18) 除草剂, 其中含有(1) - (17)任一项的异噁唑啉衍生物或其可药用盐作为活性组分。

发明详述

下面给出在本说明书中使用的术语的定义。

表达式“C1 - C10”等是指在该表达式后呈现的取代基具有 1 - 10 个碳原子(对于“C1 - C10”)。

卤素原子是指氟原子、氯原子、溴原子或碘原子。

除非另有说明,否则 C1 - C10 烷基是指具有 1 - 10 个碳原子的直链或支链烷基;可提及的有例如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、正戊基、异戊基、新戊基、正己基、异己基、3,3-二甲基丁基、庚基和辛基。

C3 - C8 环烷基是指具有 3 - 8 个碳原子的环烷基;可提及的有例如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

除非另有说明,否则 C3 - C8 环烷基 C1 - C3 烷基(可被卤素原子或烷基取代)是指被 C3 - C8 环烷基取代的 C1 - C3 烷基,其中 C3 - C8 环烷基可被 1 - 4 个相同或不同的卤素原子或 C1 - C3 烷基取代;可提及的有环丙基甲基、1-环丙基乙基、2-环丙基乙基、1-环丙基丙基、2-环丙基丙基、3-环丙基丙基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基、2-氯环丙基甲基、2,2-二氯环丙基甲基、2-氟环丙基甲基、2,2-二氟环丙基甲基、2-甲基环丙基甲基、2,2-二甲基环丙基甲基和 2-甲基环丙基乙基。

C3 - C8 环烷基 C1 - C3 烷基是指被具有 3 - 8 个碳原子的环烷基取代的具有 1 - 3 个碳原子的烷基;可提及的有例如环丙基甲基、1-环丙基乙基、2-环丙基乙基、1-环丙基丙基、2-环丙基丙基、3-环丙基丙基、环丁基甲基、环戊基甲基和环己基甲基。

除非另有说明,否则 C1 - C4 卤代烷基是指被 1 - 9 个相同或不同的卤素原子取代的具有 1 - 4 个碳原子的直链或支链烷基;可提及的有例如氟甲基、氯甲基、溴甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基和五氟乙基。

C2 - C6 链烯基是指具有 2 - 6 个碳原子的直链或支链链烯基;可

提及的有例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、异丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基和2-戊烯基。

C2 - C6 炔基是指具有2 - 6碳原子的直链或支链炔基；可提及的有例如乙炔基、2-丙炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-丁炔基、3-丁炔基和2-甲基-3-丁炔基。

除非另有说明，C2 - C6 卤代链烯基是指被1 - 4个相同或不同的卤素原子取代的具有2 - 6个碳原子的直链或支链链烯基；可提及的有例如3-氯-2-丙烯基和2-氯-2-丙烯基。

C1 - C10 烷氧基是指(烷基)-O-，其中烷基部分如上所定义；可提及的有例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、叔丁氧基、正丁氧基、仲丁氧基和异丁氧基。

C1 - C4 卤代烷氧基是指(卤代烷基)-O-，其中卤代烷基部分如上所定义；可提及的有例如二氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2-二氟乙氧基和2,2,2-三氟乙氧基。

C3 - C8 环烷氧基是指(环烷基)-O-，其中环烷基部分如上所定义；可提及的有例如环丙氧基、环丁氧基、环戊氧基和环己氧基。

C3 - C8 环烷基 C1 - C3 烷氧基是指(环烷基烷基)-O-，其中环烷基烷基部分如上所定义；可提及的有例如环丙基甲氧基、1-环丙基乙氧基、2-环丙基乙氧基、1-环丙基丙氧基、2-环丙基丙氧基、3-环丙基丙氧基、环丁基甲氧基、环戊基甲氧基和环己基甲氧基。

C2 - C6 链烯氧基和 C2 - C6 炔氧基分别是指(链烯基)-O-和(炔基)-O-，其中每个所述基团的链烯基或炔基部分如上所定义；可提及的有例如2-丙烯氧基和2-丙炔氧基。

C1 - C10 烷氧基亚氨基是指(烷氧基)-N=，其中烷氧基部分如上所定义；可提及的有例如甲氧基亚氨基和乙氧基亚氨基。

C1 - C10 烷硫基、C1 - C10 烷基亚磺酰基和 C1 - C10 烷基磺酰基分别是指(烷基)-S-、(烷基)-SO-和(烷基)-SO₂-，其中每个所述基团的烷基部分如上所定义；可提及的有例如甲硫基、乙硫基、正丙硫基、异丙硫基、甲基亚磺酰基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基

和异丙基磺酰基。

C1 - C10 烷基磺酰氧基是指(烷基磺酰基)-O-基, 其中烷基磺酰基部分具有上述定义, 可提及的有例如甲基磺酰氧基和乙基磺酰氧基。

C1 - C10 烷氧基羰基是指(烷氧基)-CO-基, 其中烷氧基部分具有上述定义, 可提及的有例如甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基和异丙氧基羰基。

C1 - C6 是指具有 1 - 6 个碳原子的直链或支链脂族酰基, 可提及的有例如甲酰基、乙酰基、丙酰基、异丙酰基、丁酰基和戊酰基。

C1 - C10 酰氧基是指(酰基)-O-基, 其中酰基部分如上所定义; 可提及的有例如乙酰氧基、丙酰氧基、异丙酰氧基和戊酰氧基。

C1 - C4 卤代烷基羰基、C1 - C4 卤代烷基磺基和 C1 - C4 卤代烷基磺酰基分别是指(卤代烷基)-CO-、(卤代烷基)-S-和(卤代烷基)-SO₂-, 其中每个所述基团的卤代烷基部分如上所定义; 可提及的有例如氯乙酰基、三氟乙酰基、五氟丙基、二氟甲磺基、三氟甲磺基、氯甲基磺酰基、二氟甲基磺酰基和三氟甲基磺酰基。

C1 - C4 卤代烷基羰基氧基和 C1 - C4 卤代烷基磺酰氧基分别是指(卤代烷基羰基)-O-和(卤代烷基磺酰基)-O-, 其中每个所述基团的卤代烷基羰基或卤代烷基磺酰基部分如上所定义; 可提及的有例如氯乙酰氧基、三氟乙酰氧基、氯甲基磺酰氧基和三氟甲基磺酰氧基。

(任选取代的)苯基、(任选取代的)芳族杂环基、(任选取代的)苯氧基、(任选被取代的芳族杂环氧基、(任选取代的)苯磺基、(任选取代的)芳族杂环磺基、(任选取代的)苯基磺酰基、(任选取代的)苯基磺酰氧基、(任选取代的)芳族杂环基磺酰基、(任选取代的)苄基羰基、(任选取代的)苄基羰基氧基、(任选取代的)苄基磺酰基、(任选取代的)苄甲酰基、(任选取代的)苄甲酰氧基、(任选取代的)苄氧基羰基和(任选取代的)苯氧基羰基中的“任选取代的”是指任选被例如下列基团取代: 卤素原子、C1 - C10 烷基、C1 - C4 卤代烷基、C1 - C10 烷氧基烷基、C1 - C10 烷氧基、C1 - C10 烷磺基、C1 - C10 烷基磺酰基、酰基、C1 - C10 烷氧基羰基、氟基、氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的 C1 - C10

烷基取代)、硝基或氨基(其氮原子可被选自下列的相同或不同基团取代: C1-C10 烷基、C1-C6 酰基、C1-C4 卤代烷基羰基、C1-C10 烷基磺酰基和 C1-C4 卤代烷基磺酰基)。

具有选自氮原子、氧原子和硫原子的杂原子的 5-6 元芳族杂环基包括例如呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、异噻唑基、异噻唑基、噻唑基、噻唑基、咪唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、三嗪基、三唑基、噁二唑基和噻二唑基, 每一所述芳族杂环基都具有 1-3 个杂原子。

稠合的芳族杂环基是指具有 1-3 个任意选自氮原子、氧原子和硫原子的基团; 可提及的有例如苯并呋喃基、苯并噻吩基、吲哚基、苯并噻唑基、苯并噻唑基、苯并咪唑基、苯并异噻唑基、苯并异噻唑基、吲唑基、喹啉基、异喹啉基、酞嗪基、喹喔啉基、喹唑啉基、噌啉基和苯并三唑基。

(任选取代的)芳族杂环基、(任选取代的)芳族杂环氧基、(任选取代的)芳族杂环硫基和(任选取代的)芳族杂环基磺酰基中的芳族杂环是指具有 1-3 个任意选自氮原子、氧原子和硫原子的杂原子的 5-6 元基团; 可提及的有例如呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、异噻唑基、异噻唑基、噻唑基、噻唑基、咪唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、三嗪基、三唑基、噁二唑基和噻二唑基。

可药用盐是在结构中具有羟基、羧基、氨基等的通式[I]化合物与无机碱或有机碱或者与无机酸或有机酸形成的盐。作为金属, 可提及的有碱金属例如钠、钾等; 和碱土金属例如镁、钙等。作为有机碱, 可提及的有三乙胺、二异丙基胺等。作为无机酸, 可提及的有盐酸、硫酸等。作为有机酸, 可提及的有乙酸、甲磺酸、对甲苯磺酸等。

在上述通式[I]中, 优选的是

R1 和 R2 可相同或不同, 并分别是甲基或乙基;

R3、R4、R5 和 R6 分别是氢原子;

n 是整数 2; 且

Y 是噻吩-3-基[该基团的 2-和 4-位被相同或不同的选自下列的基

团取代：卤素原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、环烷基、烷氧基、卤代烷氧基、酰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、氰基和氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的烷基取代)]，或

吡唑-4-基[该基团的 3-和 5-位被相同或不同的选自下列的基团取代：卤素原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、环烷基、烷氧基、卤代烷氧基、环烷基烷氧基、任选被取代的苯氧基、烷硫基、烷基磺酰基、酰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、氰基和氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的烷基取代)；其 1-位被下列基团取代：氢原子、烷基、被选自取代基 β 的基团单取代的烷基、卤代烷基、环烷基、链烯基、炔基、烷基磺酰基、被选自取代基 γ 的基团单取代的烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、任选被取代的苯基、任选被取代的芳族杂环基、任选被取代的苯基磺酰基、任选被取代的芳族杂环基磺酰基、酰基、卤代烷基羰基、任选被取代的苄基羰基、任选被取代的苯甲酰基、烷氧基羰基、任选被取代的苄氧基羰基、任选被取代的苯氧基羰基或氨基甲酰基(其氮原子可被选自烷基和任选被取代的苯基的相同或不同基团取代)]，或

吡唑-5-基[该基团的 4-位被下列基团取代：卤素原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、卤代烷氧基、酰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、氰基或氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的烷基取代)；其 1-位被下列基团取代：氢原子、烷基、被选自取代基 β 的基团单取代的烷基、卤代烷基、环烷基或任选被取代的苯基]，或

异噁唑-4-基[该基团的 3-和 5-位被相同或不同的选自下列的基团取代：卤素原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、环烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、烷基磺酰基、酰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、氰基和氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的烷基取代)]，或

异噻唑-4-基[该基团的 3-和 5-位被相同或不同的选自下列的基团取代：卤素原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、环烷基、烷氧基、卤代烷氧基、任选被取代的苯氧基、烷硫基、烷基磺酰基、酰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、氰基和氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不

同的烷基取代)], 或

吡啶-3-基[该基团的 2-和 4-位被相同或不同的选自下列的基团取代: 卤素原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、环烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、烷基磺酰基、酰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、氰基和氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的烷基取代)], 或

嘧啶-5-基[该基团的 4-和 6-位被相同或不同的选自下列的基团取代: 卤素原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、环烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、烷基磺酰基、酰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、氰基和氨基甲酰基(其氮原子可被相同或不同的烷基取代)].

本发明通式[I]化合物的代表性实例如表 1-10 所示。然而, 本发明化合物不限于这些实施例。

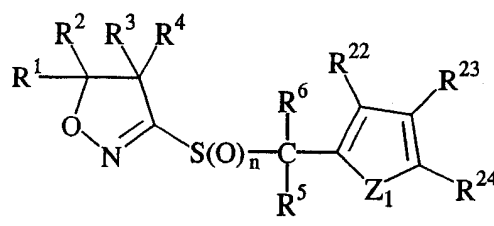
在表中使用的下列缩写是指下列基团。

Me: 甲基	Et: 乙基
Pr: 正-丙基	Pr-i: 异丙基
Pr-c: 环丙基	Bu: 正丁基
Bu-i: 异丁基	Bu-s: 仲丁基
Bu-t: 叔丁基	Bu-c: 环丁基
Pen: 正戊基	Pen-c: 环戊基
Hex: 正己基	Hex-c: 环己基
Ph: 苯基	

例如, (4-Cl)Ph 是指 4-氯苯基, 3-Hex 是指 3-己基。

当本发明化合物含有羟基作为取代基时, 可能存在酮-烯醇互变异构体。所以这些互变异构体以及这些互变异构体的任何混合物都包括在本发明化合物范围内。

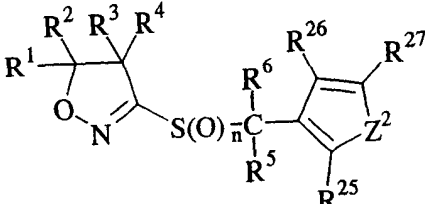
表 1

											
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	H	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Me	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	H	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Cl	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OMe	H	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OEt	H	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OCH ₂ Ph	H	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	C(=O)OMe	
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Me	H	Me	
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Me	C(=O)OMe	CH ₂ C(=O)OMe	
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Me	C(=O)OEt	CH ₂ C(=O)OEt	
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Me	Me	Me	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OMe	H	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OEt	H	H	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCHF ₂	H	H	
H	H	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	H	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	H	Me	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	Me	H	H	2	Me	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	Me	H	H	2	Et	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	Me	H	H	2	Me	Me	S	OCHF ₂	H	H	
Me	Et	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
Et	Et	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	Pr	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H	
-(CH ₂) ₂ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl	
-(CH ₂) ₃ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl	
-(CH ₂) ₄ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl	

	-(CH ₂) ₅ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	Me	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	H	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	Cl	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	OMe	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	OEt	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	S	OCH ₂ Ph	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	O	H	H	C(=O)Ome
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe	Me	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe	Me	C(=O)OMe	CH ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe	Me	C(=O)OEt	CH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NPh	OMe	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NPh	OEt	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NPh	OCHF ₂	H	H
H	H	H	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	H	H	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	H	Me	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	1	Me	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	1	Et	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	1	Me	Me	Me	S	OCHF ₂	H	H
Me	Et	H	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Et	Et	H	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Pr	H	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	H	S	OCHF ₂	H	H
	-(CH ₂) ₂ -		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
	-(CH ₂) ₃ -		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
	-(CH ₂) ₄ -		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
	-(CH ₂) ₅ -		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -		H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OMe	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OEt	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCH ₂ Ph	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	O	H	H	C(=O)Ome
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Me	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Me	C(=O)OMe	CH ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Me	C(=O)OEt	CH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OMe	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OEt	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OCHF ₂	H	H
H	H	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	H	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	H	Me	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	0	Me	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	0	Et	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	0	Me	Me	S	OCHF ₂	H	H
Me	Et	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Et	Et	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Pr	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl	Cl
Me	Et	H	H	2	H	H	S	H	H	H
Me	Et	H	H	2	H	H	O	H	H	H
Me	Et	H	H	2	H	H	NH	H	H	H

表 2

										
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ²	R ²⁵	R ²⁶	R ²⁷
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	OMe	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHMe	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	N(Me) ₂	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHC(=O)Me	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHC(=O)Ph	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHSO ₂ Me	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	NHSO ₂ Ph	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)OEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)OPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	CN	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)NHMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Pr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Ph	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Ph	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OMe	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OEt	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OPr-i	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OPr-i	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	CN	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Pr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	C(=NOMe)Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	H	H
H	H	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	Me	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	Et	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	Me	S	Cl	Cl	Cl
Me	Et	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Et	Et	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₂ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₃ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₄ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₅ -		H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -	H		2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H		2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -	H		2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H		2	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	OMe	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHMe	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	N(Me) ₂	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHC(=O)Me	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHC(=O)Ph	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHSO ₂ Me	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	NHSO ₂ Ph	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	Me	Me

Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)OEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)OPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	CN	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)NHMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)Et	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)Pr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)Pr	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=O)CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Ph	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Ph	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OMe	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OEt	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OPr-i	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OPr-i	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	CN	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)Pr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	C(=NOMe)Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	H	Cl
H	H	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	Me	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	Et	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	Me	S	Cl	Cl	Cl
Me	Et	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Et	Et	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl

Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
	-(CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H	1	H	H	S	Cl	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	OMe	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	NHMe	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	N(Me) ₂	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	NHC(=O)Me	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	NHC(=O)Ph	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	NHSO ₂ Me	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	NHSO ₂ Ph	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)OEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)OPh	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	CN	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)NHMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)Et	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)Pr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)Pr	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=O)CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Ph	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Ph	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OMe	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OEt	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OPr-i	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OPr-i	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	CN	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)Pr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	C(=NOMe)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	H	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	H	Cl
H	H	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	H	Me	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	Et	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	Me	S	Cl	Cl	Cl
Me	Et	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Et	Et	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	H	S	Cl	Cl	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	H	S	Cl	Cl	Cl

表 3

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ²⁹	R ²⁸	R ³⁰
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	H	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	H	F
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	H	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	H	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	H	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	H	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	H	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	Pr-i

Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CH ₂ OMe	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CH ₂ OMe	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CH ₂ OMe	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CH ₂ OMe	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CH ₂ OMe	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Br

Me	Me	H	H	2	H	H	Br	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	I
Me	Me	H	H	2	H	H	I	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OH
Me	Me	H	H	2	H	H	OH	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OBu-s
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OBu-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OBu
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Pen)
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-Pen)
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPen-n
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Hex)
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-Hex)
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OHex-n
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPen-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OHex-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Bu-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pen-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Hex-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CH=CH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C≡CH
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCH ₂ CH F ₂	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OCH ₂ CF ₃	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH(Me)C(=O)OEt

Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Cl)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Br)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-F)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-CN)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-Cl)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-Br)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-F)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-CN)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-Cl)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-Br)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-F)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-CN)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOMe

Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Pr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SCF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SCH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH ₂ C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH ₂ C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NH ₂

Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	NHPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	C(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Pr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₂ CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	COOMe	Me	F

Me	Me	H	H	2	H	H	F	Me	COOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	COOMe	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	COOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Et	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Et	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Et	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Et	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Et	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Et	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Et	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Et	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Pr-i	OCHF ₂

Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-i	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-i	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Pr	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	OCHF ₂

Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	F
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Bu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	H
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	F
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-s	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-s	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-甲基丁基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-甲基丁基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-乙基丙基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-乙基丙基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-戊基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-戊基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-甲基戊基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-甲基戊基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	2-乙基丁基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	2-乙基丁基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	3,3-二甲基丁基	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	3,3-二甲基丁基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-己基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-己基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-庚基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-庚基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-辛基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-辛基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-c	F
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-c	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OH
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Bu-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPen-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	CF ₃

Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-环丙基乙基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-环丙基乙基	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-甲基环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ (2-甲基环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二甲基环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二甲基环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-氯环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ (2-氯环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二氯环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二氯环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ (2-氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ (2-氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ CH=CHCl	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C≡CH	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CCH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C≡CH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	OMe

Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHMeC=CH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHMeC=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ C=CMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF ₂	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF ₂	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF ₂	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Et	CHF ₂	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CHF ₂	CF ₃

Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ OH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	F
Me	Me	H	H	2	H	H	F	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ OEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ NHMe	Cl

Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ NHMe	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ N(Me) ₂	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ N(Me) ₂	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ SMe	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ SMe	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ CH ₂ SMe	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ CN	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ CN	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ C(=O)OMe	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ C(=O)OEt	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ C(=O)OEt	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH(Me)C(=O)OMe	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH(Me)C(=O)OMe	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	C(Me) ₂ C(=O)OMe	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	C(Me) ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NH ₂	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ C(=O)NH ₂	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NHMe	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ C(=O)NHMe	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ C(=O)Me	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ C(=O)Me	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ C(=NOMe)Me	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ C(=NOMe)Me	CF ₃

Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ C(=O)CF ₃	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ C(=O)CF ₃	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	Me	Ph	Me
Me Me	H H	2	H H	Me	Ph	F
Me Me	H H	2	H H	Me	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	Me	Ph	OCHF ₂
Me Me	H H	2	H H	Me	Ph	CN
Me Me	H H	2	H H	Et	Ph	F
Me Me	H H	2	H H	Et	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	Et	Ph	OCHF ₂
Me Me	H H	2	H H	Et	Ph	CN
Me Me	H H	2	H H	Pr	Ph	F
Me Me	H H	2	H H	Pr	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	Pr	Ph	OCHF ₂
Me Me	H H	2	H H	Pr	Ph	CN
Me Me	H H	2	H H	Pr-i	Ph	F
Me Me	H H	2	H H	Pr-i	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	Pr-i	Ph	OCHF ₂
Me Me	H H	2	H H	Pr-i	Ph	CN
Me Me	H H	2	H H	Bu-t	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	CH ₂ OMe	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	OCHF ₂	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	OCHF ₂	Ph	OCHF ₂
Me Me	H H	2	H H	CHF ₂	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	H
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	Me
Me Me	H H	2	H H	Me	Ph	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	Et
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	Pr-i
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	CHF ₂
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	F
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	Cl
Me Me	H H	2	H H	Cl	Ph	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	OH
Me Me	H H	2	H H	OH	Ph	CF ₃
Me Me	H H	2	H H	CF ₃	Ph	OMe
Me Me	H H	2	H H	OMe	Ph	CF ₃

Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CH=CH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C≡CH
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH(Me)C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OC(Me) ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SOEt
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SOPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SOPr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Pr
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SOBu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SCHF ₂

Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SOCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	NHPh
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	咪唑-1-基
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	吡唑-1-基
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	1,2,4-三唑-1-基
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	1,2,4-三唑-4-基
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	四唑-1-基
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	四唑-5-基
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧基
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)磺酰基
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₂ CF ₃	Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-NO ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-C(=O)NHMe)Ph	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-C(=O)NMe ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-NO ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NMe ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-NO ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NMe ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	嘧啶-2-基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	噻吩-2-基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	呋喃-2-基	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)Pr-i	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)CH ₂ Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)CHCl ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)OPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)OCH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)NHPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	NH ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ O- -(CH ₂) ₃ O- -(CH ₂) ₃ S- -(CH ₂) ₃ SO ₂ - -(CH ₂) ₂ O- -(CH ₂) ₃ O- -(CH ₂) ₃ S- -(CH ₂) ₃ SO ₂ - -(CH ₂) ₄ - -(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl		
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl		
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl		
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe		
Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂		
H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	H	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	H	Me	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	Me	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	Et	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	Me	CF ₃	Me	Cl
Me	Et	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Et	Et	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
-(CH ₂) ₂ -	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl	
-(CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl	
-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl	
-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl	

H	-(CH ₂) ₃ -	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	H	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	H	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	H	OCHF ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CHF ₂	H	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	H	F
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	H	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	H	OMe
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	H	OEt
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	H	OCHF ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	H	CN
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	H	Me
Me Me	H	H	1	H	H	H	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	Me	Me	Me
Me Me	H	H	1	H	H	Me	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Me
Me Me	H	H	1	H	H	Et	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Et
Me Me	H	H	1	H	H	Pr-i	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Pr-i
Me Me	H	H	1	H	H	Bu-t	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Bu-t
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	CHF ₂	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	CHF ₂
Me Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Me	H
Me Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	OCHF ₂
Me Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Me	OCHF ₂
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	H
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me Me	H	H	1	H	H	Cl	Me	CF ₃
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	F
Me Me	H	H	1	H	H	F	Me	CF ₃
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OH
Me Me	H	H	1	H	H	OH	Me	CF ₃
Me Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OMe
Me Me	H	H	1	H	H	OMe	Me	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OBu-s
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OBu-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OBu
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-Pen)
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-Pen)
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OPen-n
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-Hex)
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-Hex)
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OHex-n
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OPen-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OHex-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Bu-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pen-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Hex-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CH=CH ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C≡CH
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCH ₂ CH F ₂	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OCH ₂ CF ₃	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-Cl)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-Br)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-F)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-Me)Ph

Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-CN)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-Cl)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-Br)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-F)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-CN)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-Cl)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-Br)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-F)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-CN)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SEt
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Pr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Bu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SCHF ₂

Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CHF ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SCF ₃
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CF ₃
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SPh
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SO ₂ Ph
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ Ph
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ Ph
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)OEt
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)OEt
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SCH(Me)C(=O)OEt
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH(Me)C(=O)OEt
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)NH ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)NH ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)NHMe
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)NHMe
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	NH ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	NHMe
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	N(Me) ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	NHC(=O)Me
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	N(Me)C(=O)Me
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	NHSO ₂ Me
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ Me
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	NHSO ₂ CHF ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	NHSO ₂ CF ₃
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	NHPh
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	N(Me)Ph
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	CN
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	CF ₃
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	C(=O)OMe
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	C(=O)OCH ₂ Ph
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	C(=O)OPh
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	C(=O)NH ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	C(=O)NHMe
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	C(=O)N(Me) ₂
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	C(=O)Me
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	C(=O)CF ₃
Me Me	H H 1 H H	CF ₃	Me	C(=O)CH ₂ Ph

Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	C(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Pr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₂ CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Et	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Et	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Et	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Et	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Et	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr-i	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr-i	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr-i	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Pr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Bu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-t	H
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-t	F
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-t	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-t	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-t	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-t	Me

Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-s	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu-s	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Bu	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Bu	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	1-甲基丁基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-甲基丁基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	1-乙基丙基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-乙基丙基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	1-戊基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-戊基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	1-甲基戊基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-甲基戊基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	2-乙基丁基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	2-乙基丁基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	3,3-二甲基丁基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	3,3-二甲基丁基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	1-己基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-己基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	1-庚基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-庚基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	1-辛基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-辛基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN

Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OH
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Bu-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPen-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	1-环丙基乙基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	1-环丙基乙基	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-甲基环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ (2-甲基环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二甲基环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二甲基环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ (2-氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ (2-氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH=CHCl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C≡CH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C≡CH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHMeC≡CH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHMeC≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C≡CMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHF ₂	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHF ₂	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHF ₂	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CHF ₂	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Et	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CHF ₂	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	F
Me	Me	H	H	1	H	H	F	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CN	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ OEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ NHMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ N(Me) ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ SMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CN	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CN	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)OEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH(Me)C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH(Me)C(=O)OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(Me) ₂ C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	C(Me) ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NH ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=NOMe)Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C(=NOMe)Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Et	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Pr	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Pr-i	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Bu-t	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CH ₂ OMe	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CHF ₂	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	H
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	F
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OH
Me	Me	H	H	1	H	H	OH	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	OEt	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CH=CH ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C≡CH
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OCH(Me)C(=O)OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OC(Me) ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Me

Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SEt
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SPr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Pr
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SBu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Bu-t
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NH ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	NHPh
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	咪唑-1-基
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	吡唑-1-基
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	1,2,4-三唑-1-基

Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	1,2,4-三唑-4-基
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	四唑-1-基
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	四唑-5-基
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧基
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)磺酰基
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₂ CF ₃	Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-NO ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(2-C(=O)NMe ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-NO ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NMe ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-NO ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NMe ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	嘧啶-2-基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	噻吩-2-基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	呋喃-2-基	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	SO ₂ Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	SO ₂ Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	SO ₂ CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	SO ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)CH ₂ Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)CHCl ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)OPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)OCH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	C(=O)NHPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	NH ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	-(CH ₂) ₂ O- -(CH ₂) ₃ O- -(CH ₂) ₃ S- -(CH ₂) ₃ SO ₂ - -(CH ₂) ₂ O- -(CH ₂) ₃ O- -(CH ₂) ₃ S- -(CH ₂) ₃ SO ₂ - -(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl		
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl		
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl		
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe		

