

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2004-511538

(P2004-511538A)

(43) 公表日 平成16年4月15日(2004.4.15)

(51) Int. Cl.⁷

C07C 233/66

AO1N 37/22

AO1N 43/40

AO1N 43/56

AO1N 53/08

F I

C07C 233/66

AO1N 37/22

AO1N 43/40

AO1N 43/56

AO1N 63/02

1 O 1

1 O 1 J

C

G

テーマコード (参考)

4 C O 2 3

4 H O O 6

4 H O 1 1

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 226 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2002-536040 (P2002-536040)
 (86) (22) 出願日 平成13年10月11日 (2001.10.11)
 (85) 翻訳文提出日 平成14年6月14日 (2002.6.14)
 (86) 国際出願番号 PCT/US2001/042632
 (87) 国際公開番号 W02002/032856
 (87) 国際公開日 平成14年4月25日 (2002.4.25)
 (31) 優先権主張番号 60/240,890
 (32) 優先日 平成12年10月17日 (2000.10.17)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)
 (31) 優先権主張番号 60/323,833
 (32) 優先日 平成13年9月21日 (2001.9.21)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

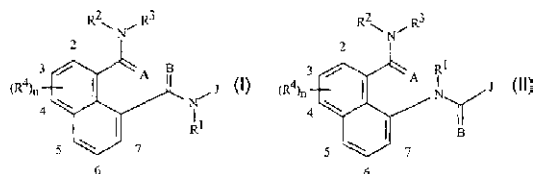
(71) 出願人 390023674
 イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・
 アンド・カンパニー
 E. I. DU PONT DE NEMO
 URS AND COMPANY
 アメリカ合衆国、デラウェア州、ウイリミ
 ントン、マーケット・ストリート 100
 7
 (74) 代理人 100060782
 弁理士 小田島 平吉
 (72) 発明者 セルビー, トーマス・ポール
 アメリカ合衆国デラウェア州19808ウ
 イルミントン・ハンターコート116

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺昆虫性1, 8-ナフトレンジカルボキサミド類

(57) 【要約】

無脊椎有害生物を抑制するために有用な式 I および式 I I の化合物、並びにそれらのN-オキシド類および農業的に適する塩類が開示されている。式 (I)、式 (I I) において、A、B、J、R¹、R²、R³、R⁴、およびnは開示中で定義されている通りである。式 I または式 I I の化合物を含んでなる組成物並びに無脊椎有害生物またはそれらの環境に有効量の式 (I) または式 (I I) の化合物