Me	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂		-(CH ₂) ₄ -
H	H	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	H	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	H	Me	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	Me	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	Et	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	Me	CF ₃	Me	Cl
Me	Et	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Et	Et	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
	-(CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -	H	1	H	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H	1	H	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -	H	1	H	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H	1	H	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	H	F
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	H	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	H	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	H	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	H	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Et	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	Pr-i	Me	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	Bu-t	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Bu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OH
Me	Me	H	H	0	H	H	OH	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OPr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OBu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OBu-s
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OBu-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OBu
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-Pen)
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-Pen)
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OPen-n
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-Hex)
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-Hex)
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OHex-n
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OPen-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OHex-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Bu-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pen-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Hex-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CH=CH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C*CH

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCH ₂ CH F ₂	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OCH ₂ CF ₃	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-Cl)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-Br)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-F)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-CN)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-Cl)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-Br)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-F)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-CN)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(4-Cl)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(4-Br)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(4-F)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(4-Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(4-OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(4-NO ₂)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(4-CN)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(4-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Et

Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	OC(=O)CH ₂ Ph
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	OC(=O)CF ₃
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	OC(=O)Ph
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	OSO ₂ Me
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	OSO ₂ Et
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	OSO ₂ CF ₃
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	OSO ₂ Ph
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SMe
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ Me
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SEt
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ Et
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SPr
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ Pr
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SPr-i
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ Pr-i
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SBu-t
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ Bu-t
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SCHF ₂
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CHF ₂
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SCF ₃
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CF ₃
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SPh
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ Ph
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ Ph
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ Ph
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)OEt
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)OEt
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SCH(Me)C(=O)OEt
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH(Me)C(=O)OEt
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)NH ₂
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)NH ₂
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)NHMe
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)NHMe
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SCH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	SO ₂ CH ₂ C(=O)N(Me) ₂
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	NH ₂
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	NHMe
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	N(Me) ₂
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	NHC(=O)Me
Me Me	H H 0 H H	CF ₃	Me	N(Me)C(=O)Me

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OCH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	C(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Pr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₂ CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Et	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	Et	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Et	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Et	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Et	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Et	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Pr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Pr	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Pr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Bu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	H
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	F
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Bu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-s	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu-s	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Bu	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	1-甲基丁基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-甲基丁基	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	1-乙基丙基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-乙基丙基	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	1-戊基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-戊基	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	1-甲基戊基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-甲基戊基	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	2-乙基丁基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	2-乙基丁基	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	3,3-二甲基丁基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	3,3-二甲基丁基	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	1-己基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-己基	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	1-庚基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-庚基	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	1-辛基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-辛基	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OH
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OBu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Bu-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPen-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	1-环丙基乙基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-环丙基乙基	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-甲基环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ (2-甲基环丙基)	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二甲基环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二甲基环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-氯环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ (2-氯环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二氯环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二氯环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ (2-氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ (2,2-二氟环丙基)	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH=CHCl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C=CH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C=CH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C=CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C=CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CH ₂ C=CH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C=CH	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C≡CMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Et	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF ₂	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	F
Me	Me	H	H	0	H	H	F	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OEt

Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ OEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ N(Me) ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ SMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CN	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CN	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)OMe	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)OEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH(Me)C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH(Me)C(=O)OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(Me) ₂ C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	C(Me) ₂ C(=O)OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NH ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=NOMe)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C(=NOMe)Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ C(=O)CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ C(=O)Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Et	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Pr	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Pr-i	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Bu-t	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CH ₂ OMe	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	H
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	F
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Ph	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OH
Me	Me	H	H	0	H	H	OH	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OPr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OBu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CH=CH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C≡CH
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OCH(Me)C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OC(Me) ₂ C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SPr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Pr
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SBu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Bu-t
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ CHF ₂

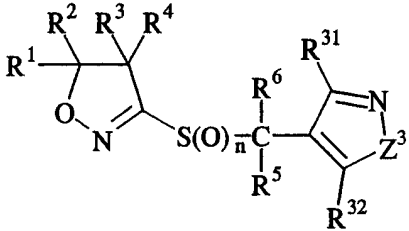
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	NH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	咪唑-1-基
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	吡唑-1-基
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	1,2,4-三唑-1-基
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	1,2,4-三唑-4-基
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	四唑-1-基
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	四唑-5-基
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧基
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	(4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)磺酰基
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₂ CF ₃	Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-NO ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(2-C(=O)NMe ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-Cl)Ph	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-NO ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(3-C(=O)NMe ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-Cl)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-F)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-NO ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-CN)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=O)Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OEt)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OPr-i)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NH ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	(4-C(=O)NMe ₂)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	嘧啶-2-基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	噻吩-2-基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	呋喃-2-基	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO ₂ Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO ₂ Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO ₂ CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	SO ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)Bu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)Ph	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)CH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)CH ₂ Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)CHCl ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)OPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)OCH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)N(Me) ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=O)NHPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	NH ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	$-(CH_2)_2O-$ $-(CH_2)_3O-$ $-(CH_2)_3S-$ $-(CH_2)_3SO_2-$ $-(CH_2)_2O-$ $-(CH_2)_3O-$ $-(CH_2)_3S-$ $-(CH_2)_3SO_2-$ $-(CH_2)_4-$ $-(CH_2)_4-$	
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl		
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl		
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl		
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃		
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe		
Me	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂		
H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	H	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	H	Me	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	Me	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	Et	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	Me	CF ₃	Me	Cl
Me	Et	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Et	Et	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
	-(CH ₂) ₂ -	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
	-(CH ₂) ₃ -	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
	-(CH ₂) ₄ -	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
	-(CH ₂) ₅ -	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	H	CF ₃	Me	Cl

H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	CF ₃	Me	Cl
Me	Et	H	2	H	H	H	H	H

表 4

									
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ³	R ³¹	R ³²
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	O	OCHF ₂	F
Me	Me	H	H	2	H	H	O	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	O	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	OCHF ₂	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	F
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	OP r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SEt
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SOEt
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SP r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SOP r -i

Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SO ₂ P r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SPh
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SOPh
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SOCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SCF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SOCF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	NHPh
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Ph	Me
H	H	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Me	H	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Me	H	Me	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	Me	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	Me	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	Et	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	Me	Me	O	CF ₃	Me
Me	Et	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Et	Et	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me

Me	Pr-i	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Pr	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₂ -		H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₃ -		H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₄ -		H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₅ -		H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	F
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	F
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	CN
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	F
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SEt
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SOEt
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SP r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SOP r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SO ₂ P r -i
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SOPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SOCHF ₂

Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SCF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SOCHF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NH ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	NHPh
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	CN
H	H	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	H	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	H	Me	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	Me	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	Et	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	Me	Me	S	CF ₃	Cl
Me	Et	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Et	Et	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Pr	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₂ -		H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₃ -		H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₄ -		H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₅ -		H	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl

H	-(CH ₂) ₃ -	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H	2	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	F
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	Cl
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	OMe
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	OE t
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	OP r -i
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	OP h
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	Me
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	CF ₃
Me	Me	H	1	H	H	O	Me	CN
Me	Me	H	1	H	H	O	OCHF ₂	F
Me	Me	H	1	H	H	O	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	1	H	H	O	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	1	H	H	O	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	1	H	H	O	OCHF ₂	CN
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	F
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	Cl
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	OMe
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	OE t
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	OP r -i
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	OP h
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SMe
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SO ₂ Me
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SE t
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SO ₂ Et
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SP r -i
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SO ₂ P r -i
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SPh
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SO ₂ Ph
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SCHF ₂
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SCF ₃
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	NH ₂
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)Me
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)CF ₃
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ Ph

Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	NHPh
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	O	CF ₃	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Ph	Me
H	H	H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Me	H	H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Me	H	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	Me	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	Me	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	Et	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	Me	Me	O	CF ₃	Me
Me	Et	H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Et	Et	H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Pr	H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₂ -		H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₃ -		H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₄ -		H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₅ -		H	H	1	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₃ -	H	1	H	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₄ -	H	1	H	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₅ -	H	1	H	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₆ -	H	1	H	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	F
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	OEt

Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	F
Me	Me	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	S	OCHF ₂	CN
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	F
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SMe
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SEt
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SP r -i
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SO ₂ P r -i
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SPh
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SCF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NH ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHMe
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	NHPh
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	CN
H	H	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	H	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	H	Me	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	Me	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	Et	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	Me	Me	S	CF ₃	Cl
Me	Et	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Et	Et	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Pr	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₂ -		H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₃ -		H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₄ -		H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₅ -		H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	1	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	F
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	O	OCHF ₂	F
Me	Me	H	H	0	H	H	O	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	OCHF ₂	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	F
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	OMe

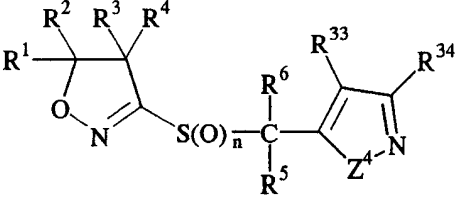
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	OP r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SMe
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SEt
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SP r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SO ₂ P r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SPh
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SCF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Ph	Me
H	H	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Me	H	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Me	H	Me	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	Me	H	0	H	H	O	CF ₃	Me

Me	Me	H	H	0	Me	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	Et	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	Me	Me	O	CF ₃	Me
Me	Et	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Et	Et	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Pr	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	F
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	F
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	F
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SMe
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SEt
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SP r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SO ₂ P r -i
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SPh
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Ph

Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SCF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NH ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHC(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHMe
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	NHPh
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me) ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	CN
H	H	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	H	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	H	Me	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	Me	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	Et	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	S	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	0	Me	Me	S	CF ₃	Cl
Me	Et	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Et	Et	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Pr	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl

H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	S	CF ₃	Cl

表 5

									
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ³³	R ³⁴
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Et
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	Cl	Me

Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ OMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ OMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ C≡CH	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ C≡CH	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ C≡CH	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OE _t	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCH ₂ CF ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCH ₂ CH=CH	Me

2

Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCH ₂ C≡CH	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(2-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(2-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(2-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(2-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(3-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(4-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(塞吩-2-基)	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(塞吩-2-基)	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	N(塞吩-2-基)	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Me	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Me	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Me	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CF ₃	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CF ₃	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CF ₃	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OCH ₂ P _h	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OCH ₂ P _h	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OCH ₂ P _h	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OPh	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OPh	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)NHMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)NHMe	CF ₃	H

Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)NHMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	OCHF ₂	H
H	H	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	Me	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	Me	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	Et	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	Me	Me	NPh	Cl	Me
Me	Et	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Et	Et	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₂ -		H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₃ -		H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₄ -		H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₅ -		H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	2	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Cl	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Cl	Et
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	CF ₃	H

Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ OMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ OMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ C≡CH	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ C≡CH	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ C≡CH	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	CF ₃	Me

Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OCH ₂ CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OCH ₂ CH=C	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	H ₂	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OCH ₂ C	≡
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	CH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(3-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(3-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(3-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(3-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(噻吩-2-基)	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(噻吩-2-基)	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	N(噻吩-2-基)	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Me	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Me	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Me	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)CF ₃	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)CF ₃	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)CF ₃	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)Ph	OCHF ₂	H

Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OCH ₂ P _h	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OCH ₂ P _h	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OCH ₂ P _h	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OPh	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)OPh	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)NHMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)NHMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)NHMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	OCHF ₂	H
H	H	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	Me	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Me	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Et	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	Me	Me	NPh	Cl	Me
Me	Et	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Et	Et	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₂ -		H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₃ -		H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₄ -		H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₅ -		H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me

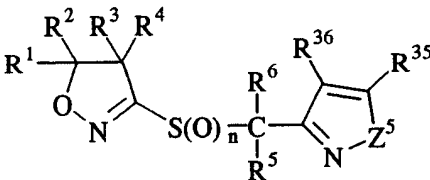
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Cl	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Cl	Et
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ Ph	Cl	Me

Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ OMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ OMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ C≡CH	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ C≡CH	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ C≡CH	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OCH ₂ CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OCH ₂ CH=C	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	H ₂	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OCH ₂ C	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	CH	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(3-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-Cl)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-F)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-Me)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(Thiophen-2-y	Cl	Me

Me	Me	H	H	0	H	H	l) N(Thiophen-2-y	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	l) N(Thiophen-2-y	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	l) NC(=O)Me	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Me	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Me	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)CF ₃	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)CF ₃	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)CF ₃	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)CH ₂ Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OCH ₂ P h	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OCH ₂ P h	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OCH ₂ P h	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OPh	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)OPh	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)NHMe	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)NHMe	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)NHMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	OCHF ₂	H
H	H	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	H	Me	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	Me	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	Et	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	Me	Me	NPh	Cl	Me
Me	Et	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me

Et	Et	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	NPh	Cl	Me
H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	NPh	Cl	Me	
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	NPh	Cl	Me	
H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	NPh	Cl	Me	
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	NPh	Cl	Me	
Me	Me	H	H	0	H	H	O	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	H	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Cl	Me
Me	Et	H	H	2	H	H	NH	H	H

表 6

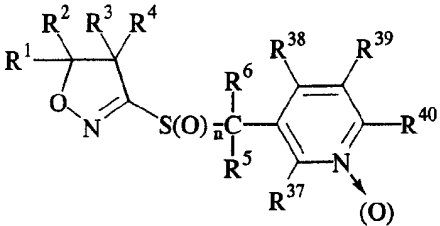
									
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁵	R ³⁵	R ³⁶
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	H	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	H	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	H	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NEt	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	2	H	H	N(CH ₂) ₃ O-		H
Me	Me	H	H	2	H	H	N(CH ₂) ₄ O-		H
Me	Me	H	H	2	H	H	N(CH ₂) ₄ -		H

Me	Me	H	H	2	H	H	N(CH ₂) ₅ -		H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	H
Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	H
H	H	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	H	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Me	H	Me	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	2	Me	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	2	Et	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	2	Me	Me	NPh	H	OMe
Me	Et	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Et	Et	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Me	Pr	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
-(CH ₂) ₂ -		H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
-(CH ₂) ₃ -		H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
-(CH ₂) ₄ -		H	H	2	H	H	NPh	H	OEt
-(CH ₂) ₅ -		H	H	2	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) ₃ -	H	2	H	H	H	NPh	H	OEt
H	-(CH ₂) ₄ -	H	2	H	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) ₅ -	H	2	H	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) ₆ -	H	2	H	H	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	H	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	H	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	H	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	1	H	H	N(CH ₂) ₃ O-		H
Me	Me	H	H	1	H	H	N(CH ₂) ₄ O-		H

Me	Me	H	H	1	H	H	N(CH ₂) ₄ -		H
Me	Me	H	H	1	H	H	N(CH ₂) ₅ -		H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	H	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	O	Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	H
H	H	H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
Me	H	H	H	1	H	H	NPh	H	OEt
Me	H	Me	H	1	H	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	1	Me	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	1	Et	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	1	Me	Me	NPh	H	OMe
Me	Et	H	H	1	H	H	NPh	H	OEt
Et	Et	H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	NPh	H	OEt
Me	Pr	H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	NPh	H	OEt
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
-(CH ₂) ₂ -		H	H	1	H	H	NPh	H	OEt
-(CH ₂) ₃ -		H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
-(CH ₂) ₄ -		H	H	1	H	H	NPh	H	OEt
-(CH ₂) ₅ -		H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	NPh	H	OEt
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	1	H	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	H	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	H	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	H	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr-i	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₃ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -	
Me	Me	H	H	0	H	H	N(CH ₂) ₃ O-		H

Me	Me	H	H	0	H	H	N(CH ₂) ₄ O-		H
Me	Me	H	H	0	H	H	N(CH ₂) ₄ -		H
Me	Me	H	H	0	H	H	N(CH ₂) ₅ -		H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	H	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	O	Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	H
H	H	H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	H	H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
Me	H	Me	H	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	0	Me	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	0	Et	H	NPh	H	OMe
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	0	Me	Me	NPh	H	OMe
Me	Et	H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
Et	Et	H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
Me	Pr	H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	NPh	H	OEt
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	H	NPh	H	OEt
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	H	NPh	H	OEt
Me	Et	H	H	2	H	H	O	H	H
Me	Et	H	H	2	H	H	S	H	H
Me	Et	H	H	2	H	H	NH	H	H

表 7

											
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ³⁷	R ³⁸	R ³⁹	R ⁴⁰	
Me	Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	N-氧化物
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	N-氧化物
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	CN	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	H	H	N-氧化物
Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	Me	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Cl	H	H	-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	(CH ₂) ₃	H		-
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	(CH ₂) ₃	H		-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	(CH ₂) ₄	H		-
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	(CH ₂) ₄	H		-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	H	(CH ₂) ₃		-
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	H	(CH ₂) ₃		-
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	H	(CH ₂) ₄		-
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	H	(CH ₂) ₄		-
H	H	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	H	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	H	Me	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	Me	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	Me	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	Et	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	Pr-l	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	2	Me	Me	H	CF ₃	H	H	-
Me	Et	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Et	Et	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-

Me	Pr-i	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
	-(CH ₂) ₂ -	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
	-(CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
	-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₃ -	H	2	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₄ -	H	2	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₅ -	H	2	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₆ -	H	2	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	H	H	H	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	H	H	H	H	N-氧化物
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Ph	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Ph	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Me	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Me	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	H	CF ₃	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	CF ₃	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	CF ₃	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Me	Me	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Ph	Ph	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Cl	H	H
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	(CH ₂) ₃	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Me	(CH ₂) ₃	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	(CH ₂) ₄	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Me	(CH ₂) ₄	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	H	(CH ₂) ₃	-
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Me	H	(CH ₂) ₃	-
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	H	(CH ₂) ₄	-
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Me	H	(CH ₂) ₄	-
H	H	H	H	1	H	H	H	H	CF ₃	H	H
Me	H	H	H	1	H	H	H	H	CF ₃	H	H
Me	H	Me	H	1	H	H	H	H	CF ₃	H	H
Me	Me	Me	H	1	H	H	H	H	CF ₃	H	H
Me	Me	H	H	1	Me	H	H	H	CF ₃	H	H
Me	Me	H	H	1	Et	H	H	H	CF ₃	H	H

Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	1	Me	Me	H	CF ₃	H	H	-
Me	Et	H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Et	Et	H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr	H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
-(CH ₂) ₂ -		H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
-(CH ₂) ₃ -		H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
-(CH ₂) ₄ -		H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
-(CH ₂) ₅ -		H	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₃ -	H	1	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₄ -	H	1	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₅ -	H	1	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₆ -	H	1	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	H	H	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	H	H	H	H	N-氧化物
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Me	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Me	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Me	H	H	N-氧化物
Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	Me	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(4-Cl)Ph	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Cl	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(CH ₂) ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	(CH ₂) ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(CH ₂) ₄	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	(CH ₂) ₄	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H	(CH ₂) ₃	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	H	(CH ₂) ₃	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H	(CH ₂) ₄	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	H	(CH ₂) ₄	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	(2-氯吡啶-3-基)甲硫基	H	H	H	-

H	H	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	H	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	Me	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	H	Me	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	Me	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	Et	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Me	H	H	0	Me	Me	H	CF ₃	H	H	-
Me	Et	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Et	Et	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	H	H	CF ₃	H	H	-
Me	Et	H	H	2	H	H	H	H	H	H	-

表 8

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ⁴¹	R ⁴²	R ⁴³
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Cl

Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Cl
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	Me

Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	Pr-i

Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	Pr-c
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	CHF ₂

Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CF ₃

Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	OMe

Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	OPh

Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	OPh
Me	Me	H	H	2	H	H	H	F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OBu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OHex-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SCHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NH ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NMe ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NEt ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	NHPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	N(Me)Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	H	CN	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OEt	CF ₃

Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OHex-c	CF ₃

Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SPr-i	CF ₃

Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NHEt	CF ₃

Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	CN	CF ₃
H	H	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
H	H	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	H	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	H	Me	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃

Me	H	Me	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Me	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Et	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Et	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H	H	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Me	Me	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Me	Me	H	OEt	CF ₃
Me	Et	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Et	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Et	Et	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Et	Et	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₂ -		H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₂ -		H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₃ -		H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₃ -		H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₄ -		H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₄ -		H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₅ -		H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₅ -		H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Cl

Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	Cl
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	Me

Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	Pr-i

Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	Pr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-c

Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	Pr-c
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	K	SCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	OMe

Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OPh

Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCH ₂ Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OCHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SCHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NH ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NMe ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NEt ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	H	CN	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Cl	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH ₂ Pen-c	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	OMe	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO ₂ Me	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SMe	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃

Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	SO ₂ Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	CN	CF ₃
H	H	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
H	H	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃

Me	H	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	H	Me	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Me	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Et	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Et	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	H	H	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Me	Me	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Me	Me	H	OEt	CF ₃
Me	Et	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Et	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Et	Et	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Et	Et	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₂ -		H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₂ -		H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₃ -		H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₃ -		H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₄ -		H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₄ -		H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₅ -		H	H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₅ -		H	H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH ₂) ₃ -		H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH ₂) ₃ -		H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH ₂) ₄ -		H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH ₂) ₄ -		H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH ₂) ₅ -		H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH ₂) ₅ -		H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH ₂) ₆ -		H	1	H	H	H	OMe	CF ₃
H	-(CH ₂) ₆ -		H	1	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Cl

Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Me

Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Pr-i

Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Pr-i
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	Pr-c

Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	Pr-c
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	OMe

Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	OMe
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	OPh

Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	OPh
Me	Me	H	H	0	H	H	H	F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPr	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OBu-t	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Pen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Hex-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPen-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHex-c	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SH	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Et	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-i	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Ph	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SCHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHEt	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NEt ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	H	N(Me)Ph	OCHF ₂

Me	Me	H	H	0	H	H	H	CN	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	F	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	F	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OBu-t	CF ₃

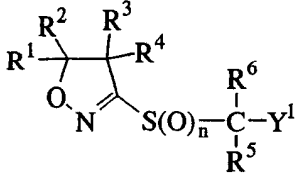
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	F	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	OCHF ₂	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SMe	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	F	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Ph	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	SO ₂ Me	CN	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	F	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OBu-t	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCH ₂ Bu-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCH ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OPen-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OHex-c	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SH	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SPr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	NH ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	NHEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	NEt ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	NHPh	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	N(Me)Ph	CF ₃

Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	CN	CF ₃
H	H	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
H	H	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	H	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	H	Me	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Me	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Et	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Et	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	H	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Me	Me	H	OMe	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Me	Me	H	OEt	CF ₃
Me	Et	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Et	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Et	Et	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Et	Et	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃
H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃	
H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃	
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃	
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃	
H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃	
H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃	
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃	
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	H	OEt	CF ₃	

表 9

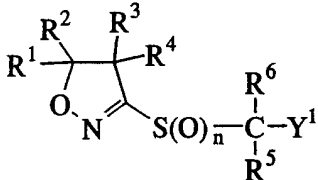
							
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
Me	Me	H	H	2	H	H	吡啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	吡啶-2-基1-氧化物
Me	Me	H	H	2	H	H	吡啶-4-基
Me	Me	H	H	2	H	H	吡啶-4-基1-氧化物
Me	Me	H	H	2	H	H	1,2,4-噁二唑-3-基
Me	Me	H	H	2	H	H	3-苯基-1,2,4-噁二唑-5-基
Me	Me	H	H	2	H	H	3-苄基-1,2,4-噁二唑-5-基
Me	Me	H	H	2	H	H	2-氯噻唑-4-基
Me	Me	H	H	2	H	H	5-三氟甲基-1,3,4-噻二唑-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	1,4-二甲基咪唑-5-基
Me	Me	H	H	2	H	H	1-苯基-4-甲氧基咪唑-1,2,3-三唑-5-基
Me	Me	H	H	2	H	H	1-二氟甲基-1,2,4-三唑-3-基
Me	Me	H	H	2	H	H	1-二氟甲基-1,2,4-三唑-5-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4-二氟甲基-1,2,4-三唑-3-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4,6-二乙氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4-氯-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4-二氟甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4-苯氧基-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4-氯-6-三氟甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4-二氟甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	4-苯氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基
H	H	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	H	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	H	Me	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	Me	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	Et	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	2	Me	Me	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Et	Et	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Pr	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基

Me	Pr-c	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
	-(CH ₂) ₂ -	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
	-(CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
	-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	2	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	吡啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	吡啶-2-基1-氧化物
Me	Me	H	H	1	H	H	吡啶-4-基
Me	Me	H	H	1	H	H	吡啶-4-基1-氧化物
Me	Me	H	H	1	H	H	1,2,4-噁二唑-3-基
Me	Me	H	H	1	H	H	3-苯基-1,2,4-噁二唑-5-基
Me	Me	H	H	1	H	H	3-苄基-1,2,4-噁二唑-5-基
Me	Me	H	H	1	H	H	2-氯噻唑-4-基
Me	Me	H	H	1	H	H	5-三氟甲基-1,3,4-噻二唑-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	1,4-二甲基咪唑-5-基
Me	Me	H	H	1	H	H	1-苯基-4-甲氧基咪唑-1,2,3-三唑-5-基
Me	Me	H	H	1	H	H	1-二氟甲基-1,2,4-三唑-3-基
Me	Me	H	H	1	H	H	1-二氟甲基-1,2,4-三唑-5-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4-二氟甲基-1,2,4-三唑-3-yl
Me	Me	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4,6-二乙氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4-氯-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4-二氟甲氧基-6-甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4-苯氧基-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4-氯-6-三氟甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4-二氟甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	4-苯氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基
H	H	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	H	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	H	Me	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	Me	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	Et	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	1	Me	Me	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Et	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Et	Et	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基

Me	Pr	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Pr-c	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
	-(CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₆ -	H	H	1	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	吡啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	吡啶-2-基1-氧化物
Me	Me	H	H	0	H	H	吡啶-4-基
Me	Me	H	H	0	H	H	吡啶-4-基1-氧化物
Me	Me	H	H	0	H	H	1,2,4-噁二唑-3-基
Me	Me	H	H	0	H	H	3-苯基-1,2,4-噁二唑-5-基
Me	Me	H	H	0	H	H	3-苄基-1,2,4-噁二唑-5-基
Me	Me	H	H	0	H	H	2-氯噻唑-4-基
Me	Me	H	H	0	H	H	5-三氟甲基-1,3,4-噻二唑-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	1,4-二甲基咪唑-5-基
Me	Me	H	H	0	H	H	1-苯基-4-甲氧基羰基-1,2,3-三唑-5-基
Me	Me	H	H	0	H	H	1-二氟甲基-1,2,4-三唑-3-基
Me	Me	H	H	0	H	H	1-二氟甲基-1,2,4-三唑-5-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4-二氟甲基-1,2,4-三唑-3-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4,6-二乙氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4-氯-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4-甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4-二氟甲氧基-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4-苯氧基-6-甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4-氯-6-三氟甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4-二氟甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	4-苯氧基-6-三氟甲基嘧啶-2-基
H	H	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	H	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	H	Me	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	Me	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	Et	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Me	H	H	0	Me	Me	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Et	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Et	Et	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基

Me	Pr-i	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Pr	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
-(CH ₂) ₂ -		H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
-(CH ₂) ₃ -		H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
-(CH ₂) ₄ -		H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
-(CH ₂) ₅ -		H	H	0	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₃ -	H	0	H	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₄ -	H	0	H	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₅ -	H	0	H	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
H	-(CH ₂) ₆ -	H	0	H	H	H	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	吡咯-1-基
Me	Et	H	H	2	H	H	噁唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	噻唑-4-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,3-噻二唑-4-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,3-噻二唑-5-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,4-噻二唑-3-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,4-噻二唑-5-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1,3,4-噻二唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1,3,4-噻二唑-5-基
Me	Et	H	H	2	H	H	吡啶-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	吡啶-3-基
Me	Et	H	H	2	H	H	吡啶-4-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-咪唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-咪唑-4-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-咪唑-5-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-1,3,4-三唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	1H-1,3,4-三唑-5-基

表 10

							
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
Me	Me	H	H	2	H	H	苯并咪唑-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噁吩-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	3-氯苯并噁吩-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	苯并三唑-1-基

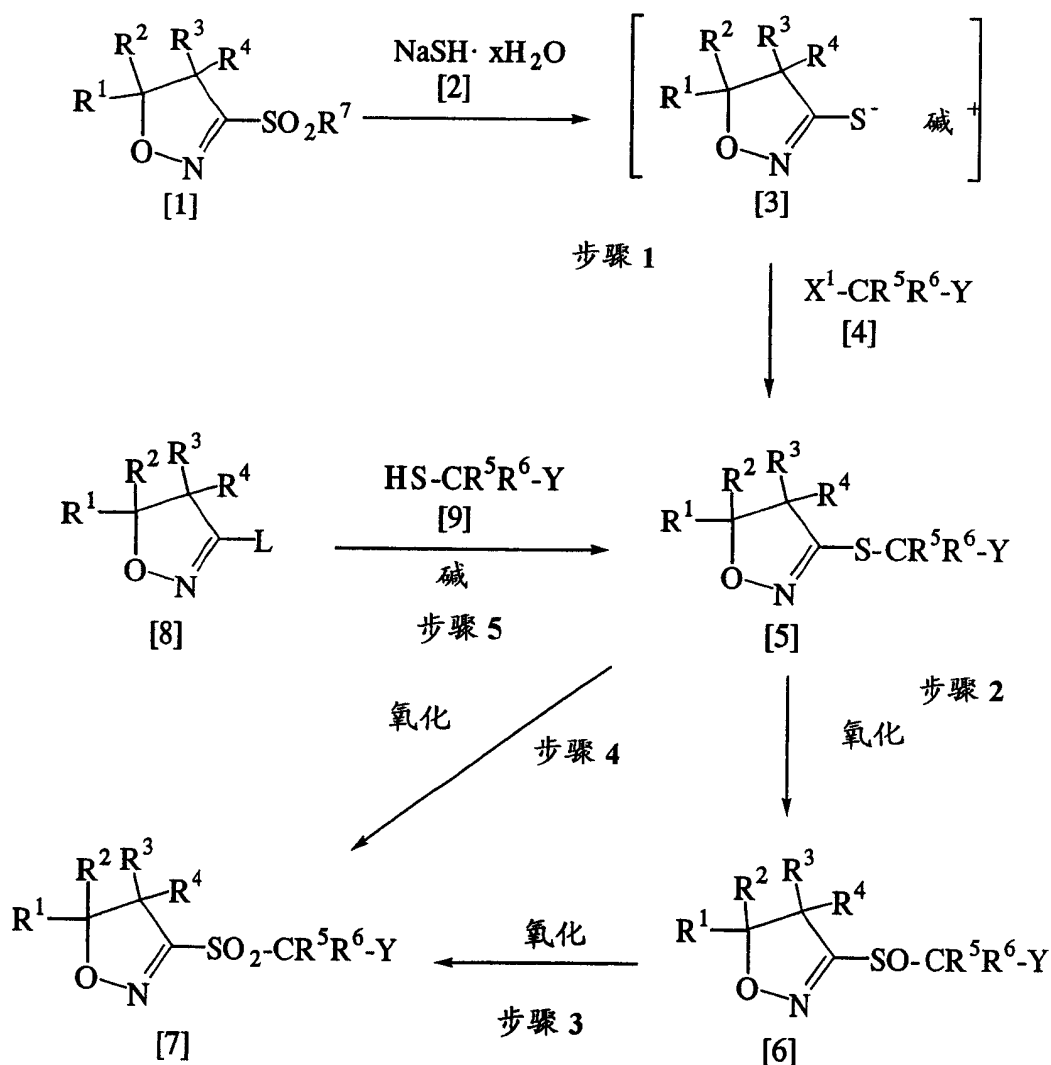
Me	Me	H	H	2	H	H	1-甲基吡啶-4-基
Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噻唑-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噻唑-3-基
Me	Me	H	H	2	H	H	5-氯苯并噻吩-3-基
Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噻唑-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	3-甲基苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	3-溴苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	苯并呋喃-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	2-甲基苯并呋喃-7-基
Me	Me	H	H	2	H	H	3-溴苯并呋喃-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噻吩-7-基
Me	Me	H	H	2	H	H	1-甲基吡啶-7-基
Me	Me	H	H	2	H	H	1-二氟甲基吡啶-7-基
Me	Me	H	H	2	H	H	3-甲基苯并呋喃-2-基
Me	Me	H	H	2	H	H	3-氯-1-甲基吡啶-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	苯并咪唑-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	3-氯苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	苯并三唑-1-基
Me	Me	H	H	1	H	H	1-甲基吡啶-4-基
Me	Me	H	H	1	H	H	苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	苯并噻吩-3-基
Me	Me	H	H	1	H	H	5-氯苯并噻吩-3-基
Me	Me	H	H	1	H	H	苯并噻唑-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	3-甲基苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	3-溴苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	2-甲基苯并呋喃-7-基
Me	Me	H	H	1	H	H	3-溴苯并呋喃-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	苯并噻吩-7-基
Me	Me	H	H	1	H	H	1-甲基吡啶-7-基
Me	Me	H	H	1	H	H	3-甲基苯并呋喃-2-基
Me	Me	H	H	1	H	H	3-氯-1-甲基吡啶-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	苯并咪唑-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	3-氯苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	苯并三唑-1-基
Me	Me	H	H	0	H	H	1-甲基吡啶-4-基
Me	Me	H	H	0	H	H	苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	苯并噻吩-3-基
Me	Me	H	H	0	H	H	5-氯苯并噻吩-3-基
Me	Me	H	H	0	H	H	苯并噻唑-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	3-甲基苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	3-溴苯并噻吩-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	苯并呋喃-2-基

Me	Me	H	H	0	H	H	2-甲基苯并呋喃-7-基
Me	Me	H	H	0	H	H	3-溴苯并呋喃-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	苯并噻吩-7-基
Me	Me	H	H	0	H	H	1-甲基呋喃-7-基
Me	Me	H	H	0	H	H	3-甲基苯并呋喃-2-基
Me	Me	H	H	0	H	H	3-氯-1-甲基呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-氯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-氯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-氯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-氯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-甲基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-甲基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-甲基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-甲基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-氯苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-甲基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-甲基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-甲氧基苯并噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	噻唑-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	噻唑-6-基
Me	Et	H	H	2	H	H	噻唑啉-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	3-氯苯并呋喃-2-基

Me	Et	H	H	2	H	H	4-氯苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-氯苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-氯苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-氯苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	3-甲基苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-甲基苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-甲基苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-甲基苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-甲基苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	3-甲氧基苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	4-甲氧基苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	5-甲氧基苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	6-甲氧基苯并呋喃-2-基
Me	Et	H	H	2	H	H	7-甲氧基苯并呋喃-2-基

本发明通式[1]化合物可依据下面所示的方法制得；然而，本发明化合物还可以通过其它方法制得。

<制备方法 1> 步骤 1 - 步骤 5



在上述制备方法中, R1、R2、R3、R4、R5、R6 和 Y 的定义同上; X1 是卤素原子; R7 是 C1 - C4 烷基、任选被取代的苯基或任选被取代的苄基; L 是离去基团例如卤素原子、C1 - C4 烷基磺酰基、任选被取代的苯基磺酰基、任选被取代的苄基磺酰基等; 且 x 是 1 或更大的整数。

下面针对各个步骤详细地描述上述制备方法。

(步骤 1)

通式[5]硫化物衍生物可这样制得: 将通式[1]化合物与通式[2]氢硫化钠水合物在或不在溶剂存在下(优选在合适的溶剂中), 在盐存在下反应, 以在反应系统中生成通式[3]硫醇碱, 然后不用分离出硫醇的盐[3], 将盐[3]与通式[4]卤素衍生物反应[对于这种情况, 可加入自由基生成剂例如雕白粉(Rongalit)(商品名): $\text{CH}_2(\text{OH})\text{SO}_2\text{Na} \cdot 2\text{H}_2\text{O}$]。

每个反应中的反应温度为 0℃ 至每个反应系统的回流温度之间的任何温度, 并优选为 10 - 100℃。根据所用的化合物, 反应时间可以不同, 但是一般为 0.5 - 24 小时。

至于在每个反应中使用的反应物的量, 相对于 1 当量的通式[1]化合物, 每一通式[2]化合物和通式[4]化合物的用量是 1 - 3 当量, 并且当使用碱时, 碱的用量是 0.5 - 3 当量。

作为溶剂可提及的有例如醚, 如二氧杂环己烷、四氢呋喃(THF)等; 卤代烃例如二氯乙烷、四氯化碳、氯苯、二氯苯等; 酰胺例如 N,N-二甲基乙酰胺、N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮等; 硫化化合物例如二甲亚砷、环丁砷等; 芳烃例如苯、甲苯、二甲苯等; 醇例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、叔丁醇等; 酮例如丙酮、2-丁酮等; 腈例如乙腈等; 水; 和它们的混合物。

作为碱, 可提及的有例如金属氢化物如氢化钠等; 碱金属氨基化物例如氨基钠、二异丙基氨基锂等; 有机碱例如吡啶、三乙胺、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯等; 碱金属氢氧化物例如氢氧化钠、氢氧化钾等; 碱土金属氢氧化物例如氢氧化钙、氢氧化镁等; 碱金属碳酸盐例如碳酸钠、碳酸钾等; 碱金属碳酸氢盐例如碳酸氢钠、碳酸氢

钾等；和金属醇化物例如甲醇钠、叔丁醇钾等。

(步骤 2)

通式[6]亚砷衍生物可通过将通式[5]硫化物衍生物与氧化剂在合适的溶剂中反应来制得。

反应温度为 0℃ 至反应系统的回流温度之间的任何温度，并优选为 0-60℃。根据所用的化合物，反应时间可以不同，但是一般为 1-72 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的通式[5]化合物，氧化剂的用量为 1-3 当量。

作为溶剂，可提及的有例如卤代烃，如二氯甲烷、氯仿、二氯乙烷、四氯化碳、氯苯、二氯苯等；醚例如二氧杂环己烷、四氢呋喃(THF)、二甲氧基乙烷、乙醚等；酰胺例如 N,N-二甲基乙酰胺、N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮等；醇例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、叔丁醇等；酮例如丙酮、2-丁酮等；腈例如乙腈等；乙酸；水和它们的混合物。

作为氧化剂，可提及的有例如有机过氧化物例如间氯过苯甲酸、过甲酸、过乙酸等；和无机过氧化物例如过氧化氢、高锰酸钾、高碘酸钠等。

(步骤 3)

通式[7]砷衍生物可通过将通式[6]亚砷衍生物与氧化剂在合适的溶剂中反应来制得。

反应温度为 0℃ 至反应系统的回流温度之间的任何温度，并优选为 0-60℃。根据所用的化合物，反应时间可以不同，但是一般为 1-72 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的通式[6]化合物，氧化剂的用量为 1-3 当量。

作为溶剂和氧化剂，可提及的有与步骤中所述相同的溶剂和氧化剂。

(步骤 4)

通式[7]砷衍生物还可以通过将通式[5]硫化物衍生物与适当量的氧化剂在合适的溶剂中反应，且不分离出通式[6]亚砷衍生物来制得。

反应温度为 0℃至反应系统的回流温度之间的任何温度，并优选为 0-60℃。根据所用的化合物，反应时间可以不同，但是一般为 1-72 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的通式[5]化合物，氧化剂的用量为 1-3 当量。

作为溶剂和氧化剂，可提及的有与步骤中所述相同的溶剂和氧化剂。

(步骤 5)

通式[5]硫化物衍生物可这样制得：将通式[8]化合物与通式[9]硫醇衍生物在或不在溶剂存在下(优选在合适的溶剂中)，在碱存在下反应。

反应温度为 0℃至反应系统的回流温度之间的任何温度，并优选为 10-100℃。根据所用的化合物，反应时间可以不同，但是一般为 0.5-24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的通式[8]化合物，通式[9]化合物的用量是 1-3 当量，并且碱的用量是 0.5-3 当量。

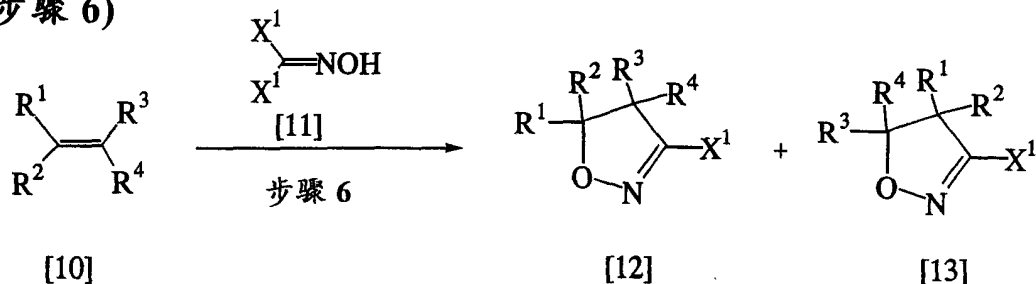
作为溶剂可提及的有例如醚，如乙醚、二甲氧基乙烷、二氧杂环己烷、四氢呋喃(THF)等；卤代烃例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等；酰胺例如 N,N-二甲基乙酰胺、N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮等；硫化化合物例如二甲亚砷、环丁砷等；芳烃例如苯、甲苯、二甲苯等；醇例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、叔丁醇等；酮例如丙酮、2-丁酮等；腈例如乙腈等；水；和它们的混合物。

作为碱，可提及的有例如金属氢化物如氢化钠等；碱金属氨基化物例如氨基钠、二异丙基氨基锂等；有机碱例如吡啶、三乙胺、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯等；碱金属氢氧化物例如氢氧化钠、氢氧化钾等；碱土金属氢氧化物例如氢氧化钙、氢氧化镁等；碱金属碳酸盐例如碳酸钠、碳酸钾等；碱金属碳酸氢盐例如碳酸氢钠、碳酸氢

钾等；和金属醇化物例如甲醇钠、叔丁醇钾等。

其中 L 是卤素原子的通式[8]化合物，即化合物[12]可通过下述步骤 6 所示的方法制得。如果需要的话，对化合物[12]和化合物[13]的混合物进行分离和纯化操作，以分离出化合物[12]。

(步骤 6)



在上述反应中，X1、R1、R2、R3 和 R4 的定义同上。

通式[12]和[13]所代表的异噁唑啉化合物可通过将通式[10]烯烃衍生物与通式[11]肟衍生物在或不在溶剂存在下(优选在合适的溶剂中)，在碱存在下反应来制得。当 R3 和 R4 分别是氢原子时，通式[12]异噁唑啉化合物可优先获得。

反应温度为 0℃ 至反应系统的回流温度之间的任何温度，并优选为 10-80℃。根据所用的化合物，反应时间可以不同，但是一般为 0.5 小时-2 周。

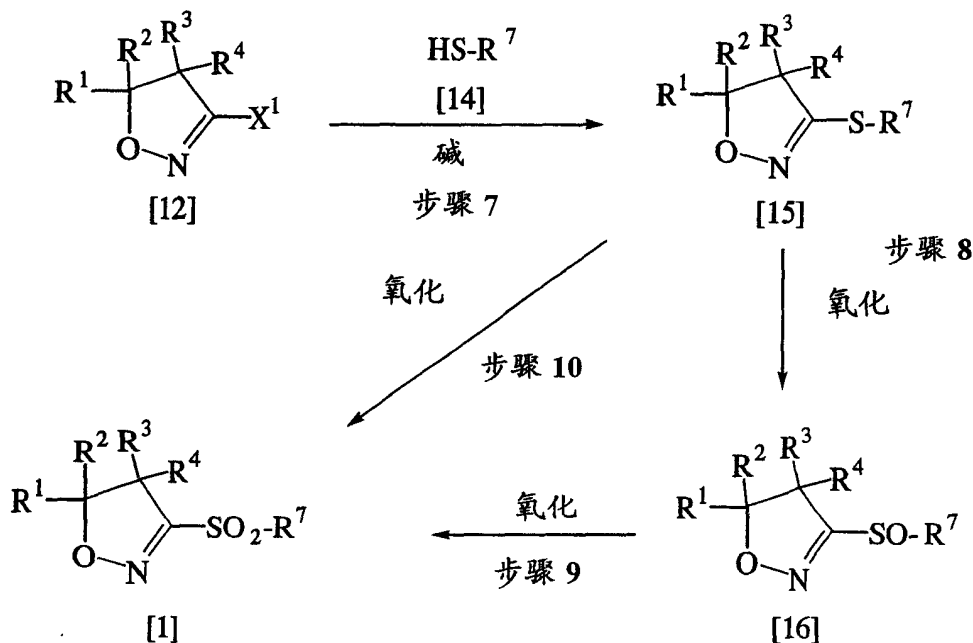
至于在反应中使用的反应物的量，每当量的通式[11]化合物，通式[10]化合物的用量是 1-3 当量。

作为溶剂，可提及的有例如醚，如乙二醇二甲醚、乙二醇二乙醚、乙醚、二氧杂环己烷、四氢呋喃等；卤代烃例如二氯乙烷、四氯化碳、氯苯、二氯苯等；芳烃例如苯、甲苯、二甲苯等；乙酸酯例如乙酸乙酯、乙酸丁酯等；水；和它们的混合物。

作为碱，可提及的有例如碱金属氢氧化物例如氢氧化钠、氢氧化钾等；碱土金属氢氧化物例如氢氧化钙、氢氧化镁等；碱金属碳酸盐例如碳酸钠、碳酸钾等；碱金属碳酸氢盐例如碳酸氢钠、碳酸氢钾等；碱金属乙酸盐例如乙酸钠、乙酸钾等；碱金属氟化物例如氟化钠、氟化钾等；和有机碱例如吡啶、三乙胺、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯等。

在上述制备方法中, 用作中间体的通式[10]化合物可以是市售产品或者可通过已知反应例如 Wittig 反应等制得。通式[11]化合物可通过例如 Liebigs Annalen der Chemie, 985 (1989)中描述的方法制得。

通式[1]化合物可通过下述方法由如上所示的通式[12]化合物制得。

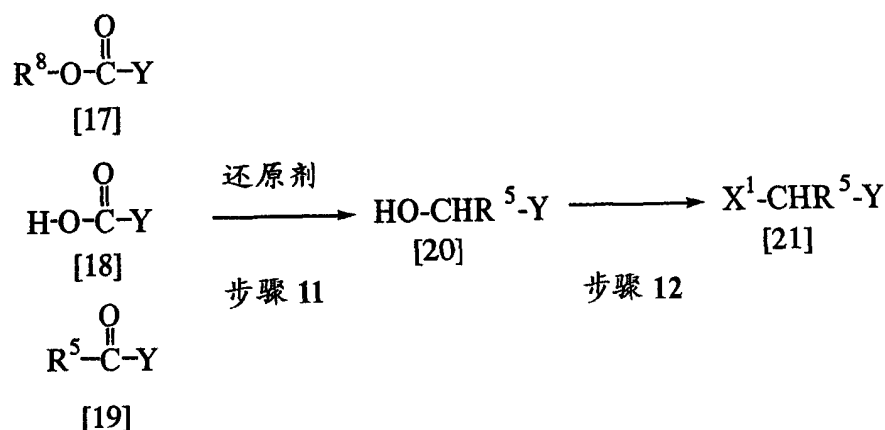


在上述反应中, X¹、R¹、R²、R³、R⁴ 和 R⁷ 的定义同上。

通式[15]化合物可通过上述步骤 5 制得; 通式[16]化合物可通过上述步骤 2 制得; 通式[1]化合物可通过上述步骤 4 由化合物[15]制得或者通过上述步骤 3 由化合物[16]制得。

作为溶剂、碱和氧化剂, 可提及的有与步骤 2、3、4 或 5 所述相同的溶剂、碱和氧化剂。

其中 R⁶ 是氢原子的通式[4]化合物, 即通式[21]化合物可通过下述方法制得。



在上述反应中，R⁵、X¹ 和 Y 的定义同上，且 R⁸ 是烷基。

(步骤 11)

通式[20]化合物可通过将化合物[17]、[18]或[19]与还原剂在溶剂中反应来制得。

该反应一般在-60 至 150℃进行 10 分钟 - 24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[17]、[18]或[19]，还原剂的用量可以理想地为 0.5 - 2 当量；然而，根据反应条件，该量可适当地改变。

作为还原剂，可提及的有：对于由[17]制备[20]，例如金属氢化物（例如二异丁基氢化铝）和金属氢配位化合物（例如硼氢化钠和氢化锂铝）；对于由[18]或[19]制备[20]，金属氢化物（例如二异丁基氢化铝）、金属氢配位化合物（例如硼氢化钠和氢化锂铝）和乙硼烷。

作为溶剂，可提及的有例如醚，如乙醚、四氢呋喃、二氧杂环己烷等；芳烃例如苯、甲苯等；和醇例如甲醇、乙醇等。

(步骤 12)

通式[21]化合物可通过将化合物[20]与卤化剂在溶剂中反应来制得。

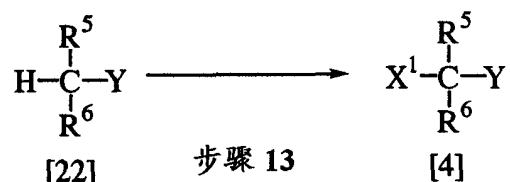
该反应一般是在-50 至 100℃进行 10 分钟 - 24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[20]，卤化剂的用量可以理想地为 1 - 3 当量；然而，根据反应条件，该量可适当地改变。

作为卤化剂，可提及的有例如氯化氢、溴化氢、三氯化磷、三溴化磷和亚硫酸氯。

作为溶剂，可提及的有例如卤代烃例如二氯乙烷、四氯化碳等；酸例如乙酸等；和醚例如四氢呋喃等。

通式[4]化合物可通过下述方法制得。



在上述反应中，R5、R6、X1 和 Y 的定义同上。

通式[4]化合物可通过将化合物[22]与卤化剂在溶剂中、在或不在催化剂存在下反应来制得。

该反应一般在 30 - 150℃ 进行 10 分钟 - 24 小时。

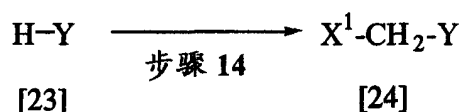
至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[22]，卤化剂的用量可以理想地为 1 - 10 当量；然而，根据反应条件，该量可适当地改变。催化剂的用量为 0.01 - 0.5 当量。

作为卤化剂，可提及的有例如卤素如溴、氯等；N-卤代琥珀酰亚胺例如 N-溴琥珀酰亚胺等；和吡啶盐例如吡啶过溴酸盐等。

作为溶剂，可提及的有例如卤代烃如二氯乙烷、四氯化碳、氯苯、二氯苯等；酰胺例如 N,N-二甲基乙酰胺、N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基-2-吡咯烷酮等；硫化合物例如二甲亚砜、环丁砜等；和羧酸例如甲酸、乙酸等。

作为催化剂，可提及的有例如过氧化苯甲酰、α,α-偶氮二异丁腈及其混合物。

其中 R5 和 R6 分别是氢原子的通式[4]化合物，即通式[24]化合物可通过下列方法制得。



在上述反应中，X1 和 Y 的定义同上。

通式[24]化合物可这样制得：依据 Org. Synth., III, 557 (1955)或 J. Am. Chem. Soc., 72, 2216 (1950)中描述的方法，将化合物[23]、卤化氢和甲醛或低聚甲醛在溶剂中、在或不在路易斯酸存在下反应，或者按照 J. Am. Chem. Soc., 97, 6155 (1975)中描述的方法，将化合物[23]与卤代甲基醚在溶剂中、在路易斯酸存在下反应。

该反应一般在-40 至 150℃进行 10 分钟 - 24 小时。

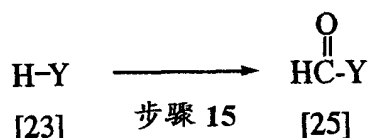
至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[23]，卤化氢、甲醛、低聚甲醛、路易斯酸或卤代甲基醚的用量理想地为 1 - 2 当量；然而，根据反应条件，该量可适当地改变。

作为路易斯酸，可提及的有例如四氯化钛、氯化锌、氯化铝和溴化锌。

作为卤化氢，可提及的有例如氯化氢、溴化氢和碘化氢。

作为溶剂，可提及的有例如卤代烃例如二氯乙烷、四氯化碳、氯仿等；脂族烃例如己烷、庚烷等；醚例如二氧杂环己烷、四氢呋喃等；羧酸例如乙酸等；二硫化碳；和它们的混合物。

其中 R5 是氢原子的通式[19]化合物，即通式[25]化合物可通过下述方法制得。



在上述反应中，Y 的定义同上。

通式[25]化合物可这样制得：按照在 Org. Synth., IV, 831 (1963)中描述的 Vilsmeier 法，将化合物[23]与 N,N-二甲基甲酰胺在磷酰氯、光气或亚硫酸氯存在下，在或不在溶剂存在下反应，或者按照在 Chem. Ber., 93, 88 (1960)中描述的方法，将化合物[23]与二卤代甲基醚在溶剂中、在路易斯酸存在下反应，然后进行水解。

该反应一般在-40 至 150℃进行 10 分钟 - 24 小时。

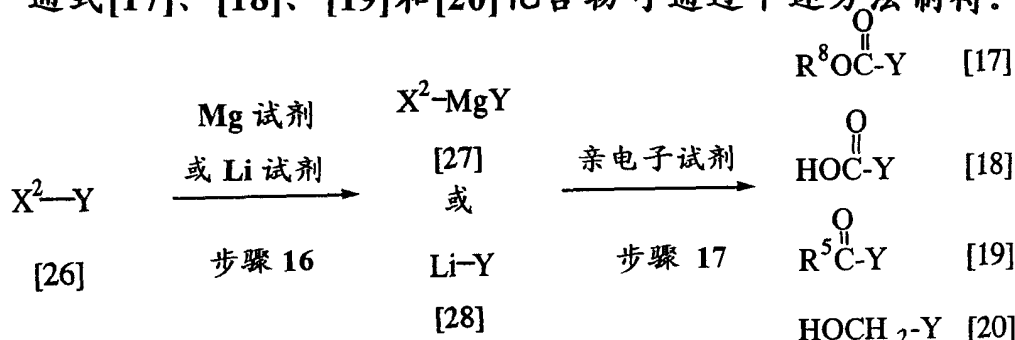
至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[23]，磷酰氯、光气、亚硫酸氯、N,N-二甲基甲酰胺、路易斯酸或二卤代甲基醚的用

量理想为 1-2 当量；然而，根据反应条件，该量可适当地改变。

作为路易斯酸，可提及的有例如四氯化钛、四氯化锡、氯化锌、氯化铝和溴化锌。

作为溶剂，可提及的有例如卤代烃如二氯乙烷、四氯化碳、氯仿等；脂族烃例如己烷、庚烷等；醚例如二氧杂环己烷、四氢呋喃等；羧酸例如乙酸等；酰胺例如 N,N-二甲基甲酰胺等；二硫化碳等；和它们的混合物。

通式 [17]、[18]、[19] 和 [20] 化合物可通过下述方法制得。



在上述反应中，R⁵、R⁸ 和 Y 的定义同上；且 X² 是氯原子、溴原子或碘原子。

通式 [17]、[18]、[19] 和 [20] 化合物可这样制得：按照在 J. Org. Chem., 65, 4618 (2000) 中描述的方法，将化合物 [26] 与镁试剂在或不在溶剂存在下反应以获得化合物 [27]，然后将化合物 [27] 与亲电子试剂反应，或者按照在 Synth. Commun., 24 (2), 253 (1994) 中描述的方法，将化合物 [26] 与正丁基锂在溶剂中反应以获得化合物 [28]，然后将化合物 [28] 与亲电子试剂反应。

该反应一般在 -100 至 150℃ 进行 10 分钟 - 24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物 [26]，镁试剂或锂试剂的用量理想地为 1-5 当量，亲电子试剂的用量理想地为 1-5 当量；然而，根据反应条件，这些量可适当地改变。

作为镁试剂，可提及的有例如金属镁、异丙基溴化镁和二异丙基镁。

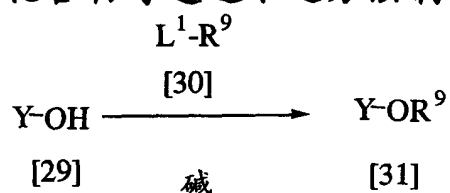
作为锂试剂，可提及的有例如正丁基锂、仲丁基锂和叔丁基锂。

作为亲电子试剂，可提及的有例如酯，如甲酸乙酯、氰基甲酸乙

酯、乙酸乙酯等；酰卤例如乙酰氯、氯甲酸甲酯等；酰胺例如 N,N-二甲基甲酰胺等；醛例如低聚甲醛等；和二氧化碳。

作为溶剂，可提及的有例如卤代烃例如二氯乙烷、四氯化碳、氯仿等；脂族烃例如己烷、戊烷等；醚例如二氧杂环己烷、四氢呋喃等；和它们的混合物。

在通式[4]、[17]、[18]、[19]、[20]、[22]、[23]、[26]、[29]或[34]化合物当中，通式[31]化合物可通过下述方法制得。



在上述反应中，Y 的定义同上；R⁹ 是烷基、卤代烷基、环烷基、环烷基烷基、烷氧基羰基烷基、任选被取代的苄基、任选被取代的杂化烷基、链烯基、炔基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、任选被取代的芳族杂环基、任选被取代的苯基磺酰基、酰基、卤代烷基羰基、任选被取代的苄基羰基或任选被取代的苯甲酰基；且 L¹ 是离去基团例如卤素原子、C1-C4 烷基磺酸酯基、C1-C4 烷基磺酰基、任选被取代的苄基磺酰基、任选被取代的苯基磺酸酯基、任选被取代的苄基磺酸酯基等。当 R⁹ 是卤代烷基时，L¹ 是其反应性高于卤代烷基化后剩余的卤素原子的离去基团。例如，当 R⁹ 是 CHF₂ 时，L¹ 是氯原子或溴原子；和当 R⁹ 是 CH₂CF₃ 时，L¹ 是氯原子、溴原子、对甲苯磺酰氧基或甲基磺酰氧基。

通式[31]化合物可通过将化合物[29]与化合物[30]在溶剂中于碱存在下反应来制得。

该反应一般在 0-120℃ 进行 10 分钟-24 小时。

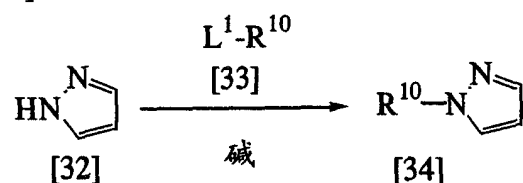
至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[29]，化合物[30]的量是 1-20 当量，其碱的用量是 1-3 当量。

作为碱，可提及的有例如碱金属碳酸盐，如碳酸钠、碳酸钾等；碱金属氢氧化物例如氢氧化钠、氢氧化钾等；碱金属氢化物例如氢化钾、氢化钠等；碱金属醇化物例如乙醇钠、甲醇钠等；和有机碱例如

1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯等。

作为溶剂,可提及的有例如卤代烃,如二氯甲烷、氯仿等;醚例如乙醚、四氢呋喃等;芳烃例如苯、甲苯等;脂族烃例如己烷、庚烷等;酮例如丙酮、甲基异丁基酮等;酯例如乙酸乙酯、乙酸甲酯等;酰胺例如 N-甲基吡咯烷酮、N,N-二甲基甲酰胺等;硫化合物例如二甲亚砜、环丁砜等;腈例如乙腈等;和它们的混合物。

在通式[4]、[17]、[18]、[19]、[20]、[22]、[23]、[26]、[29]或[31]化合物当中,通式[34]化合物可通过下述方法制得。



在上述反应中, L1 的定义同上, 且 R10 是、烷基、被选自取代基 β 的基团单取代的烷基、卤代烷基、环烷基、链烯基、炔基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、被选自取代基 γ 的基团单取代的烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、任选被取代的苯基、任选被取代的芳族杂环基、任选被取代的苯基磺酰基、任选被取代的芳族杂环基磺酰基、酰基、卤代烷基羰基、任选被取代的苄基羰基、任选被取代的苯甲酰基、烷氧基羰基、任选被取代的苄氧基羰基、任选被取代的苯氧基羰基或氨基甲酰基(其氮原子可被选自烷基和任选被取代的苯基的相同或不同基团取代)。吡唑环的碳原子可被 1-2 个相同或不同的选自取代基 α 的基团取代。

通式[34]化合物可通过将化合物[32]与化合物[33]在溶剂中于碱存在下反应来制得。

该反应一般在 0-120℃ 进行 10 分钟-24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量,每当量的化合物[32],化合物[33]的用量为 1-20 当量,且碱的量为 1-3 当量。

作为碱和溶剂,可提及的有例如与在由化合物[29]制备化合物[31]中提及的相同的碱和溶剂。

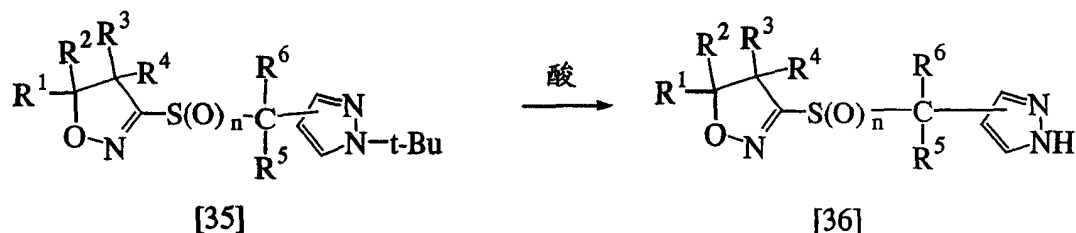
向 Y 内引入三氟甲基可依据或基于例如在下列文献中描述的方法

来进行: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 8, 2293-2299 (1990); J. Fluorine Chem., 50 (3), 411-426 (1990); J. Chem. Soc. Chem. Commun., 18, 1389-1391 (1993); J. Chem. Soc. Chem. Commun., 1, 53-54 (1992); Chem. Lett., 1719-1720 (1981); Chem. Pharm. Bull., 38 (9), 2446-2458 (1990); J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 921-926 (1988); Heterocycles, 37 (2), 775-782 (1994); Tetrahedron Lett., 30 (16), 2133-2136 (1989); J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 2755-2761 (1980); Heterocycles, 22 (1), 117-124 (1984); Eur. J. Med. Chem. Chim. Ther., 24, 249-258 (1989); Acta Chem. Scand. Ser. B, 38 (6), 505-508 (1984); J. Fluorine Chem., 21, 495-514 (1982); J. Chem. Soc. Chem. Commun., 10, 638-639 (1988); J. Fluorine Chem., 67 (1), 5-6 (1994); J. Heterocycl. Chem., 31 (6), 1413-1416 (1994); Chem. Heterocycl. Compd., 30 (5), 576-578 (1994); J. Fluorine Chem., 78 (2), 177-182 (1996); J. Heterocycl. Chem., 34 (2), 551-556 (1997); Tetrahedron, 55 (52), 15067-15070 (1999); 和 Synthesis, 11, 932-933 (1980).

通式[4]、[17]、[18]、[19]、[20]、[21]、[22]、[23]、[24]、[25]、[26]、[29]和[31]可依据或基于在例如下列文献中描述的方法来制得: 当 Y 是咪喃基时, Methoden der Organischen Chemie, E6a, 16-185 (1994); 当 Y 是噻吩基时, Methoden der Organischen Chemie, E6a, 186-555 (1994); 当 Y 是吡咯基时, Methoden der Organischen Chemie, E6a, 556-798 (1994); 当 Y 是吡唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8b, 399-763 (1994)和 JP-A-2000-219679; 当 Y 是异噻唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8a, 45-225 (1993); 当 Y 是异噻唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8a, 668-798 (1993); 当 Y 是噻唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8a, 891-1019 (1993); 当 Y 是噻唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8b, 1-398 (1994); 当 Y 是咪唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8c, 1-215 (1994); 当 Y 是吡啶基时, Methoden der Organischen Chemie, E7a, 286-686 (1992); 当 Y 是哒嗪基时,

Methoden der Organischen Chemie, E9a, 557-682 (1997); 当 Y 是嘧啶基时, Methoden der Organischen Chemie, E9b/1, 1-249 (1998); 当 Y 是吡嗪基时, Methoden der Organischen Chemie, E9b/1, 250-372 (1998); 当 Y 是三嗪基时, Methoden der Organischen Chemie, E9c, 530-796 (1998); 当 Y 是三唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8d, 305-405 and 479-598 (1994); 当 Y 是噁二唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8c, 397-818 (1994); 当 Y 是噻二唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8d, 59-304 (1994); 当 Y 是苯并呋喃基时, Methoden der Organischen Chemie, E6b1, 33-216 (1994)和出版的国际专利申请 WO-1997/29105; 当 Y 是苯并噻吩基时, Methoden der Organischen Chemie, E6b1, 217-322 (1994); 当 Y 是吲哚基时, Methoden der Organischen Chemie, E6b1, 546-848 (1994), Methoden der Organischen Chemie, E6b2, 849-1336 (1994)和出版的国际专利申请 WO-1997/42188-A1; 当 Y 是苯并噁唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8a, 1020-1194 (1993); 当 Y 是苯并噻唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8b, 865-1062 (1994); 当 Y 是苯并咪唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8c, 216-391 (1994); 当 Y 是苯并异噁唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8a, 226-348 (1993); 当 Y 是苯并异噻唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8a, 799-852 (1993); 当 Y 是吲唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8b, 764-864 (1994); 当 Y 是喹啉基时, Methoden der Organischen Chemie, E7a, 290-570 (1991); 当 Y 是异喹啉基时, Methoden der Organischen Chemie, E7a, 571-758 (1991); 当 Y 是酞嗪时, Methoden der Organischen Chemie, E9a, 744-789 (1997); 当 Y 是喹喔啉基时, Methoden der Organischen Chemie, E9b/2, 93-265 (1998); 当 Y 是喹唑啉基时, Methoden der Organischen Chemie, E9b/2, 1-192 (1998); 当 Y 是噌啉基时, Methoden der Organischen Chemie, E9a, 683-743 (1997); 和当 Y 是苯并三唑基时, Methoden der Organischen Chemie, E8d, 406-478 (1994).

<制备方法 2>



在上述反应中，R1、R2、R3、R4、R5 和 R6 的定义同上。吡唑环的碳原子可被 1-2 个相同或不同的选自取代基 α 的基团取代。

本发明的通式[36]化合物可通过将按照制备方法 1 制得的本发明化合物[35]与酸在溶剂中反应来制得。

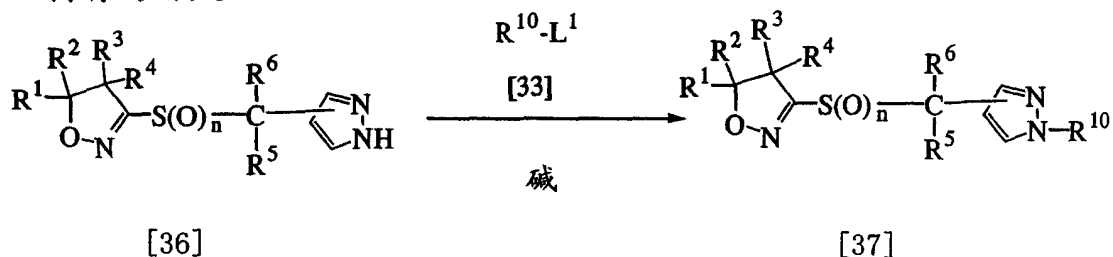
该反应一般在 0-120℃进行 10 分钟-24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的通式[35]化合物，酸的量是 1-10 当量。然而，根据反应条件，该量可适当地改变。

作为酸，可提及的有例如盐酸、氢溴酸和三氟乙酸。

作为溶剂，可提及的有例如卤代烃例如二氯乙烷、四氯化碳、氯苯、二氯苯等；酰胺例如 N,N-二甲基乙酰胺，N,N-二甲基甲酰胺，N-甲基-2-吡咯烷酮等；硫化合物例如二甲亚砜、环丁砜等；羧酸例如甲酸、乙酸等；和水。

<制备方法 3>



在上述反应中，n、L1、R1、R2、R3、R4、R5、R6 和 R10 的定义同上。吡唑环的碳原子可被 1-2 个相同或不同的选自取代基 α 的基团取代。

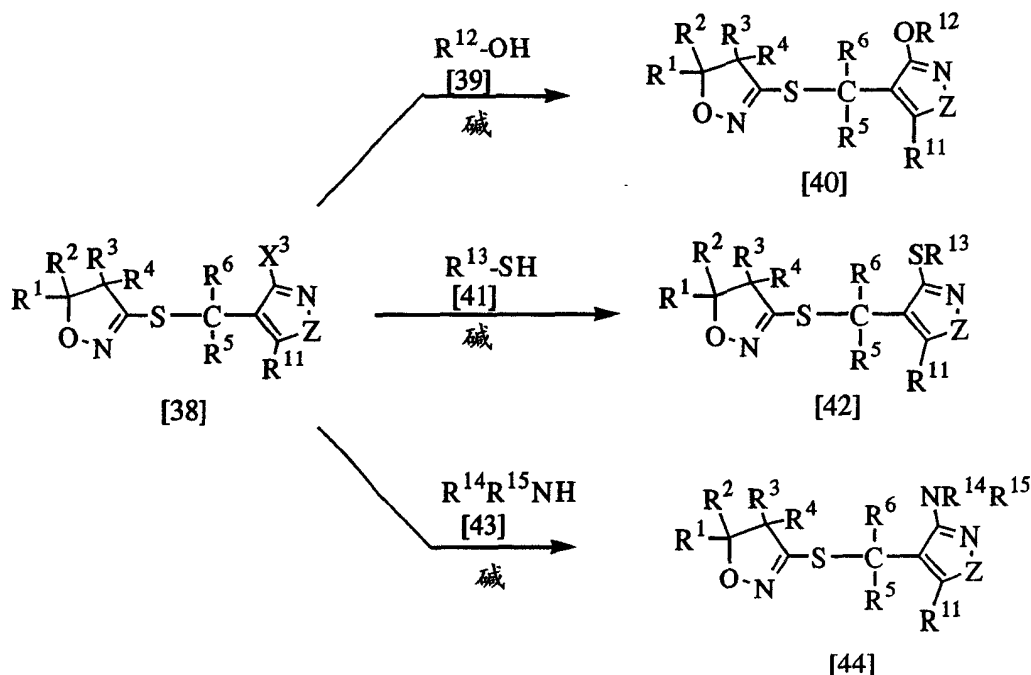
本发明的通式[37]化合物可通过将本发明化合物[36]与化合物[33]在溶剂中于碱存在下反应来制得。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的通式[36]化合物，化合物[33]的量是 1-3 当量，且碱的量是 1-3 当量。

作为溶剂,可提及的有例如醚,如二氧杂环己烷、四氢呋喃(THF)等;卤代烃例如二氯乙烷、四氯化碳、氯苯、二氯苯等;酰胺例如 N,N-二甲基乙酰胺, N,N-二甲基甲酰胺, N-甲基-2-吡咯烷酮等;硫化合物例如二甲亚砜、环丁砜等;芳烃例如苯、甲苯、二甲苯等;醇例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、叔丁醇等;酮例如丙酮、2-丁酮等;腈例如乙腈等;水;和它们的混合物。

作为碱,可提及的有例如金属氢化物如氢化钠等;碱金属氨基化物例如氨基钠、二异丙基氨基锂等;有机碱例如吡啶、三乙胺、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯等;碱金属氢氧化物例如氢氧化钠、氢氧化钾等;碱土金属氢氧化物例如氢氧化钙、氢氧化镁等;碱金属碳酸盐例如碳酸钠、碳酸钾等;碱金属碳酸氢盐例如碳酸氢钠、碳酸氢钾等;和金属醇化物例如甲醇钠、叔丁醇钾等。

<制备方法 4>



在上述反应中, R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 和 R⁶ 的定义同上; R¹¹ 是氢原子或如上所述的取代基α; X³ 是氯原子、氟原子、烷基磺酰基或任选被取代的苄基磺酰基; R¹² 是烷基、卤代烷基、环烷基、环烷基烷基、链烯基、炔基、任选被取代的苯基、任选被取代的芳族杂环

基、烷氧基羰基烷基、任选被取代的杂环烷基或任选被取代的苄基；R13 是烷基、卤代烷基、任选被取代的苯基、任选被取代的芳族杂环基、烷氧基羰基烷基或任选被取代的苄基；R14 和 R15 可相同或不同，并且分别是氢原子、烷基、任选被取代的苯基、酰基、卤代烷基羰基、任选被取代的苄基羰基、任选被取代的苯甲酰基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、任选被取代的苄基磺酰基或任选被取代的苯基磺酰基；且 Z 是氧原子、硫原子、 $N=CR_{11a}$ 、 $CR_{11a}=N$ 、 $CR_{11a}=CR_{11b}$ 或 $N-R_{16}$ (其中 R16 是氢原子或具有与 R10 相同的含义，且 R11a 和 R11b 具有与 R11 相同的含义)。

本发明的通式[40]、[42]和[44]化合物可通过分别将本发明的通式[38]化合物与化合物[39]、化合物[41]和化合物[43]在或不在溶剂存在下，如果需要的话在碱存在下反应来制得。

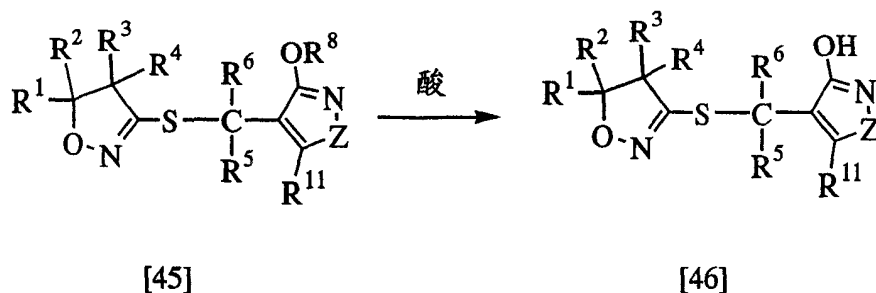
该反应一般在 20 - 200℃、优选 30 - 180℃，以及如果需要的话在压力下进行 10 分钟 - 48 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[38]，化合物[39]、化合物[41]或化合物[43]的量为 1 - 20 当量。

作为必须使用的碱，可提及的有例如碱金属氢氧化物例如氢氧化钾、氢氧化钠等；碱金属氢化物例如氢化钾、氢化钠等；碱金属醇化物例如乙醇钠、甲醇钠；和有机碱例如 1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯等。

作为溶剂，可提及的有例如卤代烃例如氯仿等；醚例如乙醚、四氢呋喃等；芳烃例如苯、甲苯等；脂族烃例如己烷、庚烷等；酮例如丙酮、甲基异丁基酮等；酯例如乙酸乙酯等；酰胺例如 N-甲基吡咯烷酮、N,N-二甲基甲酰胺等；硫化合物例如二甲亚砜、环丁砜等；乙腈；和它们的混合物。

<制备方法 5>



在上述反应中，R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁸、R¹¹和Z的定义同上。

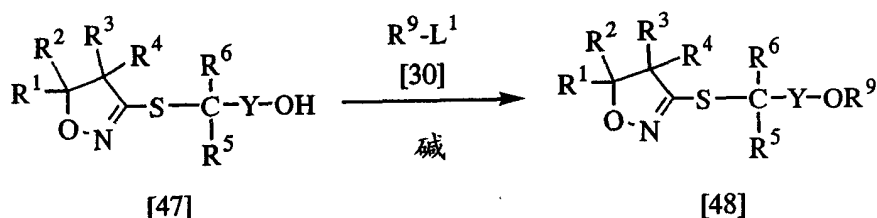
本发明的化合物[46]可通过将本发明的化合物[45]与酸在溶剂中反应来制得。

该反应一般在0-120℃进行10分钟-24小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[45]，酸的量理想地为1-10当量；然而，根据反应条件，该量可适当地改变。

作为酸和溶剂，可提及的有与在制备方法2中提及的相同的酸和溶剂。

<制备方法6>



在上述反应中，Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁹和L¹的定义同上。Y可以被1-5个相同或不同的选自取代基α的基团取代。

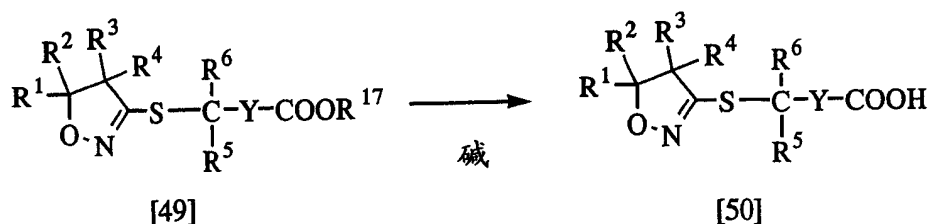
本发明的通式[48]化合物可通过将本发明化合物[47]与化合物[30]在溶剂中于碱存在下反应来制得。

该反应一般在0-150℃进行10分钟-24小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[47]，酸的量理想地为1-1.2当量；然而，根据反应条件，该量可适当地改变。

作为碱和溶剂，可提及的有与在制备方法3中提及的相同的碱和溶剂。

<制备方法7>



在上述反应中，Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 和 R⁶ 的定义同上；R¹⁷ 是烷基、任选被取代的苄基或任选被取代的苯基。Y 可以被 1-5 个相同或不同的选自取代基 α 的基团取代。

本发明的通式[50]化合物可通过将本发明化合物[49]在水或水与其它溶剂的混合溶剂中于碱存在或不存在下水解来制得。

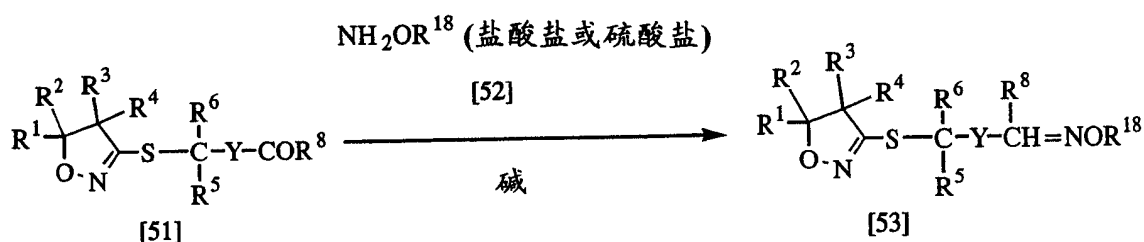
该反应一般在 0-100℃ 进行 10 分钟-24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，当使用时，每当量的化合物[49]，碱的量理想地为 1-2 当量；然而，根据反应条件，该量可适当地改变。

作为碱，可提及的有例如无机碱例如碳酸钾、氯化钠、氢氧化钠等；有机碱例如 1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯等。

作为与水混合的其它溶剂，可提及的有例如醇如甲醇、乙醇等；醚例如四氢呋喃等；酮例如丙酮、甲基异丁基酮等；酰胺例如 N,N-二甲基甲酰胺等；硫化合物例如二甲亚砜、环丁砜等；乙腈；和它们的混合物。

<制备方法 8>



在上述反应中，Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 和 R⁸ 的定义同上；且 R¹⁸ 是烷基。Y 可以被 1-5 个相同或不同的选自取代基 α 的基团取代。

本发明的通式[53]化合物可通过将本发明化合物[51]与化合物[52]在溶剂中于碱存在下反应来制得。

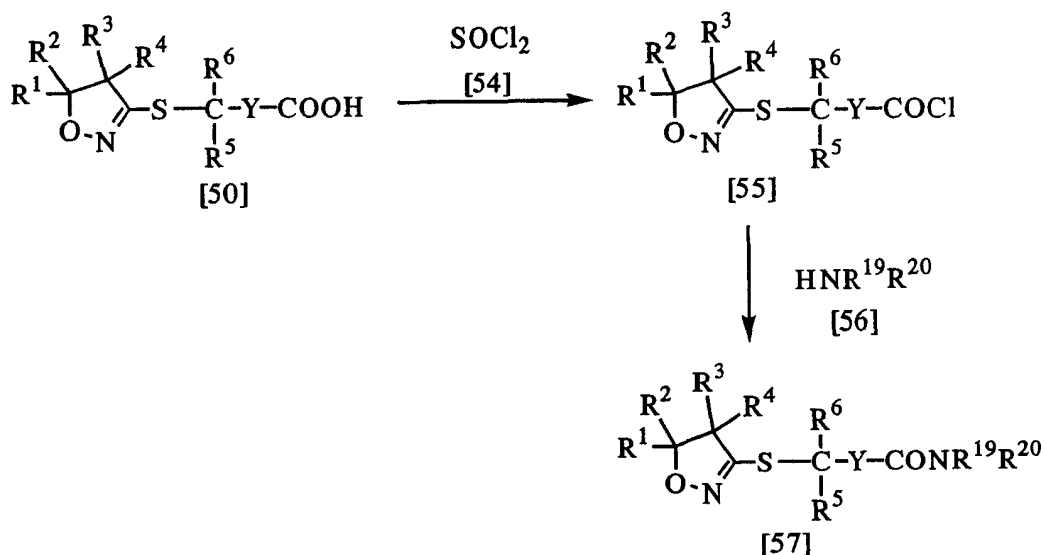
该反应一般在 0 - 100℃ 进行 10 分钟 - 24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[51]，化合物[52]的盐酸盐或硫酸盐的量理想地为 1 - 5 当量，且碱的量理想为 1 - 10 当量；然而，根据反应条件，这些量可适当地改变。

作为碱，可提及的有例如金属碳酸盐例如碳酸钾、碳酸钠等；金属乙酸盐例如乙酸钾、乙酸钠等；和有机碱例如三乙胺、二甲胺、1,8-二氮杂双环[5.4.0]-7-十一碳烯等。

作为溶剂，可提及的有例如醇如甲醇、乙醇等；醚例如四氢呋喃等；酰胺例如 N,N-二甲基甲酰胺等；水；和它们的混合物。

<制备方法 9>



在上述反应中，Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 和 R⁶ 的定义同上；且 R¹⁹ 和 R²⁰ 分别是氢原子或烷基。Y 可以被 1 - 5 个相同或不同的选自取代基α的基团取代。

本发明的通式[57]化合物可这样制得：将本发明化合物[50]与亚硫酸氯在或不在溶剂存在下反应以获得化合物[55]，然后将化合物[55]与化合物[56]在或不在溶剂存在下反应。

由化合物[50]生成化合物[55]的反应一般在 0 - 100℃ 进行 10 分钟 - 24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[50]，亚硫酸

氯[54]的量理想地为 1 - 100 当量, 但是根据反应条件, 该量可适当地改变。

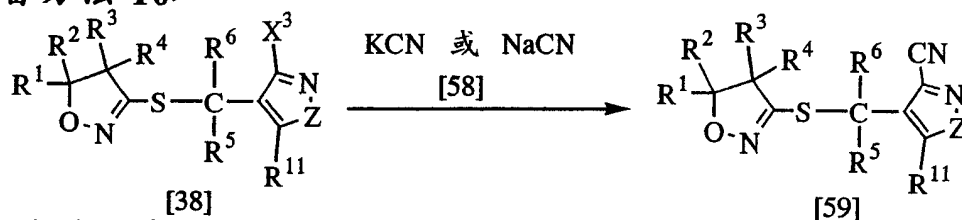
作为溶剂, 可提及的有例如卤代烃例如二氯甲烷、氯仿等; 醚例如乙醚、四氢呋喃等; 和芳烃例如苯、甲苯等。

由化合物[55]生成化合物[57]的反应一般在 0 - 100℃ 进行 10 分钟 - 24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量, 每当量的化合物[55], 化合物[56]的量理想地为 1 - 100 当量, 但是根据反应条件, 该量可适当地改变。

作为溶剂, 可提及的有例如与在由化合物[50]生成化合物[55]的反应中使用的相同溶剂。

<制备方法 10>



在上述反应中, Z、R1、R2、R3、R4、R5、R6、R11 和 X3 的定义同上。

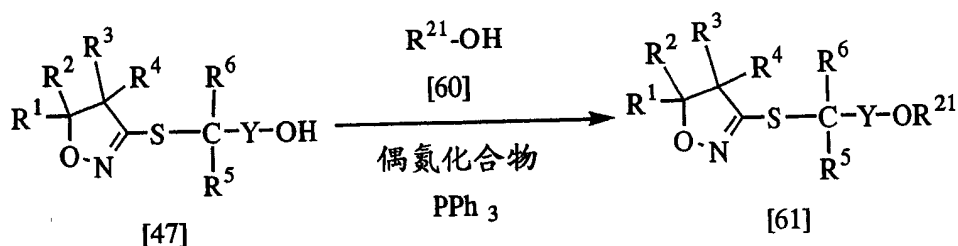
本发明的通式[59]化合物可通过将本发明化合物[38]与化合物[58]在溶剂中反应来制得。

该反应一般在 0 - 100℃ 进行 10 分钟 - 24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量, 每当量的化合物[38], 化合物[58]的量理想地为 1 - 2 当量, 但是根据反应条件, 该量可适当地改变。

作为溶剂, 可提及的有例如醚如二氧杂环己烷、四氢呋喃(THF)等; 卤代烃例如二氯乙烷、四氯化碳、氯苯、二氯苯等; 酰胺例如 N,N-二甲基乙酰胺, N,N-二甲基甲酰胺, N-甲基-2-吡咯烷酮等; 硫化合物例如二甲亚砜、环丁砜等; 酮例如丙酮、2-丁酮等; 腈例如乙腈等; 水; 和它们的混合物。

<制备方法 11>



在上述反应中，Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶的定义同上；且R²¹是烷基、卤代烷基、环烷基、环烷基烷基、链烯基、炔基、烷氧基羰基烷基、任选被取代的杂烷基或任选被取代的苄基。Y可以被1-5个相同或不同的选自取代基α的基团取代。

本发明的通式[61]化合物可通过按照已知方法[Synthesis, 1-28 (1981)]，将本发明化合物[47]与化合物[60]在偶氮化合物和三苯基膦存在下，在溶剂中反应来制得。

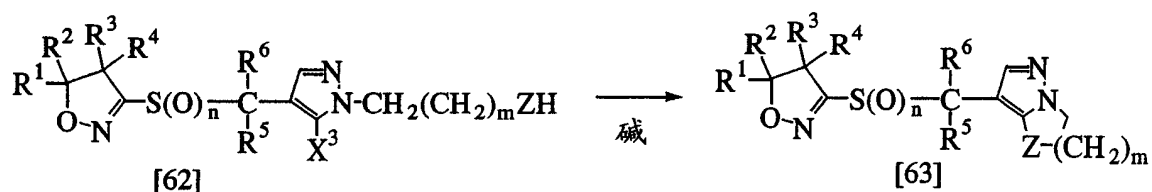
该反应一般在0-100℃进行10分钟-24小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的化合物[47]，化合物[60]、偶氮化合物和三苯基膦的量理想地为1-1.5当量，但是根据反应条件，这些量可适当地改变。

作为溶剂，可提及的有例如醚如二氧杂环己烷、四氢呋喃(THF)等；卤代烃例如二氯乙烷、四氯化碳、氯苯、二氯苯等；酰胺例如N,N-二甲基乙酰胺，N,N-二甲基甲酰胺，N-甲基-2-吡咯烷酮等；硫化合物例如二甲亚砷、环丁砷等；芳烃例如苯、甲苯、二甲苯等；乙腈；和它们的混合物。

作为偶氮化合物，可提及的有例如偶氮二甲酸二乙酯和偶氮二甲酸二异丙酯。

<制备方法 12>



在上述反应中，X³、n、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和Z的定义同上；且m是1-4的整数。吡唑环的3-位碳原子可被选自取代基α的基团取代。

本发明的通式[63]化合物可通过将本发明化合物[62]在碱存在下在溶剂中反应来制得。

该反应一般在 0 - 120℃ 进行 10 分钟 - 24 小时。

至于在反应中使用的反应物的量，每当量的通式[62]化合物，碱的量理想地为 1 - 3 当量，但是根据反应条件，该量可适当地改变。

作为碱和溶剂，可提及的有与在制备方法 3 中提及的相同的碱和溶剂。

顺便提一下，可通过按照在制备方法 1 中描述的氧化将在制备方法 2 或制备方法 4 - 11 中提及的硫化物化合物转化成亚砷化合物或砷化合物。此外，可按照在制备方法 1 中描述的方法，通过向硫化物化合物中加入等摩尔至过量的氧化剂，将其中取代基 Y 被 C1 - C10 烷硫基、被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1 - C10 烷硫基或 C1 - C4 卤代烷硫基取代的在制备方法 2 或制备方法 4 - 11 中提及的硫化物化合物转化成亚砷化合物或砷化合物；同时将取代基 Y (C1 - C10 烷硫基、被选自取代基 γ 的基团单取代的 C1 - C10 烷硫基或 C1 - C4 卤代烷硫基)氧化，并将这些取代基转化成亚砷基团或砷基团。

下面通过实施例对本发明化合物的制备方法、本发明除草剂的制备方法和本发明除草剂的应用作具体说明。还描述了本发明各种中间体的制备方法。

<实施例 1>

制备 3-(5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0001)

将 2.1 g 氢硫化钠水合物(纯度: 70%, 26.2 mmol)加到 2.3 g (13.1 mmol) 5,5-二甲基-3-甲基磺酰基-2-异噁唑啉溶解在 20 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 2 小时。向其中加入 1.8 g (13.1 mmol)无水碳酸钾、2.0 g (13.1 mmol)雕白粉和 3.6 g (10.5 mmol) 4-溴甲基-5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑。将所得混合物在室温搅拌 15 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁

干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 2.7 g (产率: 65.5%) 3-(5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为白色晶体(熔点: 89 - 90°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.55-7.50 (5H,m), 4.33 (2H,s), 2.83 (2H,s),

1.45 (6H,s)

<实施例 2>

制备 3-(5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0002)

在冰冷却下, 将 0.63 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 2.6 mmol)加到 0.4 g (1.0 mmol) 3-(5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 15 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 22 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用己烷洗涤所得晶体, 获得了 0.4 g (产率: 83.2%) 3-(5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为白色晶体(熔点: 132 - 133°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.60-7.51 (5H,m), 4.37 (2H,s), 3.14 (2H,s) 1.53 (6H,s)

<实施例 3>

制备 3-(5-氯-1-甲基-3-苯基-1H-吡唑-4-基甲基亚磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0003)

在冰冷却下将 0.87 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 3.54 mmol)加到 0.85 g (2.53 mmol) 3-(5-氯-1-甲基-3-苯基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 30 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 1 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶

液和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂：己烷-乙酸乙酯混合溶剂)，获得了 0.48 g (产率：53.9%) 3-(5-氯-1-甲基-3-苯基-1H-吡唑-4-基甲基亚磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉，为透明的粘稠物质。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.63-7.60 (2H,m), 7.48-7.37 (3H,m), 4.29 (2H,q), 3.91 (3H,s), 3.12 (1H,d), 2.79 (1H,d), 1.41 (3H,s), 1.35 (3H,s)

<实施例 4>

制备 5,5-二甲基-3-(5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0021)

将 9.3 g 氢硫化钠水合物(纯度：70%，116.3 mmol)加到 18.7 g (105.7 mmol) 5,5-二甲基-3-甲基磺酰基-2-异噁唑啉(本发明化合物 2-1)溶解在 300 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 2 小时。将该反应系统冰冷却。向其中加入 30.3 g (93.8 mmol) 4-溴甲基-5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑溶解在 200 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在 0℃ 搅拌 30 分钟以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂：己烷-乙酸乙酯混合溶剂)，获得了 13.11 g (产率：37.4%) 5,5-二甲基-3-(5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉，为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.65-7.39 (5H,m), 4.24 (2H,s), 2.81 (2H,s),
1.43 (6H,s)

<实施例 5>

制备 5,5-二甲基-3-(5-乙硫基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0022)

将 0.2 g (4.0 mmol)氢氧化钠和 1 ml 水加到 0.25 g (4.0 mmol)乙硫

醇溶解在 10 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 30 分钟。向其中加入 0.5 g (1.4 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉溶解在 5 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将所得混合物搅拌 1 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 0.6 g (产率: 100%) 5,5-二甲基-3-(5-乙硫基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.62-7.47 (5H,m), 4.44 (2H,s), 2.83 (2H,s),

2.50 (2H,q), 1.45 (6H,s), 1.02 (3H,t)

<实施例 6>

制备 5,5-二甲基-3-(5-乙基磺酰基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺酰基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0004)

在冰冷却下, 将 1.7 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 6.7 mmol)加到 0.6 g (1.3 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-乙硫基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉溶解在 10 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 16 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用己烷洗涤所得晶体, 获得了 0.6 g (产率: 93.0%) 5,5-二甲基-3-(5-乙基磺酰基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺酰基)-2-异噁唑啉, 为浅黄色晶体(熔点: 158 - 160°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.58-7.54 (5H,m), 5.16 (2H,s), 3.18 (2H,s),

3.15 (2H,q), 1.55 (6H,s), 1.24 (3H,t)

<实施例 7>

制备 5,5-二甲基-3-(5-二甲基氨基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0023)

将 0.8 g (6.7 mmol) a 40 % 二甲胺水溶液加到 0.5 g (1.3 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺基)-2-异噁唑啉溶解在 10 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在密封的管中于 100°C 搅拌 9 小时。向其中加入 3.0 g (26.6 mmol) 40 % 二甲胺水溶液, 将所得混合物搅拌 9 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸钠干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.4 g (产率: 80.6 %) 5,5-二甲基-3-(5-二甲基氨基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺基)-2-异噁唑啉。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.58-7.38 (5H,m), 4.35 (2H,s), 2.82 (2H,s),

2.77 (6H,s), 1.45 (6H,s)

<实施例 8>

制备 5,5-二甲基-3-(5-二甲基氨基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0005)

在冰冷却下, 将 0.7 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70 %, 2.7 mmol)加到 0.4 g (1.1 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-二甲基氨基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺基)-2-异噁唑啉溶解在 10 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 20 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用己烷洗涤所得晶体, 获得了 0.2 g (产率: 52.0 %) 5,5-二甲基-3-(5-二甲基氨基-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺基)-2-异噁唑啉, 为白色粉末(熔点: 150 to 151°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.61-7.38 (5H,m), 4.75 (2H,s), 3.13 (2H,s),

2.76 (6H,s), 1.53 (6H,s)

<实施例 9>

制备 3-(1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0006)

将 21.8 g 氢硫化钠(纯度: 70%, 272.5 mmol)加到 24.1 g (136.0 mmol) 5,5-二甲基-3-甲基磺酰基-2-异噁唑啉溶解在 200 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时。向其中加入 18.8 g (136.2 mmol)无水碳酸钾和 21.0 g (136.2 mmol)雕白粉。将所得混合物搅拌 2 小时。在冰冷却下向其中加入 40 g (125 mmol) 4-溴甲基-1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑。将所得混合物在室温搅拌 2 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 23.0 g (产率: 57.1%) 3-(1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为浅粉红色晶体(熔点: 79.0 - 81.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.24 (2H,s), 2.80 (2H,s), 1.71 (9H,s), 1.43 (6H,s)

<实施例 10>

制备 3-(5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0007)

将 19.8 g (53.4 mmol) 3-(1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉加到 170 ml 25% 溴化氢-乙酸溶液中。将该混合物在 40 - 50°C 搅拌 2 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 12.0 g (产率: 60.6%) 3-(5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为浅黄色晶体(熔点: 120.0 - 122.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.26 (2H,s), 2.81 (2H,s), 1.44 (6H,s)

<实施例 11>

制备 3-(5-氯-1-二氟甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0008)和 3-(3-氯-1-二氟甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0009)

将 3.1 g (22.5 mmol)无水碳酸钾加到 2.3 g (7.3 mmol) 3-(5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 50 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。向其中吹入氯二氟甲烷。将所得混合物在 130 - 140°C 搅拌 3 小时以引起反应。确认反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤,然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.69 g (产率: 25.8%) 3-(5-氯-1-二氟甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为浅黄色晶体(熔点: 41.0 to 42.0°C) and 0.54 g (产率: 20.2%) 3-(3-氯-1-二氟甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为白色粉末(熔点: 89.0 to 90.0°C)。

3-(5-氯-1-二氟甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.22 (1H,t), 4.25 (2H,s), 2.80 (2H,s), 0.44 (6H,s)

3-(3-氯-1-二氟甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.19 (1H,t), 4.28 (2H,s), 2.80 (2H,s), 1.44 (6H,s)

<实施例 12>

制备 3-(5-氯-1-二氟甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0010)

在冰冷却下, 将 1.4 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 8.1 mmol)加到 0.69 g (1.9 mmol) 3-(5-氯-1-二氟甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤所得固体, 获得了 0.4 g (产率: 53.3%) 3-(5-氯-1-二氟甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为白色粉末(熔点: 126.0 to 127.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.26 (1H,t), 4.68 (2H,s), 3.11 (2H,s), 1.53 (6H,s)

<实施例 13>

制备 3-(3-氯-1-二氟甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0011)

在冰冷却下, 将 1.1 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 6.4 mmol)加到 0.54 g (1.5 mmol) 3-(3-氯-1-二氟甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤所得固体, 获得了 0.47 g (产率: 79.7%) 3-(3-氯-1-二氟甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为白色粉末(熔点: 136.0 to 137.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.23 (1H,t), 4.71 (2H,s), 3.11 (2H,s), 1.53 (6H,s)

<实施例 14>

制备 5,5-二甲基-3-(3-甲氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲

甲基)-2-异噻唑啉(本发明化合物 3-0024)

将 3.1 g 氢硫化钠水合物(纯度: 70%, 22.0 mmol)加到 3.3 g (17.3 mmol) 5,5-二甲基-3-乙基磺酰基-2-异噻唑啉溶解在 10 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 2 小时。向其中加入 3.1 g (22.0 mmol)无水碳酸钾、2.7 g (17.5 mmol)雕白粉和 4.0 g (17.5 mmol) 4-氯甲基-3-甲氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑。将所得混合物在室温搅拌 2 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 2.8 g (产率: 52.0%) 5,5-二甲基-3-(3-甲氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噻唑啉。

<实施例 15>

制备 5,5-二甲基-3-(3-羟基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噻唑啉(本发明化合物 3-0025)

向 20 ml 25% 溴化氢乙酸溶液中加入 3.3 g (10.6 mmol) 5,5-二甲基-3-(3-甲氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噻唑啉。将该混合物在 50℃ 搅拌 3 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。将该残余物倒入水中。通过过滤收集所得晶体, 用水洗涤并干燥, 获得了 3.1 g (产率: 96.0%) 所要的 5,5-二甲基-3-(3-羟基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噻唑啉。

<实施例 16>

制备 5,5-二甲基-3-(3-乙氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噻唑啉(本发明化合物 3-0026)

将 0.20 g (1.3 mmol)无水碳酸钾和 0.20 g (1.5 mmol)乙基碘加到 0.30 g (1.0 mmol) 5,5-二甲基-3-(3-羟基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噻唑啉溶解在 10 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在 50℃ 搅拌 3 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合

物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 0.30 g (产率: 92.0%) 所要的 5,5-二甲基-3-(3-乙氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉。

<实施例 17>

制备 5,5-二甲基-3-(3-乙氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0012)

在冰冷却下，将 0.68 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 2.76 mmol)加到 0.30 g (0.92 mmol) 5,5-二甲基-3-(3-乙氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉溶解在 10 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 5 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用己烷洗涤所得晶体，获得了 0.24 g (产率: 73.0%) 5,5-二甲基-3-(3-乙氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉，为白色晶体(熔点: 124 - 125°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.50 (2H,s), 4.27 (2H,q), 3.86 (3H,s), 3.04 (2H,s),

1.49 (6H,s), 1.39 (3H,t)

<实施例 18>

制备 5,5-二甲基-3-(5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0027)

将 19.3 g 氢硫化钠(纯度: 70%, 344.6 mmol)加到 21.3 g (120.3 mmol) 5,5-二甲基-3-甲基磺酰基-2-异噁唑啉溶解在 200 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时。向其中加入 16.7 g (121.0 mmol)无水碳酸钾和 18.6 g (120.7 mmol)雕白粉。将所得混合物搅拌 2 小时。在冰冷却下向其中加入 31.4 g (120.3 mmol) 4-溴甲基-5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑。将所得混合物在室温搅拌 2 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙

酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 29.0 g (产率: 90.3%) 5,5-二甲基-3-(5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉，为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.24 (2H,s), 3.90 (3H,s), 2.78 (2H,s), 1.42 (6H,s)

<实施例 19>

制备 5,5-二甲基-3-(5-甲氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0028)

将 0.77 g (4.0 mmol) 甲醇钠(28% 甲醇溶液)加到 0.5 g (1.6 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉溶解在 20 ml 甲醇内的溶液中。将该混合物在回流状态下搅拌 4 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 0.5 g (产率: 96.7%) 5,5-二甲基-3-(5-甲氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉，为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.26 (2H,s), 4.07 (3H,s), 3.72 (3H,s), 2.80 (2H,s),

1.43 (6H,s)

<实施例 20>

制备 5,5-二甲基-3-(5-甲氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲磺酰基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0013)

在冰冷却下，将 1.3 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 7.5 mmol)加到 0.5 g (1.5 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-甲氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时，然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无

水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤所得固体,获得了 0.31 g (产率: 58.2%) 5,5-二甲基-3-(5-甲氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉, 为白色粉末(熔点: 113.0 – 114.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.60 (2H,s), 4.11 (3H,s), 3.79 (3H,s), 3.10 (2H,s),

1.51(6H,s)

<实施例 21>

制备 3-(5-(2-氯苯氧基)-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0029)

在冰冷却下,将 0.2 g (8.3 mmol)氯化钠(纯度: 60%)加到 0.44 g (3.4 mmol) 2-氯苯酚溶解在 30 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时。向其中加入 0.7 g (2.2 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺基)-2-异噁唑啉。将所得混合物在 120 – 130°C 搅拌 5 小时以引起反应。确认反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤,然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂),获得了 0.63 g (产率: 66.7%) 3-(5-(2-氯苯氧基)-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为黄色油状物。

<实施例 22>

制备 3-(5-(2-氯苯氧基)-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0014)

在冰冷却下,将 1.0 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 5.8 mmol)加到 0.63 g (1.5 mmol) 3-(5-(2-氯苯氧基)-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时,然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤,然

后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤所得固体,获得了 0.31 g (产率: 45.7%) 3-(5-(2-氯苯氧基)-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为白色粉末(熔点: 67.0 - 70.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.50-6.91 (4H,m), 4.45 (2H,s), 3.71 (3H,s),

3.03 (2H,s), 1.47 (6H,s)

<实施例 23>

制备 3-(5-环戊氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0030)

向 0.43 g (1.6 mmol)三苯基膦溶解在 10 ml 苯内的溶液中加入 0.14 g (1.6 mmol)环戊醇、0.5 g (1.6 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-羟基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉和 0.7 g (1.6 mmol)偶氮二甲酸二乙酯(40% 甲苯溶液)。将该混合物在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤,然后用无水硫酸镁干燥。将所得有机层真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂),获得了 0.52 g (产率: 85.2%) 3-(5-环戊氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为无色透明油状物。

<实施例 24>

制备 3-(5-环戊氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0015)

在冰冷却下,将 0.85 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 4.9 mmol)加到 0.52 g (1.4 mmol) 3-(5-(环戊氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时,然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤,然后用

无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤所得固体,获得了 0.2 g (产率: 35.5%) 3-(5-环戊氧基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为白色粉末(熔点: 113.0 - 114.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

5.03 (1H,br), 4.60 (2H,s), 3.73 (3H,s), 3.05 (2H,s),

1.88-1.70 (8H,m), 1.50 (6H,s)

<实施例 25>

制备 3-(5-氟基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0031)

将 0.2 g (4.0 mmol)氟化钠加到 0.5 g (1.6 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-氟基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉溶解在 30 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在 40°C 搅拌 1 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 0.9 g 3-(5-氟基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉粗产物, 为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.30 (2H,s), 4.08 (3H,s), 2.81 (2H,s), 1.43 (6H,s)

<实施例 26>

制备 3-(5-氟基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0016)

在冰冷却下, 将 2.1 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 12.2 mmol)加到 0.9 g 3-(5-氟基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(粗制的化合物)溶解在 50 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用

无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤所得固体,获得了 0.43 g (产率: 76.4%) 3-(5-氟基-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉,为白色粉末(熔点: 105.0 – 108.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.73 (2H,s), 4.16 (3H,s), 3.14 (2H,s), 1.53 (6H,s)

<实施例 27>

制备 3-(3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-基甲基磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0032)

将 0.6 g 氢硫化钠(纯度: 70%, 10.7 mmol)加到 0.7 g (3.7 mmol) 5,5-二甲基-3-乙基磺酰基-2-异噁唑啉溶解在 30 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时。向其中加入 0.51 g (3.7 mmol) 无水碳酸钾和 0.56 g (3.6 mmol) 雕白粉。将所得混合物搅拌 2 小时。在冰冷却下向其中加入 0.9 g (3.5 mmol) 4-溴甲基-3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑。将所得混合物在室温搅拌 2 小时以引起反应。确认反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤,然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂),获得了 0.8 g (产率: 70.8%) 3-(3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-基甲基磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉,为无色透明油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.14 (2H,s), 4.14 (2H, q), 2.81 (2H,s), 1.43 (6H,s),

1.42 (3H,t)

<实施例 28>

制备 3-(3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0017)

在冰冷却下,将 2.0 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 11.6 mmol)加到 0.8 g (2.6 mmol) 3-(3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-基甲基磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时,

然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤,然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤所得固体,获得了 0.41 g (产率: 46.6%) 3-(3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉,为白色粉末(熔点: 105.0 - 107.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.48 (2H,s), 4.19 (2H,q), 3.05 (2H,s), 1.51 (6H,s),

1.45 (3H,t)

<实施例 29>

制备 3-(5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0020)

将 1.2 g 氢硫化钠水合物(纯度: 70%, 15.0 mmol)加到 1.9 g (10.0 mmol) 5,5-二甲基-3-乙基磺酰基-2-异噁唑啉溶解在 30 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 2 小时。向其中加入 2.1 g (15.0 mmol)无水碳酸钾、2.3 g (15.0 mmol)雕白粉和 2.6 g (10.0 mmol) 4-溴甲基-5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑。将所得混合物在室温搅拌 15 小时以引起反应。反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用无水氯化钠溶液洗涤,然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂),获得了 2.1 g (产率: 68.0%) 3-(5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉,为无色粘稠液体($n_{D20} = 1.5183$)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

6.70 (1H,t, J=54.2 Hz), 4.24 (2H,s), 3.86 (3H,s),

2.80 (2H,s), 1.42 (6H,s)

<实施例 30>

制备 3-(5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二

甲基-2-异噁唑啉(本发明化合物 3-0018)

在冰冷却下, 将 3.6 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 14.5 mmol)加到 1.8 g (5.8 mmol) 3-(5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 15 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 22 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用己烷洗涤所得晶体, 获得了 1.7 g (产率: 85.9%) 3-(5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-基甲基磺酰基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉, 为白色晶体(熔点: 78-79°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

6.80 (1H,t, J=54.8 Hz), 4.60 (2H,s), 3.91 (3H,s),

3.08 (2H,s), 1.51 (6H,s)

<实施例 31>

制备 5,5-二甲基-3-(5-甲基-3-三氟甲基异噁唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 4-0003)

将 0.4 g 氢硫化钠水合物(纯度: 70%, 4.6 mmol)加到 0.4 g (2.3 mmol) 5,5-二甲基-3-甲基磺酰基-2-异噁唑啉溶解在 10 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 2 小时。向其中加入 0.3 g (2.3 mmol)碳酸钾、0.4 g (2.3 mmol)雕白粉和 0.5 g (1.8 mmol) 4-溴甲基-5-甲基-3-三氟甲基异噁唑。将所得混合物在室温搅拌 14 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.4 g (产率: 70.0%) 5,5-二甲基-3-(5-甲基-3-三氟甲基异噁唑-4-基甲硫基)-2-异噁唑啉。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.11 (2H,s), 2.77 (2H,s), 2.54 (3H,s), 1.42 (6H,s)

<实施例 32>

制备 5,5-二甲基-3-(5-甲基-3-三氟甲基异噻唑-4-基甲基磺酰基)-2-异噻唑啉(本发明化合物 4-0001)

在冰冷却下, 将 0.8 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 3.2 mmol)加到 0.4 g (1.3 mmol) 5,5-二甲基-3-(5-甲基-3-三氟甲基异噻唑-4-基甲基磺基)-2-异噻唑啉溶解在 10 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 4 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用己烷洗涤所得晶体, 获得了 0.4 g (产率: 95.0%) 5,5-二甲基-3-(5-甲基-3-三氟甲基异噻唑-4-基甲基磺酰基)-2-异噻唑啉, 为白色晶体(熔点: 135 - 136°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.54 (2H,s), 3.11 (2H,s), 2.61 (3H,s), 1.52 (6H,s)

<实施例 33>

制备[(5-氯-3-甲基-异噻唑-4-基)-甲磺基]-5,5-二甲基-2-异噻唑啉(本发明化合物 4-0004)

在室温将 0.82 g 氢硫化钠(纯度: 70%, 10.00 mmol)加到 0.89 g (5.00 mmol) 5,5-二甲基-3-甲基磺酰基-2-异噻唑啉溶解在 10 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 2 小时。向其中加入 0.70 g (5.00 mmol)无水碳酸钾、0.78 g (5.00 mmol)雕白粉和 0.91 g (5.00 mmol) 5-氯-4-氯甲基-3-甲基异噻唑。将所得混合物在室温搅拌过夜以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物, 获得了 1.38 g (产率: 定量) [(5-氯-3-甲基-异噻唑-4-基)-甲磺基]-5,5-二甲基-2-异噻唑啉。

<实施例 34>

制备[(5-氯-3-甲基-异噻唑-4-基)-甲基磺酰基]-5,5-二甲基-2-异噻唑啉(本发明化合物 4-0002)

在冰冷却下, 将 2.96 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 12.00 mmol)加到 1.38 g (5.00 mmol) [(5-氯-3-甲基-异噻唑-4-基)-甲硫基]-5,5-二甲基-2-异噻唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌过夜以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱纯化残余物, 获得了 0.65 g (产率: 47.0%) [(5-氯-3-甲基-异噻唑-4-基)-甲基磺酰基]-5,5-二甲基-2-异噻唑啉, 为浅黄色粉末(熔点: 113 - 114°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.89 (1H,s), 4.67 (2H,s), 3.05 (2H,s), 2.59 (3H,s),
1.51 (6H,s)

<实施例 35>

制备 5,5-二甲基-3-[2,5-二甲基-4-(1-甲氧基亚氨基乙基)-噻吩-3-基甲硫基]-2-异噻唑啉(本发明化合物 2-0002)

将 0.57 g (6.8 mmol) O-甲基羟基胺盐酸盐和 0.56 g (6.8 mmol) 乙酸钠加到 1.0 g (3.4 mmol) 3-(4-乙酰基-2,5-二甲基噻吩-3-基甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噻唑啉溶解在 50 ml 乙醇内的溶液中。将该混合物在回流状态下搅拌 5 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.4 g (36.4%) 5,5-二甲基-3-[2,5-二甲基-4-(1-甲氧基亚氨基乙基)-噻吩-3-基甲硫基]-2-异噻唑啉, 为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.21 (2H,s), 3.95 (3H,s), 2.76 (2H,s), 2.38 (3H,s),
2.34 (3H,s), 2.13 (3H,s), 1.42 (6H,s)

<实施例 36>

制备 5,5-二甲基-3-[2,5-二甲基-4-(1-甲氧基亚氨基乙基)-噻吩-3-基

甲基磺酰基]-2-异噁唑啉(本发明化合物 2-0001)

在冰冷却下, 将 0.61 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 3.5 mmol)加到 0.4 g (1.2 mmol) 5,5-二甲基-3-[2,5-二甲基-4-(1-甲氧基亚氨基乙基)-噻吩-3-基甲硫基]-2-异噁唑啉溶解在 30 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.35 g (80%) 5,5-二甲基-3-[2,5-二甲基-4-(1-甲氧基亚氨基乙基)-噻吩-3-基甲基磺酰基]-2-异噁唑啉, 为白色晶体(熔点: 95.0 - 96.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.79 (2H,s), 3.95 (3H,s), 2.93 (2H,s), 2.42 (3H,s),

2.37 (3H,s), 2.17 (3H,s), 1.47 (6H,s)

<实施例 37>

制备 5,5-二甲基-3-(4-三氟甲基-吡啶-3-基甲硫基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 7-0003)

将 0.26 g 氢硫化钠(纯度: 70%, 4.6 mmol)加到 0.3 g (1.6 mmol) 5,5-二甲基-3-乙基磺酰基-2-异噁唑啉溶解在 20 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时。向其中加入 0.22 g (1.6 mmol) 无水碳酸钾和 0.25 g (1.6 mmol) 雕白粉。将所得混合物搅拌 2 小时。在冰冷却下向其中加入 0.3 g (1.3 mmol) 3-溴甲基-4-三氟甲基-吡啶。将所得混合物在室温搅拌 2 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.45 g (产率: 98.9%) 5,5-二甲基-3-(4-三氟甲基-吡啶-3-基甲硫基)-2-异噁唑啉, 为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.98 (1H,s), 8.70 (1H,d), 7.51 (1H,d), 4.47 (2H,s),
2.79 (2H,s), 1.43 (6H,s)

<实施例 38>

制备 5,5-二甲基-3-(4-三氟甲基-吡啶-3-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 7-0001)和 5,5-二甲基-3-(4-三氟甲基-吡啶-N-氧化物-3-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉(本发明化合物 7-0002)

在冰冷却下, 将 0.77 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 4.5 mmol)加到 0.45 g (1.6 mmol) 5,5-二甲基-3-(4-三氟甲基-吡啶-3-基甲基磺基)-2-异噁唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.06 g (产率: 12.0%) 5,5-二甲基-3-(4-三氟甲基-吡啶-3-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉, 为浅黄色晶体(熔点: 77.0 - 80.0°C)和 0.12 g (产率: 23.1%) 5,5-二甲基-3-(4-三氟甲基-吡啶-N-氧化物-3-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉, 为白色晶体(熔点: 114.0 - 116.0°C)。

5,5-二甲基-3-(4-三氟甲基-吡啶-3-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.98 (1H,s), 8.84 (1H,d), 7.64 (1H,d), 4.92 (2H,s),
3.09 (2H,s), 1.52 (6H,s)

5,5-二甲基-3-(4-三氟甲基-吡啶-N-氧化物-3-基甲基磺酰基)-2-异噁唑啉

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.50 (1H,s), 8.25 (1H,d), 7.59 (1H,d), 4.81 (2H,s),
3.12 (2H,s), 1.53 (6H,s)

<实施例 39>

制备 5,5-二甲基-[(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲磺基]-2-异噁

唑啉(本发明化合物 8-0002)

在室温将 0.32 g 氢硫化钠(纯度: 70%, 4.00 mmol)加到 0.35 g (2.00 mmol) 5,5-二甲基-3-甲基磺酰基-2-异噻唑啉溶解在 10 ml 二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 2 小时。向该反应混合物中加入 0.28 g (2.00 mmol) 无水碳酸钾、0.31 g (2.00 mmol) 雕白粉和 0.45 g (2.00 mmol) 5-氯甲基-4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶。将所得混合物在室温搅拌 2 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物, 获得了 0.55 g (产率: 85.9%) 5,5-二甲基-[(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲基磺基]-2-异噻唑啉。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.81 (1H,s), 4.44 (2H,d), 4.12 (3H,s), 2.81 (2H,s),

1.45 (6H,s)

<实施例 40>

制备 5,5-二甲基-[(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲基磺酰基]-2-异噻唑啉(本发明化合物 8-0001)

在冰冷却下, 将 1.05 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 4.28 mmol)加到 0.55 g (1.71 mmol) 5,5-二甲基-[(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲基磺基]-2-异噻唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 4 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物, 获得了 0.45 g (产率: 75.0%) 5,5-二甲基-[(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲基磺酰基]-2-异噻唑啉, 为白色羽毛状晶体(熔点: 175 - 176°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.89 (1H,s), 5.00 (2H,d), 4.11 (3H,s), 3.11 (2H,s),

1.53 (6H,s)**<实施例 41>**

制备 3-(5,5-二甲基-2-异噁唑啉-3-基硫基甲基)-2-三氟甲基-6,7-二氢-5H-吡唑并[5,1-b][1,3]噁嗪(本发明化合物 3-0033)

将 0.82 g (2.3 mmol) 3-[5-氯-1-(3-羟基丙基)-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基甲硫基]-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 5 ml N,N-二甲基甲酰胺中的溶液滴加到 0.11 g (2.8 mmol) 氯化钠在 15 ml N,N-二甲基甲酰胺内的悬浮液中。滴加完成后, 将所得混合物在室温搅拌 30 分钟, 然后加热至 100°C, 并搅拌 1 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用柠檬酸水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏, 获得了 0.77 g (产率: 100%) 3-(5,5-二甲基-2-异噁唑啉-3-基硫基甲基)-2-三氟甲基-6,7-二氢-5H-吡唑并[5,1-b][1,3]噁嗪。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.37 (2H,t), 4.19 (2H,t), 4.15 (2H,s), 2.80 (2H,s),

2.31 (2H,m), 1.42 (6H,s)

<实施例 42>

制备 3-(5,5-二甲基-2-异噁唑啉-3-基磺酰基甲基)-2-三氟甲基-6,7-二氢-5H-吡唑并[5,1-b][1,3]噁嗪(本发明化合物 3-0019)

在冰冷却下, 将 1.25 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 5.1 mmol)加到 0.77 g (2.3 mmol) 3-(6,7-二氢-3-三氟甲基-5H-吡唑并[5,1-b][1,3]噁嗪-4-基-甲硫基)-5,5-二甲基-2-异噁唑啉溶解在 20 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物, 获得了 0.36 g (产率: 43%) 3-(5,5-二甲基-2-异噁唑啉-3-基磺酰基甲基)-2-三氟甲基-6,7-二氢-5H-吡唑并[5,1-b][1,3]噁嗪, 为白色粉末(熔点: 151.0 – 152.0°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.47 (2H,s), 4.40 (2H,t), 4.23 (2H,t), 3.09 (2H,s),

2.34 (2H,m), 1.50 (6H,s)

表 11 - 20 中所示的化合物序号指的是在实施例中。

表 11

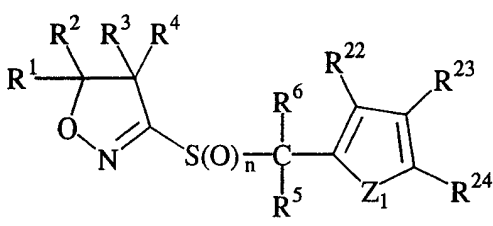
												
化合物序号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ₁	R ²²	R ²³	R ²⁴	熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
1-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	H	H	66-68
1-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Me	H	87-88
1-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Me	95-97
1-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	H	H	70-72
1-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Cl	118-119
1-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	H	不能测定
1-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	C(=O)OMe	124-125

表 12

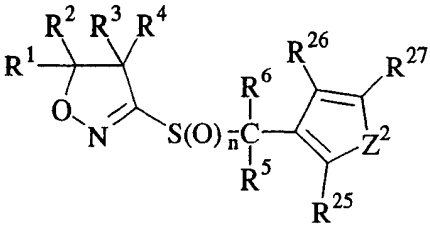
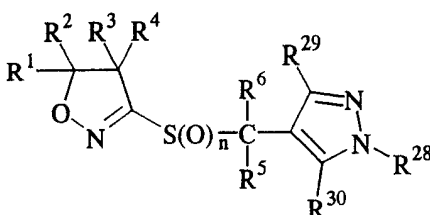
												
化合物 序号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ²	R ²⁵	R ²⁶	R ²⁷	熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
2-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me	95-96
2-0002	Me	Me	H	H	0	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me	
2-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	H	99-101
2-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	Ome	H	96-97
2-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	H	Cl	125-127
2-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	Cl	Cl	158-160
2-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	Me	Me	117-117
2-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Me	Me	146-148
2-0009	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Ph	C(=O)Me	Me	1.5730
2-0010	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Ph	C(=NOMe)Me	Me	129-131
2-0011	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)Ome	Cl	157-158
2-0012	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Cl	C(=O)NHMe	Cl	178-180
2-0013	Me	Me	H	H	2	H	H	O	H	H	H	58-61
2-0014	Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	H	Cl	180-181

表 13

											
化合物 序号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ²⁹	R ²⁸	R ³⁰	熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
3-0001	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	Cl	89-90
3-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	Cl	132-133
3-0003	Me	Me	H	H	1	H	H	Ph	Me	Cl	不能测定
3-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Et	158-160
3-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	N(Me) ₂	150-151
3-0006	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	Cl	79-81
3-0007	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	H	Cl	120-122
3-0008	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CHF ₂	Cl	41-42
3-0009	Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	CHF ₂	CF ₃	89-90
3-0010	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	Cl	126-127
3-0011	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHF ₂	CF ₃	136-137
3-0012	Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	Me	CF ₃	124-125
3-0013	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OMe	113-114
3-0014	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-Cl)Ph	67-70
3-0015	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPen-c	113-114
3-0016	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	CN	105-108
3-0017	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	Cl	105-107
3-0018	Me	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	Me	Cl	78-79
3-0019	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	-(CH ₂) ₃ O-		151-152
3-0020	Me	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	Me	Cl	1.5183
3-0021	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	F	
3-0022	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	SEt	
3-0023	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Ph	N(Me) ₂	
3-0024	Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Me	CF ₃	
3-0025	Me	Me	H	H	0	H	H	OH	Me	CF ₃	
3-0026	Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	Me	CF ₃	
3-0027	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	F	
3-0028	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OMe	
3-0029	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	O(2-Cl)Ph	
3-0030	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	OPen-c	

3-0031	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me	CN	
3-0032	Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	Et	Cl	
3-0033	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	-(CH ₂) ₃ O-		
3-0034	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	H	Cl	138-140
3-0035	Me	Me	H	H	2	H	H	H	Me	Cl	105-106
3-0036	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	Me	148-150
3-0037	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	Cl	99-101
3-0038	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	Cl	143-145
3-0039	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl	115-116
3-0040	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	CF ₃	120-122
3-0041	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	F	79-82
3-0042	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OH	90-92
3-0043	Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	CF ₃	125-126
3-0044	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OEt	92-94
3-0045	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPr-i	69-71
3-0046	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPr	82-83
3-0047	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OBu-t	86-89
3-0048	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OBu	61-62
3-0049	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OHex-c	124-125
3-0050	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pr-c	93-94
3-0051	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pen-c	112-113
3-0052	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Hex-c	56-59
3-0053	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ C≡CH	92-93
3-0054	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCHF ₂	129-130
3-0055	Me	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Me	CF ₃	不能测定
3-0056	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CHF ₂	89-91
3-0057	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CF ₃	93-95
3-0058	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ CN	1.4872
3-0059	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Ph	79-81
3-0060	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OPh	122-123
3-0061	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-Cl)Ph	不能测定
3-0062	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(3-OMe)Ph	1.5059
3-0063	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-Cl)Ph	68-69
3-0064	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-Me)Ph	132-133
3-0065	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(4-OMe)Ph	115-117
3-0066	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=O)Me	130-131
3-0067	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Me	168-169
3-0068	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SEt	100-102
3-0069	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Et	107-108

3-0070	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ Ph	166-168
3-0071	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Me	105-107
3-0072	Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Me	Cl	127-129
3-0073	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Et	Cl	111-112
3-0074	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Et	CF ₃	112-114
3-0075	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr-i	Cl	157-158
3-0076	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr-i	CF ₃	135-136
3-0077	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	Cl	89-90
3-0078	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr	CF ₃	111-113
3-0079	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	H	101-103
3-0080	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	Cl	118-119
3-0081	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-s	Cl	110-112
3-0082	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-s	CF ₃	110-111
3-0083	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-i	Cl	96-98
3-0084	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu-i	CF ₃	140-141
3-0085	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu	Cl	89-90
3-0086	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Bu	CF ₃	108-110
3-0087	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Ph	Cl	132-133
3-0088	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Ph	CF ₃	118-120
3-0089	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pen-c	Cl	130-131
3-0090	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pen-c	CF ₃	147-148
3-0091	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Hex-c	Cl	151-152
3-0092	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	Cl	93-95
3-0093	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Pr-c	CF ₃	129-130
3-0094	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	1-环丙基乙基	Cl	87-89
3-0095	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	1-环丙基乙基	CF ₃	121-123
3-0096	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-甲基环丙基)	Cl	102-103
3-0097	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ (2-甲基环丙基)	CF ₃	118-119
3-0098	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Bu-c	Cl	94-96
3-0099	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Bu-c	CF ₃	141-142
3-0100	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Pen-c	Cl	127-129
3-0101	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Pen-c	CF ₃	146-149
3-0102	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Hex-c	Cl	152-154
3-0103	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ Hex-c	CF ₃	115-117
3-0104	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	78-80
3-0105	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	105-106
3-0106	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	73-74
3-0107	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ C≡CH	CF ₃	108-109
3-0108	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHMeC≡CH	Cl	95-96
3-0109	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CHMeC≡CH	CF ₃	116-118
3-0110	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CMe	Cl	114-115

3-0111	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{C}=\text{CMe}$	CF_3	115-116
3-0112	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CHF_2	OMe	72-74
3-0113	Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CHF_2	CF_3	108-109
3-0114	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CHF_2	Cl	99-100
3-0115	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CHF_2	CF_3	107-109
3-0116	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CF_3	Cl	135-136
3-0117	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CF_3	CF_3	112-115
3-0118	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OMe	Cl	87-89
3-0119	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2OMe	CF_3	125-128
3-0120	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2OEt	Cl	97-98
3-0121	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2OEt	CF_3	128-129
3-0122	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	Cl	79-81
3-0123	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	CF_3	93-94
3-0124	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$	Cl	102-104
3-0125	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$	CF_3	118-119
3-0126	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$	Cl	56-59
3-0127	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$	CF_3	118-119
3-0128	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2SMe	Cl	103-105
3-0129	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2SMe	CF_3	128-129
3-0130	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Cl	157-159
3-0131	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	CF_3	165-166
3-0132	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	Cl	155-157
3-0133	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	CF_3	166-168
3-0134	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	CH_2CN	Cl	128-129
3-0135	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH_2CN	CF_3	117-118
3-0136	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{OEt}$	Cl	127-129
3-0137	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{OEt}$	CF_3	143-145
3-0138	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$	Cl	173-174
3-0139	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$	CF_3	182-183
3-0140	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{Me})_2$	Cl	142-143
3-0141	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{Me})_2$	CF_3	181-182
3-0142	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Me}$	Cl	148-149
3-0143	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Me}$	CF_3	163-164
3-0144	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Me}$	Cl	89-91
3-0145	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	Me	140-141
3-0146	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	Cl	124-125
3-0147	Me	Me	H	H	2	H	H	Et	Ph	Cl	112-113
3-0148	Me	Me	H	H	2	H	H	Pr	Ph	Cl	122-123
3-0149	Me	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	Ph	Cl	116-117
3-0150	Me	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	Ph	Cl	100-102
3-0151	Me	Me	H	H	2	H	H	CF_3	Ph	H	111-112

3-0152	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	Me	129-132
3-0153	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	CF ₃	112-113
3-0154	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	F	90-91
3-0155	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OMe	104-106
3-0156	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OEt	129-131
3-0157	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OPr-i	86-88
3-0158	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OPr	117-118
3-0159	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OBu-t	105-108
3-0160	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCHF ₂	90-92
3-0161	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Me	167-168
3-0162	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	CN	113-115
3-0163	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(2-Cl)Ph	Cl	153-154
3-0164	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-Cl)Ph	Cl	106-107
3-0165	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-Cl)Ph	Cl	142-143
3-0166	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-F)Ph	Cl	135-138
3-0167	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-OMe)Ph	Cl	136-138
3-0168	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-Me)Ph	Cl	129-130
3-0169	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-NO ₂)Ph	Cl	145-147
3-0170	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-CN)Ph	Cl	91-93
3-0171	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)Me)Ph	Cl	133-135
3-0172	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-C(=O)OMe)Ph	Cl	121-124
3-0173	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	嘧啶-2-基	Cl	148-150
3-0174	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	4,6-二甲氧基嘧啶-2-基	Cl	117-118
3-0175	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Me	Cl	146-148
3-0176	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	SO ₂ Ph	Cl	145-148
3-0177	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)Me	Cl	130-131
3-0178	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)Ph	Cl	114-117
3-0179	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	C(=O)OMe	Cl	104-106
3-0180	Me	Et	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	Cl	108-110
3-0181	Me	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	Me	Cl	1.5183
3-0182	Me	Me	H	H	0	H	H	Ph	Me	Cl	76-77
3-0183	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Bu-t	OMe	1.4831
3-0184	Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NH ₂	Cl	179-180
3-0185	Me	Me	H	H	0	H	H	Me	Ph	Cl	58-60

表 14

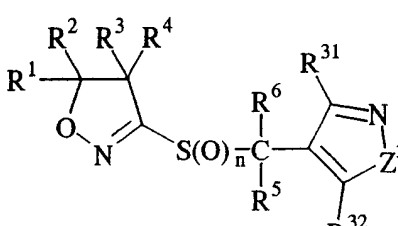
									
R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ³	R ³¹	R ³²	熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	Me	135-136
Me	H	H	2	H	H	S	Me	Cl	113-114
Me	H	H	0	H	H	O	CF ₃	Me	
Me	H	H	0	H	H	S	Me	Cl	
Me	H	H	2	H	H	O	Me	Me	178-179
Me	H	H	2	H	H	O	CF ₃	OEt	89-91
Me	H	H	2	H	H	O	Ph	Me	81-83
Me	H	H	2	H	H	S	Me	OEt	109-111

表 15

化合物 序号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ³³	R ³⁴	熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
5-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Me	114-115
5-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	Cl	Et	107-108
5-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	NMe	CF ₃	H	142-143
5-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -		123-125
5-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	Oet	Me	1.5397
5-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCHF ₂	Me	1.5339
5-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	CF ₃	H	99-101
5-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	87-90
5-0009	Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	1.5702

表 16

化合物 序号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁵	R ³⁵	R ³⁶	熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
6-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -		不能测定
6-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	Oet	107-108
6-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	H	OCHF ₂	1.5383
6-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	H	100-102
6-0005	Me	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	-(CH ₂) ₄ -		1.5264

表 17

化合物 序号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ³⁷	R ³⁸	R ³⁹	R ⁴⁰		熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
7-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-	77-80
7-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	N-氧化物	114-116
7-0003	Me	Me	H	H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	-	
7-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	-	130-131
7-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	N-氧化物	166-168
7-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Ph	H	H	-	118-120
7-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Ph	H	H	-	105-106
7-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Me	H	H	-	115-116
7-0009	Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	H	H	-	134-135
7-0010	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Me	H	H	N-氧化物	198-199
7-0011	Me	Me	H	H	2	H	H	Ph	Ph	H	H	-	161-162
7-0012	Me	Me	H	H	1	H	H	H	H	H	H	-	97-99
7-0013	Me	Me	H	H	0	H	H	(2-氯吡啶-3-基) 甲硫基	H	H	H	-	154-155

表 18

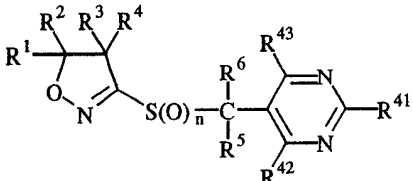
										
R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ⁴¹	R ⁴²	R ⁴³	熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	CF ₃	175-176
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OMe	CF ₃	
Me	Me	H	H	2	H	H	H	Cl	Cl	119-120
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OEt	CF ₃	94-95
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OMe	OMe	186-187
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OMe	CF ₃	143-144
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	OMe	CF ₃	144-145
Me	Me	H	H	2	H	H	SMe	OMe	CF ₃	160-162
Me	Me	H	H	2	H	H	SO ₂ Me	OMe	CF ₃	144-146
Me	Me	H	H	2	H	H	NH ₂	OMe	CF ₃	208-209
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	H	H	CF ₃	112-113
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	H	CF ₃	1.4986

表 19

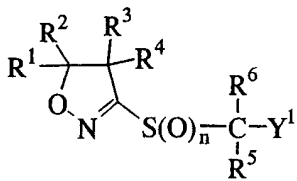
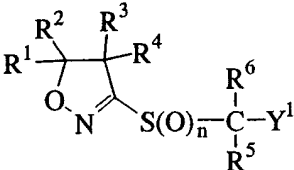
									
化合物序号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹	熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
9-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	吡啶-2-基	116-118
9-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	吡啶-2-基1-氧化物	140-143
9-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	吡啶-4-基	133-136
9-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	吡啶-4-基1-氧化物	110-113
9-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	1,2,4-噁二唑-3-基	不能测定
9-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	3-苯基-1,2,4-噁二唑-5-基	153-154
9-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	3-苄基-1,2,4-噁二唑-5-基	108-109
9-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	2-氯噻唑-4-基	110-112
9-0009	Me	Me	H	H	2	H	H	1,4-二甲基咪唑-5-基	163-164
9-0010	Me	Me	H	H	1	H	H	吡啶-2-基	81-82
9-0011	Me	Me	H	H	1	H	H	吡啶-4-基	94-96
9-0012	Me	Me	H	H	1	H	H	1,4-二甲基咪唑-5-基	138-140
9-0013	Me	Me	H	H	0	H	H	1,4-二甲基咪唑-5-基	1.5427

表 20

									
化合物序号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹	熔点(℃) 或折射率 (n _D ²⁰)
10-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	苯并咪唑-2-基	171-174
10-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噻吩-2-基	181-183
10-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	3-氯苯并噻吩-2-基	109-112
10-0004	Me	Me	H	H	2	H	H	苯并三唑-1-基	206-207
10-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	1-甲基咪唑-4-基	128-130
10-0006	Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噻唑-2-基	142-143
10-0007	Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噻吩-3-基	188-191
10-0008	Me	Me	H	H	2	H	H	5-氯苯并噻吩-3-基	129-130
10-0009	Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噁唑-2-基	127-129
10-0010	Me	Me	H	H	2	H	H	3-甲基苯并噻吩-2-基	161-163
10-0011	Me	Me	H	H	2	H	H	3-溴苯并噻吩-2-基	118-119
10-0012	Me	Me	H	H	2	H	H	苯并呋喃-2-基	123-124
10-0013	Me	Me	H	H	2	H	H	2-甲基苯并呋喃-7-基	135-137
10-0014	Me	Me	H	H	2	H	H	3-溴苯并呋喃-2-基	107-108
10-0015	Me	Me	H	H	2	H	H	苯并噻吩-7-基	95-97
10-0016	Me	Me	H	H	2	H	H	1-甲基咪唑-7-基	89-90
10-0017	Me	Me	H	H	2	H	H	3-甲基苯并呋喃-2-基	111-112
10-0018	Me	Me	H	H	2	H	H	3-氯-1-甲基咪唑-2-基	162-165

(中间体的制备实施例)

<参考实施例 1>

制备 3-氯-5,5-二甲基-2-异噁唑啉

在 65 - 70℃, 将 534.0 g (4.0 mol) N-氯琥珀酰亚胺逐渐加到 182.7 g (2.05 mol) 乙醛酸酐肟溶解在 2 升 1,2-二甲氧基乙烷内的溶液中。将该混合物加热回流 1 小时。在冷却下向其中加入 1,440.0 g (14.4 mol) 碳酸氢钾和 10 ml 水。然后加入 360.0 g (6.4 mol) 2-甲基丙烯。将所得混合物在室温搅拌 24 小时以引起反应。将该反应混合物倒入水中, 然

后用二异丙基醚萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 107.7 g (产率: 40.0%) 3-氯-5,5-二甲基-2-异噁唑啉，为黄色粘稠液体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

2.93 (2H,s), 1.47 (6H,s)

<参考实施例 2>

制备 3-氯-5-乙基-5-甲基-2-异噁唑啉

在 60℃ 将 61.9 g (463.4 mmol) N-氯琥珀酰亚胺逐渐加到 20.6 g (231.7 mmol) 乙醛酸酐溶解在 500 ml 1,2-二甲氧基乙烷内的溶液中。加入后，将该混合物加热回流 10 分钟。在冷却下向其中加入 50 ml (463.4 mmol) 2-甲基-1-丁烯、98.9 g (1,622 mmol) 碳酸氢钾和 10 ml 水。将所得混合物搅拌 12 小时以引起反应。将该反应混合物倒入水中，然后用正己烷萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 13.9 g (产率: 40.6%) 3-氯-5-乙基-5-甲基-2-异噁唑啉，为黄色粘稠液体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

2.91 (2H, ABq, J=17.0, Δν=46.1 Hz), 1.73 (2H,q),

1.42 (3H,s), 0.96 (3H,t)

<参考实施例 3>

制备 3-苄基硫基-5,5-二甲基-2-异噁唑啉

在氮气氛下，将 3.2 g (23.2 mmol) 无水碳酸钾和 3.0 g (22.5 mmol) 3-氯-5,5-二甲基-2-异噁唑啉加到 2.8 g (22.5 mmol) 苄基硫醇溶解在 50 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在 100℃ 搅拌 2 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物，获得了 3.1 g (产率: 62.0%) 3-苄基硫基-5,5-二甲基

-2-异噁唑啉, 为黄色油状物($n_{D20} = 1.5521$).

$^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ (ppm)]:

7.24-7.39 (5H,m), 4.26 (2H,s), 2.77 (2H,s),

1.40 (6H,s)

<参考实施例 4>

制备 3-(2,6-二氟苄基亚磺酰基)-5-乙基-5-甲基-2-异噁唑啉

在冰冷却下, 将 4.6 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 18.8 mmol)加到 4.1 g (15.0 mmol) 3-(2,6-二氟苄基硫基)-5-乙基-5-甲基-2-异噁唑啉溶解在 50 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 1.5 g (产率: 34.8%) 3-(2,6-二氟苄基亚磺酰基)-5-乙基-5-甲基-2-异噁唑啉, 为白色粉末(熔点: 30°C 或更低)。

$^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ (ppm)]:

7.39-7.28 (1H,m), 7.03-6.94 (2H,m), 4.38 (2H,s),

3.04 (1H, ABq, $J=17.2$, $\Delta \nu = 85.7$ Hz), 3.12 (1H,s),

1.75 (2H,m), 1.44 (3H,S)+1.41 (3H,s), 0.97 (3H,m)

<参考实施例 5>

制备 3-(2,6-二氟苄基磺酰基)-5-乙基-5-甲基-2-异噁唑啉

在冰冷却下, 将 1.0 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 4.1 mmol)加到 0.8 g (2.8 mmol) 3-(2,6-二氟苄基亚磺酰基)-5-乙基-5-甲基-2-异噁唑啉溶解在 50 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开

溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.6 g (产率: 75.0%) 3-(2,6-二氯苄基磺酰基)-5-乙基-5-甲基-2-异噻唑啉, 为白色粉末(熔点: 64 - 65°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.36-7.46 (1H,m), 6.98-7.04 (2H,m), 4.73 (2H,s),

3.04 (2H, ABq, J=17.2, Δν=51.1 Hz), 1.77 (2H,q),

1.46 (3H,s), 0.97 (3H,t)

<参考实施例 6>

制备 5,5-二甲基-3-甲基磺酰基-2-异噻唑啉

在冰冷却下, 将 1.0 kg 甲硫醇钠水溶液(含量: 15%, 2.14 mmol)滴加到 143.0 g (1.07 mol) 3-氯-5,5-二甲基-2-异噻唑啉溶解在 500 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 12 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 115.0 g (产率: 74.1%) 5,5-二甲基-3-甲硫基-2-异噻唑啉。将残余物(741.2 mmol)溶解在 1 升氯仿中。在冰冷却下向其中加入 392.0 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 1.59 mol)。将所得混合物搅拌 1 小时, 然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。反应完全后, 通过过滤除去分离出的间氯过苯甲酸。将所得滤液依次用亚硫酸氢钠水溶液、水、碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用二异丙基醚洗涤残余物, 获得了 77.6 g (产率: 59.1%) 5,5-二甲基-3-甲基磺酰基-2-异噻唑啉, 为白色粉末(熔点: 82 - 84°C)。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

3.26 (3H,s), 3.12 (2H,s), 1.51 (6H,s)

<参考实施例 7>

制备 5,5-二甲基-3-乙硫基-2-异噻唑啉

将 1,500 ml 含有 560.0 g (9.0 mol) 乙硫醇和 360.0 g (9.0 mol) 氢氧化钠的水溶液加到含有 3-氯-5,5-二甲基-2-异噻唑啉的溶液中。将该混

合物在 60–70℃ 搅拌 16 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 270.0 g 5,5-二甲基-3-乙硫基-2-异噻唑啉粗产物，为深红色油状物。

<参考实施例 8>

制备 5,5-二甲基-3-乙基磺酰基-2-异噻唑啉

将 270.0 g (1.7 mol) 5,5-二甲基-3-乙硫基-2-异噻唑啉油状粗产物溶解在 1.0 升氯仿中。在冰冷却下向其中加入 1,050 g 间氯过苯甲酸(纯度: 70%, 6.1 mol)。将所得混合物搅拌 1 小时，然后在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后，通过过滤除去分离出的间氯过苯甲酸。将所得滤液依次用亚硫酸氢钠水溶液、碳酸氢钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤残余物，获得了 133.6 g (产率: 65.4%) 5,5-二甲基-3-乙基磺酰基-2-异噻唑啉，为白色粉末。

<参考实施例 9>

制备 1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-5-醇

将 20 g (184.9 mmol) 苯基胍和 4 ml 浓盐酸加到 34.1 g (184.9 mmol) 三氟乙酰乙酸乙酯溶解在 500 ml 乙醇内的溶液中。将该混合物加热回流 1 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含有的大部分溶剂。将残余物与水混合以沉淀出晶体。通过过滤收集晶体，用水洗涤直至滤液变为中性，干燥，获得了 37.1 g (产率: 87.9%) 1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-5-醇，为赭色晶体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.68-7.41 (5H,m), 5.86 (1H,s), 3.71 (1H,s)

<参考实施例 10>

制备 5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛

在冰冷却下，将 33.6 g (219.1 mmol) 三氟氧化磷加到 7.7 g (105.2 mmol) N,N-二甲基甲酰胺中。在室温向其中加入 20 g (87.7 mmol) 1-

苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-5-醇。将所得混合物加热回流 1 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入冰冷却的水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用碳酸氢钠水溶液和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 19.1 g (产率: 79.1%) 5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛, 为白色晶体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

10.06 (1H,s), 7.57 (5H,s)

<参考实施例 11>

制备(5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇

将 0.21 g (5.5 mmol) 氢化锂铝溶解在 70 ml THF 中的溶液冷却至 -30°C。向其中逐渐加入 3 g (10.9 mmol) 5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛溶解在 30 ml 四氢呋喃中的溶液。将所得混合物在 -30°C 搅拌 30 分钟以引起反应。反应完全后, 加入乙酸乙酯, 然后搅拌。加入水, 然后搅拌一会。将该反应混合物真空过滤。用乙酸乙酯萃取滤液。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 3.0 g (产率: 99.9%) (5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇, 为白色晶体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.54-7.51 (5H,m), 4.71 (2H,d) 1.79 (1H,b)

<参考实施例 12>

制备 4-溴甲基-5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑

将 3.0 g (10.9 mmol) (5-氯-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇溶解在 60 ml 乙醚中的溶液冷却至 -10°C。向其中加入 1.0 g (3.8 mmol) 三溴化磷。将该混合物在室温搅拌 1 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 3.6 g (产率: 95.8%) 4-溴甲基-5-氯-1-苯基

-3-三氟甲基-1H-吡唑，为白色晶体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.58-7.48 (5H,m), 4.48 (2H,s)

<参考实施例 13>

制备 5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛

将 10.5 g (180.2 mmol) 氟化钾加到 33.0 g (120.1 mmol) 5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛溶解在 500 ml 二甲亚砜内的溶液中。将该混合物在 100℃ 搅拌 2 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂)，获得了 26.5 g (产率: 85.0%) 5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

9.96 (1H,s), 7.68-7.51 (5H,m)

<参考实施例 14>

制备(5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇

在冰冷却下，向 1.6 g (41.0 mmol) 硼氢化钠溶解在 300 ml 甲醇内的溶液中加入 26.5 g (102.5 mmol) 5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛溶解在 200 ml 甲醇中的溶液。将所得混合物在 0℃ 搅拌 30 分钟以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 28.5 g (产率: 100%) (5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.65-7.41 (5H,m), 4.68 (2H,d), 1.73 (1H,t)

<参考实施例 15>

制备 4-溴甲基-5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑

将 27.5 g (105.7 mmol) (5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲

醇溶解在 300 ml 乙醚中的溶液冷却至 0°C。向其中加入 10.0 g (37.0 mmol) 三溴化磷。将该混合物在室温搅拌 2 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙醚萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 30.3 g (产率: 88.8%) 4-溴甲基-5-氟-1-苯基-3-三氟甲基-1H-吡唑。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.66-7.42 (5H,m), 4.44 (2H,s)

<参考实施例 16>

制备 1-叔丁基-3-三氟甲基-1H-吡唑-5-醇

将 373.8 g (3.0 mol) 叔丁基胍盐酸盐和 50 ml 浓盐酸加到 552.3 g (3.0 mol) 三氟乙酰乙酸乙酯溶解在 1,500 ml 乙醇内的溶液中。将该混合物加热回流 2 天以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含有的大部分溶剂。将该残余物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤残余物, 获得了 369.0 g (产率: 59.1%) 1-叔丁基-3-三氟甲基-1H-吡唑-5-醇, 为白色粉末。

<参考实施例 17>

制备 1-叔丁基-5-氟-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛

在冰冷却下, 将 462.0 g (3.0 mol) 三氟氧化磷加到 87.7 g (1.2 mol) N,N-二甲基甲酰胺中。在室温向其中加入 208.2 g (1.0 mol) 1-叔丁基-3-三氟甲基-1H-吡唑-5-醇。将所得混合物加热回流 10 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用水、5% 氢氧化钠水溶液和水洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 131.5 g (产率: 21.7%) 1-叔丁基-5-氟-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛, 为白色晶体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

9.97 (1H,d), 1.76 (9H,s)

<参考实施例 18>

制备(1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇

将 39.9 g (156.9 mmol) (1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇溶解在 300 ml 甲醇中的溶液冷却至 0°C。向其中逐渐加入 6.5 g (172.6 mmol) 硼氢化钠。将该混合物在室温搅拌 3 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 37.7 g (产率: 93.6%) (1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.60 (2H,d), 1.72 (9H,s), 1.58 (1H,t)

<参考实施例 19>

制备 4-溴甲基-1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑

将 9.2 g (35.7 mmol) (1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇溶解在 100 ml 乙醚中的溶液冷却至 -10°C。向其中加入 11.6 g (42.9 mmol) 三溴化磷。将该混合物在室温搅拌过夜以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙醚萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 10.0 g (产率: 87.3%) 4-溴甲基-1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑。

<参考实施例 20>

制备(1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲硫醇

将 43.5 g (136.1 mmol) 4-溴甲基-1-叔丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑加到 21.8 g 氢硫化钠水合物(纯度: 70%, 272.2 mmol)溶解在 300 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在室温搅拌过夜以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙醚萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 32.3 g (产率: 87.0%) (1-叔

丁基-5-氯-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲硫醇。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

3.65 (2H,d), 1.90 (1H,t), 1.70 (9H,s)

<参考实施例 21>

制备 1-叔丁基-5-甲氧基-3-三氟甲基-1H-吡唑

在室温将 15.0 g (108.4 mmol)无水碳酸钾和 19.3 g (135.5 mmol)甲基碘加到 18.8 g (90.3 mmol) 1-叔丁基-3-三氟甲基-1H-吡唑-5-醇溶解在 100 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 15 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙醚萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 20.0 g (产率: 99.8 %) 1-叔丁基-5-甲氧基-3-三氟甲基-1H-吡唑。

<参考实施例 22>

制备 1-叔丁基-4-氯甲基-5-甲氧基-3-三氟甲基-1H-吡唑

将 5.4 g 低聚甲醛(180.2 mmol, 按甲醛计)和 20 ml 浓盐酸加到 20.0 g (90.1 mmol) 1-叔丁基-5-甲氧基-3-三氟甲基-1H-吡唑溶解在 90 ml 乙酸内的溶液中。将该混合物在 60°C 搅拌 30 分钟以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用二异丙基醚萃取。用水洗涤所得有机层, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 21.7 g (产率: 89.0 %) 1-叔丁基-4-氯甲基-5-甲氧基-3-三氟甲基-1H-吡唑。

<参考实施例 23>

制备 3-甲氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑

室温将 10.0 g (72.3 mmol)无水碳酸钾和 12.8 g (90.3 mmol)甲基碘加到 10.0 g (60.2 mmol) 3-羟基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑溶解在 50 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物搅拌 15 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙醚萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 9.8 g (产率: 90.7

%) 3-甲氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑。

<参考实施例 24>

制备 4-氯甲基-3-甲氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑

将 0.45 g 低聚甲醛(15.0 mmol, 按甲醛计)和 5 ml 浓盐酸加到 1.00 g (5.6 mmol) 3-甲氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑溶解在 25 ml 乙酸内的溶液中。将该混合物在 80°C 搅拌 2 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 用碳酸钾中和, 然后用乙酸乙酯萃取。用水洗涤所得有机层, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.83 g (产率: 65.0%) 4-氯甲基-3-甲氧基-1-甲基-5-三氟甲基-1H-吡唑。

<参考实施例 25>

制备 5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛

将 42.0 g (711.9 mmol) 氟化钾加到 60.4 g (282.7 mmol) 5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛溶解在 700 ml 二甲亚砜内的溶液中。将该混合物在 120 - 140°C 搅拌 5 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 36.8 g (产率: 66.0%) 5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛。

<参考实施例 26>

制备(5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇

在冰冷却下, 向 3.9 g (102.6 mmol) 硼氢化钠溶解在 500 ml 甲醇内的溶液中加入 36.8 g (187.6 mmol) 5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醛溶解在 200 ml 甲醇中的溶液。将所得混合物在 0°C 搅拌 30 分钟以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 35.4 g

(产率: 95.4%) (5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇。

<参考实施例 27>

制备 4-溴甲基-5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑

将 35.4 g (178.7 mmol) 5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-甲醇溶解在 500 ml 乙醚中的溶液冷却至 -30°C。向其中加入 54.0 g (199.5 mmol) 三溴化磷。将该混合物在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙醚萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 31.4 g (产率: 80.8%) 4-溴甲基-5-氟-1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑。

<参考实施例 28>

制备(乙氧基羰基)丙二醛

通过倾析数次将 12.6 g 氢化钠(纯度: 60%, 525.0 mmol)用乙醚洗涤, 然后制成在 500 ml 乙醚中的溶液。在 0 - 10°C、氮气流下向其中加入 194 g (2.6 mol) 甲酸乙酯和 50 g (262.0 mmol) 3,3-二乙氧基-丙酸乙酯。将所得混合物在室温搅拌 15 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙醚洗涤。用盐酸将所得水层调节至 pH 1, 然后用二氯甲烷萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 37.6 g (产率: 100%) (乙氧基羰基)丙二醛粗产物, 为深红色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

9.09 (2H,s), 5.26 (1H,s), 4.27 (2H,q), 1.28 (3H,t)

<参考实施例 29>

制备 1H-吡唑-4-甲酸乙酯

在冰冷却下, 将 6.2 g (193 mmol) 肼加到 27.6 g (192 mmol) (乙氧基羰基)丙二醛溶解在 150 ml 乙醇内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 17 小时以引起反应。将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含有的乙醇。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 二氯甲烷-乙酸乙酯混

合溶剂), 获得了 19.4 g (72.4%) 1H-吡唑-4-甲酸乙酯, 为黄色晶体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.08 (2H,s), 5.30 (1H,s), 4.31 (2H,q), 1.36 (3H,t)

<参考实施例 30>

制备 1-乙基-1H-吡唑-4-甲酸乙酯

将 3.7 g (26.8 mmol) 无水碳酸钾和 4.2 g (26.6 mmol) 乙基碘加到 1.5 g (10.7 mmol) 1H-吡唑-4-甲酸乙酯溶解在 50 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 20 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 1.6 g (产率: 88.9%) 1-乙基-1H-吡唑-4-甲酸乙酯, 为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

7.90 (2H,s), 4.28 (2H,q), 4.18 (2H,q), 1.51 (3H,t),

1.35 (3H,t)

<参考实施例 31>

制备 3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-甲酸乙酯

在玻璃密封管中放置 1.6 g (9.5 mmol) 1-乙基-1H-吡唑-4-甲酸乙酯和 5.1 g (38.3 mmol) N-氯琥珀酰亚胺。让其在 160℃ 反应 6 小时。反应完全后, 将该反应混合物冷却至室温, 用四氯化碳和氯仿洗涤, 并真空过滤。将所得滤液(有机层)用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 1.0 g (产率: 44.2%) 乙基 3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4 甲酸乙酯, 为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.36 (2H,q), 4.21 (2H,q), 1.44 (3H,t), 1.38 (3H,t)

<参考实施例 32>

制备(3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-基)甲醇

将 0.16 g (4.2 mmol) 氢化锂铝溶解在 70 ml 四氢呋喃中的溶液冷却至 -50°C。向其中逐渐滴加 1.0 g (4.2 mmol) 3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-甲酸乙酯溶解在 30 ml 四氢呋喃中的溶液。将该混合物 -50°C 搅拌 3 小时以引起反应。确认反应完全后，加入乙酸乙酯，然后搅拌一会。加入水，然后搅拌一会。将所得混合物真空过滤。用乙酸乙酯萃取滤液。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 0.82 g (产率: 100%) (3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-基) 甲醇，为棕色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.52 (2H,s), 4.16 (2H,q), 1.43 (3H,t)

<参考实施例 33>

制备 4-溴甲基-3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑

将 0.82 g (4.2 mmol) (3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑-4-基) 甲醇溶解在 50 ml 乙醚中的溶液冷却至 -30°C。向其中加入 1.3 g (4.8 mmol) 三溴化磷。将该混合物在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 0.9 g (产率: 81.8%) 4-溴甲基-3,5-二氯-1-乙基-1H-吡唑，为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.33 (2H,s), 4.13 (2H,q), 1.43 (3H,t)

<参考实施例 34>

制备 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-5-醇

将 8.3 g (180.6 mmol) 甲基胍和 5 ml 浓盐酸加到 30.0 g (180.6 mmol) 二氟乙酰乙酸乙酯溶解在 200 ml 乙醇内的溶液中、将该混合物加热回流 2 天以引起反应。反应完全后，将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含有的大部分溶剂。将该残余物倒入水中。用柠檬酸将该混合物调节至 pH 4，用乙酸乙酯萃取。将所得有机层依次用水和氯化

钠水溶液洗涤,然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂:己烷-乙酸乙酯混合溶剂),获得了 8.9 g (产率: 33.3%) 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-5-醇。

<参考实施例 35>

制备 5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醛

在冰冷却下,将 41.6 g (270.1 mmol)三氯化磷 7.9 g (108.0 mmol) N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。在室温向其中加入 8.0 g (54.0 mmol) 3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-5-醇。将该混合物加热回流 4 小时以引起反应。反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用水、5% 氢氧化钠水溶液和水洗涤,然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂:己烷-乙酸乙酯混合溶剂),获得了 7.7 g (产率: 73.3%) 5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醛,为白色晶体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

9.96 (1H,s), 6.90 (1H,t, J=53.6 Hz), 3.93 (3H,s)

<参考实施例 36>

制备(5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇

将 7.2 g (37.0 mmol) 5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醛溶解在 100 ml 甲醇中的溶液冷却至 0°C。向其中逐渐加入 2.1 g (55.5 mmol) 硼氢化钠。将该混合物在室温搅拌 3 小时以引起反应。反应完全后,将该反应混合物倒入水中,然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤,然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂,获得了 3.8 g (产率: 52.1%) (5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

6.70 (1H,t, J=40.8 Hz), 4.63 (2H,s), 3.86 (3H,s),

1.79 (1H,br)

<参考实施例 37>

制备 4-溴甲基-5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑

2.0 g (10.0 mmol) (5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-基)-甲醇溶解在 50 ml 乙醚中的溶液冷却至-10°C。向其中加入 1.0 g (3.5 mmol) 三溴化磷。将该混合物在室温搅拌过夜以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入冰水内，然后用乙醚萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 2.6 g (产率: 100.0%) 4-溴甲基-5-氯-3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑。

<参考实施例 38>

制备三氟乙醛肟乙醚合物

将 24.1 g (347.0 mmol) 羟基胺盐酸盐和 160 ml 水加到 50.0 g (347.0 mmol) 三氟乙醛缩半乙醇(trifluoroacetaldehyde hemiethyl acetal)溶解在 80 ml 甲醇内的溶液中。在冰冷却下向其中滴加 80.0 g 50% 氢氧化钠水溶液(1.7 mol)。滴加完成后，将所得混合物在室温搅拌 6 小时以引起反应。反应完全后，加入 10% 盐酸以将 pH 调节至 6。用乙醚萃取所得混合物。将萃取液蒸馏以除去其中所含有的溶剂。将残余物蒸馏，获得了 24.7 g (产率: 38.0%) 三氟乙醛肟乙醚合物。

<参考实施例 39>

制备三氟乙酰肟酰溴乙醚合物

在冰冷却下，将 38.8 g (218.0 mmol) N-溴琥珀酰亚胺溶解在 125 ml N,N-二甲基甲酰胺中的溶液加到 24.7 g (131.7 mmol) 三氟乙醛肟乙醚合物溶解在 50 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 3 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙醚萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。将残余物蒸馏，获得了 33.3 g (产率: 95.0%) 三氟乙酰肟酰溴乙醚合物，为棕色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

9.30 (1H,s)

<参考实施例 40>**制备 4-乙氧基羰基-5-甲基-3-三氟甲基异噁唑**

将 2.8 g (51.3 mmol) 甲醇钠加到 6.7 g (51.3 mmol) 乙酰乙酸乙酯溶解在 80 ml 甲醇内的溶液中。在冰冷却下向其中加入 5.0 g (18.8 mmol) 三氟羟肟酰溴乙醚合物溶解在 20 ml 甲醇中的溶液。将所得混合物在室温搅拌 3 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。将水加到残余物中，然后用氯仿萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂：己烷-乙酸乙酯混合溶剂)，获得了 2.9 g (产率：69.0%) 4-乙氧基羰基-5-甲基-3-三氟甲基异噁唑，为无色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.36 (2H,q), 2.77 (3H,s), 1.37 (3H,t)

<参考实施例 41>**制备(5-甲基-3-三氟甲基异噁唑-4-基)-甲醇**

将 0.16 g (4.2 mmol) 氢化锂铝溶解在 15 ml THF 中的溶液冷却至 0°C。向其中逐渐加入 0.93 g (4.2 mmol) 4-乙氧基羰基-5-甲基-3-三氟甲基异噁唑溶解在 15 ml THF 中的溶液。将该混合物在 0°C 搅拌 1 小时以引起反应。反应完全后，加入乙酸乙酯，然后搅拌一会。加入水，然后搅拌一会。将该反应混合物真空过滤。用乙醚萃取滤液。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 0.5 g (产率：60.0%) (5-甲基-3-三氟甲基异噁唑-4-基)-甲醇。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.60 (2H,d), 2.54 (3H,s), 1.66 (1H, br)

<参考实施例 42>**制备 4-溴甲基-5-甲基-3-三氟甲基异噁唑**

将 0.45 g (2.5 mmol) (5-甲基-3-三氟甲基异噁唑-4-基)-甲醇溶解在 10 ml 乙醚中的溶液冷却至 0°C。向其中加入 0.2 g (8.9 mmol) 三溴化

磷。将该混合物在室温搅拌 1 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙醚萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 0.5 g (产率: 74.0%) 4-溴甲基-5-甲基-3-三氟甲基异噻唑。

$^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ (ppm)]:

4.31 (2H,d), 2.51 (3H,s)

<参考实施例 43>

制备(5-氯-3-甲基-异噻唑-4-基)-甲醇

在 -30°C 将 2.06 g (10.0 mmol) 5-氯-3-甲基-异噻唑-4-甲酸乙酯溶解在 10 ml THF 中的溶液滴加到 0.42 g (11.0 mmol) 氯化锂铝溶解在 10 ml THF 内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 1 小时以引起反应。确认反应完全后，将乙酸乙酯加到该反应混合物中。将所得混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物，获得了 1.50 g (产率: 91.5%) (5-氯-3-甲基-异噻唑-4-基)-甲醇。

<参考实施例 44>

制备 4-氯甲基-5-氯-3-甲基异噻唑

在室温将 3.26 g (27.44 mmol) 亚硫酸氯加到 1.50 g (9.15 mmol) (5-氯-3-甲基-异噻唑-4-基)-甲醇溶解在 10 ml 氯仿内的溶液中。将该混合物搅拌 3 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 1.67 g (产率: 定量) 4-氯甲基-5-氯-3-甲基异噻唑。

<参考实施例 45>

制备 4-三氟甲基烟酸甲酯

将 6.7 g (48.6 mmol) 无水碳酸钾和 6.9 g (48.6 mmol) 甲基碘加到 4.6 g (24.1 mmol) 4-三氟甲基烟酸溶解在 70 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全

后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 2.77 g (产率: 56.1%) 4-三氟甲基烟酸甲酯, 为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

9.11 (1H,s), 8.92 (1H,d), 7.64 (1H,d), 3.99 (3H,s)

<参考实施例 46>

制备(4-三氟甲基吡啶-3-基)-甲醇

将 0.37 g (9.7 mmol) 氢化锂铝溶解在 100 ml THF 中的溶液冷却至 -50°C。向其中逐渐滴加 2.0 g (9.8 mmol) 4-三氟甲基烟酸甲酯溶解在 30 ml THF 中的溶液。将该混合物在 -50°C 搅拌 3 小时以引起反应。确认反应完全后, 加入乙酸乙酯, 然后搅拌一会。加入水, 然后搅拌一会。将该反应混合物真空过滤。用乙酸乙酯萃取滤液。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷-乙酸乙酯混合溶剂), 获得了 0.6 g (产率: 35.3%) (4-三氟甲基吡啶-3-基)-甲醇, 为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

9.00 (1H,s), 8.73 (1H,d), 7.51 (1H,d), 4.95 (2H,s)

<参考实施例 47>

制备 3-溴甲基-4-三氟甲基吡啶

将 0.6 g (3.4 mmol) (4-三氟甲基吡啶-3-基)-甲醇溶解在 50 ml 乙醚中的溶液冷却至 -30°C。向其中加入 1.4 g (5.2 mmol) 三溴化磷。将该混合物在室温搅拌 12 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 0.61 g (产率: 75.3%) 3-溴甲基-4-三氟甲基吡啶, 为黄色油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.88 (1H,s), 8.73 (1H,d), 7.54 (1H,d), 4.63 (2H,s)

<参考实施例 48>

制备 5-溴-4-羟基-6-三氟甲基嘧啶

在室温将 77.5 g (945.0 mmol) 无水乙酸钠加到 49.2 g (300.0 mmol) 4-羟基-6-三氟甲基嘧啶溶解在 600 ml 乙酸内的溶液中。在 45℃ 向其中逐渐加入 50.3 g (315 mmol) 溴。将所得混合物在相同温度下搅拌 3 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。将该残余物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤残余物，获得了 38.9 g (产率: 53.4%) 5-溴-4-羟基-6-三氟甲基嘧啶。

<参考实施例 49>

制备 5-溴-4-氯-6-三氟甲基嘧啶

将 24.3 g (100.0 mmol) 5-溴-4-羟基-6-三氟甲基嘧啶悬浮在 18.5 g (120.0 mmol) 三氟氧化磷中。将所得混合物在 100℃ 搅拌 2 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物逐渐倒入水中，然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物，获得了 21.5 g (产率: 82.4%) 5-溴-4-氯-6-三氟甲基嘧啶。

<参考实施例 50>

制备 5-溴-4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶

在室温将 16.7 ml 甲醇钠(28% 甲醇溶液, 86.4 mmol)加到 21.5 g (82.2 mmol) 5-溴-4-氯-6-三氟甲基嘧啶溶解在 100 ml 甲醇中。将该混合物搅拌以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。将该残余物倒入水中，然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。用正己烷洗涤残余物，获

得了 19.2 g (产率: 91.0 %) 5-溴-4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶。

<参考实施例 51>

制备 5-溴-4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶

在室温将 0.94 g (13.77 mmol) 乙醇钠加到 3.00 g (11.48 mmol) 5-溴-4-氯-6-三氟甲基嘧啶溶解在 50 ml 乙醇内的溶液中。将该混合物搅拌以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。将该残余物倒入水中, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物, 获得了 2.44 g (产率: 82.9 %) 5-溴-4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶。

<参考实施例 52>

制备 4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-甲醛

在-65至-60℃, 将 30.0 ml 正丁基锂(1.6 mol/升正己烷溶液, 48.0 mmol)逐渐加到 10.3 g (40.0 mmol) 5-溴-4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶溶解在 100 ml 四氢呋喃内的溶液中。将该混合物搅拌 30 分钟。在同温下向其中加入 3.6 g (48.0 mmol) 甲酸乙酯。将所得混合物在相同温度下搅拌 3 小时以引起反应。将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物, 获得了 1.3 g (产率: 15.8 %) 4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-甲醛。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

10.41 (1H,q), 8.91 (1H,s), 4.18 (3H,s)

<参考实施例 53>

制备 4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-甲醛

将 5.76 g (21.3 mmol) 5-溴-4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶溶解在 250 ml THF 中的溶液冷却至-78℃。向其中滴加 22.6 ml 正丁基锂(1.6 mol/升正己烷溶液, 36.1 mmol)。将该混合物搅拌 40 分钟。向其中加入 2.7 g (45.1 mmol) 甲酸甲酯。将所得混合物搅拌 1.5 小时以引起反应。反应

完全后，加入氯化铵水溶液。用乙醚萃取该混合物。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂：己烷-乙酸乙酯混合溶剂)，获得了 3.82 g (产率：81.6%) 4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-甲醛。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

10.41 (1H,s), 8.95 (1H,s), 4.63 (2H,q), 1.48 (3H,t)

<参考实施例 54>

制备(4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲醇

在室温将 0.24 g (6.3 mmol) 硼氢化钠逐渐加到 1.3 g (6.3 mmol) 4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-甲醛溶解在 30 ml 甲醇内的溶液中。将该混合物搅拌 3 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物，获得了 0.42 g (产率：32.1%) (4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲醇。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.93 (1H,s), 4.81 (2H,s), 4.13 (3H,s), 2.26 (1H,br)

<参考实施例 55>

制备(4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲醇

在冰冷却下，将 3.82 g (17.2 mmol) 4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-甲醛溶解在 50 ml 甲醇中的溶液加到 1.7 g (45.7 mmol) 硼氢化钠溶解在 50 ml 甲醇内的溶液中。将该混合物在 0℃ 搅拌 1 小时以引起反应。反应完全后，将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 3.77 g (产率：97.8%) (4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲醇。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.80 (1H,s), 4.81 (2H,s), 4.59 (2H,q), 2.28 (1H,b),

1.48 (3H,t)**<参考实施例 56>****制备 5-氯甲基-4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶**

在室温将 1.19 g (10.1 mmol) 亚硫酸氯加到 0.42 g (2.02 mmol) (4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲醇的溶液中。将该混合物搅拌 3 小时以引起反应。确认反应完全后，将该反应混合物真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 0.45 g (产率: 定量) 5-氯甲基-4-甲氧基-6-三氟甲基嘧啶。

<参考实施例 57>**制备 5-溴甲基-4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶**

将 3.77 g (17.0 mmol) (4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶-5-基)-甲醇溶解在 50 ml 乙醚中的溶液冷却至 0°C。向其中加入 2.0 g (7.2 mmol) 三溴化磷。将该混合物在室温搅拌 1 小时。使用甲醇将所得盐溶解。将所得混合物搅拌 1 小时以引起反应。将该反应混合物倒入水中，然后用乙醚萃取。将所得有机层用氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂，获得了 5-溴甲基-4-乙氧基-6-三氟甲基嘧啶粗产物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.79 (1H,s), 4.61 (2H,q), 4.55 (2H,s), 1.49 (3H,t)

<参考实施例 58>**制备(2-氯-4-甲基吡啶-3-基)甲醇**

在 -65 至 -60°C，将 1.9 g (10.0 mmol) 2-氯-4-甲基烟酸甲酯溶解在 5.0 ml THF 中的溶液逐渐加到 0.4 g (10.0 mmol) 氯化锂铝在 30 ml 四氢呋喃内的悬浮液中。将该混合物在搅拌 30 分钟，在 -20°C 搅拌 1 小时以引起反应。将该反应混合物倒入水中，然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物，获得了 0.6 g (产率: 38.2%) (2-氯-4-甲基吡啶-3-基)甲醇。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.19 (1H,d), 7.08 (1h,d), 4.85 (2H,s), 2.49 (3H,s)

<参考实施例 59>

制备 3-乙酰基-4-氯甲基-2,5-二氯噻吩

在冰冷却下、10℃, 将 33 ml 四氯化钛(2 mol/升二氯甲烷溶液, 66.0 mmol)滴加到 5.0 g (32.4 mmol) 3-乙酰基-2,5-二氯噻吩溶解在 26 ml (323.0 mmol)氯甲基甲基醚内的溶液中。将该混合物在室温搅拌 2 小时以引起反应。反应完全后, 将该反应混合物倒入冰水内, 然后用氯仿萃取。将所得有机层依次用碳酸氢钠、水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂: 己烷/乙酸乙酯 = 9/1), 获得了 2.6 g (产率: 39.7%) 3-乙酰基-4-氯甲基-2,5-二氯噻吩, 为黄色晶体。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

4.70 (2H,s), 2.56 (3H,s), 2.54 (3H,s), 2.39 (3H,s)

<参考实施例 60>

制备 3-溴-2-溴甲基苯并呋喃

将 2.7 g (15.3 mmol) N-溴琥珀酰亚胺和 0.4 g (2.7 mmol)偶氮二异丁腈加到 2.8 g (13.3 mmol) 3-溴-2-甲基苯并呋喃溶解在 30 ml 一氯苯内的溶液中。将该混合物在 80℃ 搅拌 30 分钟以引起反应。确认了原料消失后, 将该反应混合物冷却至室温。通过过滤除去不溶物。将滤液真空蒸馏以除去其中所含有的溶剂。将该残余物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所得有机层依次用水和氯化钠水溶液洗涤, 然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂, 获得了 3.0 g (产率: 79.0%) 3-溴-2-溴甲基苯并呋喃。

<参考实施例 61>

制备 1-二氯甲基-1H-吡唑-4-甲酸乙酯

将 6.0 g (43.5 mmol)无水碳酸钾加到 3.0 g (21.4 mmol) 1H-吡唑-4-甲酸乙酯溶解在 100 ml N,N-二甲基甲酰胺内的溶液中。向其中吹入氯二氯甲烷。将所得混合物在 130 - 140℃ 搅拌 3 小时以引起反应。确认反应完全后, 将该反应混合物倒入水中, 然后用乙酸乙酯萃取。将所

得有机层用水和氯化钠水溶液洗涤，然后用无水硫酸镁干燥。将所得溶液真空蒸馏以除去其中所含的溶剂。通过硅胶柱色谱法纯化残余物(展开溶剂：己烷-乙酸乙酯混合溶剂)，获得了 1.67 g (产率：41.0%) 1-二氟甲基-1H-吡唑-4-甲酸乙酯，为无色透明油状物。

¹H-NMR [CDCl₃/TMS, δ (ppm)]:

8.32 (1H,s), 8.04 (1H,s), 7.20 (1H,t), 4.32 (2H,q),

1.37 (3H,t)

本发明除草剂含有通式[I]异噁唑啉衍生物或其盐作为活性组分。

在本发明化合物用作除草剂时，本发明化合物可通过它本身使用。其还可以以粉剂、可湿性粉剂、可乳化的浓缩物、可流动制剂、精细粒剂、粒剂等的形式，通过与制剂中常用的载体、表面活性剂、分散剂、辅助剂等混合来使用。

作为制剂中使用的载体，可提及的有例如固体载体例如滑石粉、膨润土、粘土、硅藻土、高岭土、白炭、蛭石、碳酸钙、熟石灰、硅土、硫酸铵、尿素等；和液体载体例如异丙醇、二甲苯、环己烷、甲基萘等。

作为表面活性剂和分散剂，可提及的有例如烷基苯磺酸的金属盐、二萘基甲烷二磺酸的金属盐、醇硫酸酯的盐、烷基芳基磺酸盐、木素磺酸盐、聚氧乙烯二醇醚、聚氧乙烯烷基芳基醚、聚氧乙烯脱水山梨醇的一烷基化物等。作为辅助剂，可提及的有例如羧甲基纤维素、聚乙二醇和阿拉伯胶。当使用时，将本发明除草剂稀释至合适的浓度并喷雾或直接施用。

本发明除草剂可通过给植物喷雾、施加到土壤中、施加到水表面上来使用。适当地确定活性组分的用量以满足应用目的。根据该目的来适当地确定活性组分的含量。当本发明化合物是配制成粉剂或颗粒时，其含量为 0.01% t-10% 重量、优选 0.05% t-5% 重量。当本发明化合物制成可乳化的浓缩物或可湿性粉剂时，其含量适当地为 1-50% 重量、优选 5-30%。当本发明化合物制成可流动制剂时，其含量适当地为 1-40% 重量、优选为 5-30% 重量。

本发明化合物的用量根据所用化合物的种类、目标杂草、杂草出现的趋势、环境条件和除草剂的种类等。当本发明除草剂自身的形式例如以粉末或颗粒的形式使用时，其用量适当地选取为 1 g - 50 kg、优选 10 g - 10 kg/1 公顷的活性组分。当本发明的除草剂以液体形式例如以可乳化的浓缩物、可湿性粉剂或可流动制剂的形式使用时，其用量适当地选取为 0.1 - 50,000 ppm、优选 10 - 10,000 ppm。

如果需要的话，可将本发明化合物与杀虫剂、杀真菌剂、其它除草剂、植物生长控制剂、肥料等混合。

下面通过典型的制剂实施例来具体描述本发明化合物的制剂。化合物和添加剂的种类以及的它们混合的比例不限于在下文中显示的那些，并且可广泛使用。在下列描述中，“份数”是指重量份。

<制剂 1>可湿性粉剂

将 10 份化合物(3-0006)与 0.5 份聚氧乙烯苯乙辛苯基醚、0.5 份 β -萘磺酸的钠盐-福尔马林浓缩物、20 份硅藻土和 69 份粘土混合。将该混合物混合并粉碎，获得了可湿性粉剂。

<制剂 2>可流动制剂

将 20 份粗研磨的化合物(3-0006)分散在 69 份水中。向其中加入 4 份聚氧乙烯苯乙基苯基醚硫酸盐、7 份乙二醇和 200 ppm (相对于制备的除草剂) Silicone AF-118N (Asahi Chemical Industry, Co. Ltd 的产品)。使用高速搅拌器将所得混合物搅拌 30 分钟，然后使用湿研磨机研磨，获得了可流动制剂。

<制剂 3>乳剂

向 30 份化合物(3-0006)中加入 60 份二甲苯与异佛尔酮的相等体积混合物和 10 份聚氧乙烯脱水山梨醇烷基化物、聚氧乙烯烷基芳基聚合物与烷基芳基磺酸盐的表面活性剂混合物。将所得混合物充分搅拌，获得了可乳化的浓缩物。

<制剂 4>粒剂

将 10 份化合物(3-0006)、80 膨胀剂(是滑石粉与膨润土的 1:3 混合物)、5 份白炭和 5 份聚氧乙烯脱水山梨醇烷基化物、聚氧乙烯烷基芳

基聚合物与烷基芳基磺酸盐的表面活性剂混合物混合。向该混合物中加入 10 份水。将该混合物充分揉合以形成糊状物。将所得糊状物经由带眼的筛子(直径: 0.7 mm)挤出。将挤出物干燥并切成 0.5 至 1 mm 的长度, 获得了粒剂。

下面描述本发明化合物的应用实施例以表明本发明化合物的作用。

<应用实施例 1> 通过稻田土壤处理来测试除草作用

将稻田土壤填充到 100 cm² 的塑料罐中, 并进行捣制。然后播种稗属(*Echinochloa*) *oryzicola* Vasing.和鸭舌草(*Monochoria vaginalis*) (Murm. f.) Presl var. *plantaginea* (Roxb.) Solms-Laub 种子, 填充水至 3 cm 的深度。第二天, 用水将依据制剂 1 制备的可湿性粉剂稀释, 并滴在水表面上。每种可湿性粉剂的施用量为 1,000 g/1 公顷的活性组分。然后在温室中培育, 依据表 21 所示的标准, 在从处理开始的第 21 天测定每种可湿性粉剂的除草作用。结果如表 22 所示。

表 21

指数	除草作用(生长抑制程度)或植物毒性
5	90% 的除草作用或植物毒性
4	70% 至 90% 以下的除草作用或植物毒性
3	50% 至 70% 以下的除草作用或植物毒性
2	30% 至 50% 以下的除草作用或植物毒性
1	10% 至 30% 以下的除草作用或植物毒性
0	0% 至 10% 以下的除草作用或植物毒性

表 22

化合物序号	活性组分 (g/ha)	稗属 oryzicola Vasing	鸭舌草(Burm.F.) Presl var. plantaginea (Roxb.) Solms-Laub.
1-0001	1000	5	5
1-0002	1000	5	5
1-0003	1000	5	5
1-0004	1000	5	5
1-0005	1000	5	5
2-0001	1000	5	5
2-0003	1000	5	5
2-0004	1000	5	5
2-0005	1000	5	5
2-0006	1000	5	5
2-0008	1000	5	5
2-0011	1000	5	5
2-0012	1000	5	5
3-0002	1000	5	5
3-0004	1000	5	5
3-0009	1000	5	5
3-0013	1000	5	5
3-0014	1000	5	5
3-0015	1000	5	5
3-0016	1000	5	5
3-0034	1000	5	5
3-0035	1000	5	5
3-0037	1000	5	5
3-0038	1000	5	5
3-0039	1000	5	5
3-0040	1000	5	5
3-0041	1000	5	5
3-0044	1000	5	5
3-0047	1000	5	5
3-0049	1000	5	5
3-0051	1000	5	5
3-0054	1000	5	5
3-0059	1000	5	5
3-0060	1000	5	5
3-0061	1000	5	5
3-0070	1000	5	5
3-0072	1000	5	5
3-0073	1000	5	5
3-0074	1000	5	5

3-0081	1000	5	5
3-0082	1000	5	5
3-0083	1000	5	5
3-0084	1000	5	5
3-0085	1000	5	5
3-0086	1000	5	5
3-0087	1000	5	5
3-0088	1000	5	5
3-0089	1000	5	5
3-0090	1000	5	5
3-0091	1000	5	5
3-0100	1000	5	5
3-0101	1000	5	5
3-0102	1000	5	5
3-0103	1000	5	5
3-0114	1000	5	5
3-0115	1000	5	5
3-0117	1000	5	5
3-0118	1000	5	5
3-0119	1000	5	5
3-0120	1000	5	5
3-0121	1000	5	5
3-0124	1000	5	5
3-0125	1000	5	5
3-0126	1000	5	5
3-0127	1000	5	5
3-0128	1000	5	5
3-0129	1000	5	5
3-0130	1000	5	5
3-0131	1000	5	5
3-0134	1000	5	5
3-0135	1000	5	5
3-0137	1000	5	5
3-0139	1000	5	5
3-0144	1000	5	5
3-0153	1000	5	5
3-0156	1000	5	5
3-0160	1000	5	5
3-0173	1000	5	5
3-0174	1000	5	5
3-0176	1000	5	5
3-0177	1000	5	5
3-0178	1000	5	5

3-0180	1000	5	5
4-0001	1000	5	5
4-0002	1000	5	5
4-0005	1000	5	5
4-0007	1000	5	5
4-0008	1000	5	5
5-0001	1000	5	5
5-0002	1000	5	5
5-0003	1000	5	5
5-0005	1000	5	5
5-0006	1000	5	5
5-0007	1000	5	5
6-0003	1000	5	5
6-0004	1000	5	5
7-0004	1000	5	5
7-0006	1000	5	5
7-0008	1000	5	5
7-0009	1000	5	5
8-0001	1000	5	5
8-0012	1000	5	5
9-0001	1000	5	5
9-0003	1000	5	5
9-0005	1000	5	5
9-0006	1000	5	5
9-0008	1000	5	5
10-0002	1000	5	4
10-0003	1000	5	5
10-0004	1000	5	5
10-0005	1000	5	5
10-0006	1000	5	5
10-0008	1000	5	5
10-0009	1000	5	5
10-0011	1000	5	5
10-0012	1000	5	5
10-0013	1000	5	5
10-0014	1000	5	5
10-0015	1000	5	5
10-0016	1000	5	5
10-0017	1000	5	5
10-0018	1000	5	5

<应用实施例 2>通过山地田间土壤处理测试除草作用

将山地田间土壤填充到 80 cm² 的塑料罐中。播种 *Echinochloa crus-galli* (L.) Beauv. var. *crus-galli* 和狗尾草(*Setaria viridis* (L.) Beauv.)的种子, 然后用相同土壤覆盖。用水将依据制剂 1 制备的可湿性粉剂稀释, 使用小的喷雾器将其以 1,000 升/1 公顷的量均匀地喷雾到土壤表面上, 这样每种活性组分的量为 1,000 g /1 公顷。然后在温室中培育, 依据表 21 所示的标准, 在从处理开始的第 21 天测定每种可湿性粉剂的除草作用。结果如表 23 所示。

表 23

化合物序号	活性组分(g/ha)	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) Beauv. Var. <i>crus-galli</i>	狗尾草
1-0001	1000	5	5
1-0002	1000	5	5
1-0003	1000	5	5
1-0004	1000	5	5
1-0005	1000	5	5
1-0006	1000	5	4
2-0001	1000	5	5
2-0003	1000	5	5
2-0004	1000	5	5
2-0005	1000	5	5
2-0006	1000	5	4
2-0007	1000	4	4
2-0008	1000	5	5
2-0011	1000	5	4
2-0012	1000	5	5
3-0002	1000	5	5
3-0004	1000	5	5
3-0006	1000	4	4
3-0008	1000	5	5
3-0009	1000	5	5
3-0012	1000	5	5
3-0013	1000	5	5
3-0015	1000	5	5
3-0016	1000	5	5
3-0017	1000	5	5
3-0018	1000	5	5

3-0019	1000	5	5
3-0020	1000	5	5
3-0034	1000	5	5
3-0035	1000	5	5
3-0036	1000	5	5
3-0037	1000	5	5
3-0038	1000	5	5
3-0039	1000	5	5
3-0040	1000	5	5
3-0041	1000	5	5
3-0043	1000	5	5
3-0044	1000	5	5
3-0047	1000	5	5
3-0048	1000	5	5
3-0049	1000	5	5
3-0050	1000	5	5
3-0053	1000	5	5
3-0054	1000	5	5
3-0054	1000	5	5
3-0056	1000	5	5
3-0059	1000	5	5
3-0060	1000	5	5
3-0063	1000	5	5
3-0070	1000	4	4
3-0072	1000	5	5
3-0073	1000	5	5
3-0074	1000	5	5
3-0081	1000	5	5
3-0082	1000	5	5
3-0083	1000	5	5
3-0084	1000	5	5
3-0085	1000	5	5
3-0086	1000	5	5
3-0087	1000	5	5
3-0088	1000	5	4
3-0091	1000	5	5
3-0114	1000	5	5
3-0115	1000	5	5
3-0117	1000	5	5
3-0118	1000	5	5
3-0119	1000	5	5
3-0120	1000	5	5
3-0121	1000	5	5

3-0124	1000	5	5
3-0125	1000	5	5
3-0126	1000	5	5
3-0127	1000	5	5
3-0128	1000	5	5
3-0129	1000	5	5
3-0130	1000	5	5
3-0131	1000	5	5
3-0134	1000	5	5
3-0135	1000	5	5
3-0136	1000	5	5
3-0137	1000	5	5
3-0138	1000	4	5
3-0139	1000	5	5
3-0142	1000	5	5
3-0143	1000	5	5
3-0144	1000	5	5
3-0153	1000	5	5
3-0156	1000	5	5
3-0173	1000	5	5
3-0174	1000	5	5
3-0180	1000	5	5
4-0001	1000	5	5
4-0001	1000	4	3
4-0002	1000	5	5
4-0005	1000	5	5
4-0006	1000	5	5
4-0007	1000	5	5
4-0008	1000	5	5
5-0001	1000	5	5
5-0002	1000	5	5
5-0003	1000	5	5
5-0005	1000	5	4
5-0006	1000	5	5
5-0007	1000	5	5
6-0001	1000	5	5
6-0003	1000	5	5
6-0004	1000	5	5
7-0002	1000	5	5
7-0004	1000	5	4
7-0006	1000	5	5
7-0007	1000	5	4
7-0008	1000	5	5

7-0009	1000	5	5
8-0001	1000	5	5
8-0004	1000	5	5
8-0005	1000	5	4
8-0007	1000	5	5
9-0001	1000	5	5
9-0005	1000	5	4
9-0006	1000	5	4
9-0007	1000	4	4
9-0008	1000	5	5
10-0003	1000	5	5
10-0004	1000	5	5
10-0005	1000	5	5
10-0006	1000	5	4
10-0009	1000	5	5
10-0012	1000	5	4
10-0013	1000	5	5
10-0014	1000	5	5
10-0015	1000	5	5
10-0016	1000	5	4
10-0017	1000	5	5
10-0018	1000	5	5

<应用实施例 3>通过山地田间土壤处理测试除草作用

将山地田间土壤填充到 80 cm² 的塑料罐中。播种 *Echinochloa crus-galli* (L.) Beauv. var. *crus-galli* 和狗尾草的种子。在温室中培育 2 周。用水将依据制剂 1 制备的可湿性粉剂稀释，使用小的喷雾器将其以 1,000 升/1 公顷的量喷雾到植物的全叶上，这样每种活性组分的量为 1,000 g /1 公顷。然后在温室中培育，依据表 21 所示的标准，在从处理开始的第 14 天测定每种可湿性粉剂的除草作用。结果如表 24 所示。

表 24

化合物序号	活性组分 (g/ha)	<i>Echinochloa</i> <i>curs-galli</i> (L.) Beauv. Var. <i>crus-galli</i>	狗尾草
1-0001	1000	5	4

1-0004	1000	5	4
2-0001	1000	5	4
2-0003	1000	5	4
2-0004	1000	5	4
2-0008	1000	5	5
2-0011	1000	5	4
3-0008	1000	4	4
3-0010	1000	5	4
3-0011	1000	5	4
3-0013	1000	5	5
3-0015	1000	5	4
3-0035	1000	4	4
3-0036	1000	4	4
3-0037	1000	5	4
3-0038	1000	5	5
3-0039	1000	5	5
3-0044	1000	5	4
3-0049	1000	4	4
3-0073	1000	5	4
3-0074	1000	5	4
3-0076	1000	5	4
3-0077	1000	5	4
3-0081	1000	4	4
3-0082	1000	4	4
3-0083	1000	4	4
3-0084	1000	4	4
3-0085	1000	4	4
3-0086	1000	4	4
3-0092	1000	4	4
3-0104	1000	5	4
3-0105	1000	5	4
3-0106	1000	5	4
3-0107	1000	5	5
3-0115	1000	5	4
3-0118	1000	5	4
3-0119	1000	5	4
3-0120	1000	5	5
3-0144	1000	5	5
4-0002	1000	5	4
4-0005	1000	5	4
5-0001	1000	5	4
5-0002	1000	5	5
5-0003	1000	5	4

5-0007	1000	5	5
6-0004	1000	5	4
7-0008	1000	5	5
7-0009	1000	4	4
8-0001	1000	5	4
9-0001	1000	4	4
9-0005	1000	4	4
9-0008	1000	4	4

工业实用性

本发明的通式[I]化合物在从发芽到生长的长时间内对在高地田间引起问题的各种杂草表现出优良的除草作用，所述杂草有例如阔叶杂草[例如酸模叶蓼(*Polygonum lapathifolium* L.) subsp. *nodosum* (Pers.) Kitam.、皱果莧(*Amaranthus viridis* L.)、藜(*Chenopodium album* L.)、繁缕(*Stellaria media* (L.) Villars、苘麻(*Abutilon theophrasti* Medik.)、*Sida spinosa*、*Sesbaria exaltata*、番薯属(*ipomoea* spp.)和苍耳属(*Xanthium strumarium* L.)]、多年生或一年生的莎草科杂草[例如香附子(*Cyperus rotundus* L.)、*Cyperus esculentus*、短叶水蜈蚣(*Kyllinga brevifolia* Rottb.) subsp. *leiolepis* (Fraxch. et Savat.) T. Koyama、具芒碎米莎草(*Cyperus microiria* Steud.)和碎米莎草(*Cyperus iria* L.)]和禾本科杂草[例如 *Echinochloa crus-galli* (L.) Beauv. var. *crus-galli*、升马唐(*Digitaria ciliaris* (Retz.) Koeler)、狗尾草(*Setaria viridis* (L.) Beauv.)、早熟禾(*Poa annua* L.)、石茅(*Sorghum halepense* (L.) Pers.)、看麦娘(*Alopecurus aequalis* Sobol.) var. *amurensis* (Komar.) Ohwi 和乌麦(*Avena fatua* L.)]。此外，本发明化合物还对在稻田中出现的杂草表现出除草作用，这样的杂草是一年生杂草[例如 *Echinochloa oryzicola* Vasing.、异型莎草(*Cyperus difformis* L.)、鸭舌草(*Monochoria vaginalis*) (Burm. f.) Presl. var. *plantaginea* (Roxb.) Solms-Laub.和陌上菜(*Lindernia procumbens*)]和多年生的杂草[例如野慈菇(*Sagittaria trifolia* L.)、矮慈菇(*Sagittaria pygmaea* Miq.)、*Cyperus serotinus* Rottb.、*Eleocharis kuroguwai* Ohwi 和萤蔺(*Scirpus*

juncoides) Roxb. subsp. hotarui (Ohwi) T. Koyama、窄叶泽泻(*Alisma canaliculatum*)].

本发明除草剂还对农作物，特别是稻、小麦、大麦、玉米、高粱、大豆、棉花、甜菜等表现出高度安全性。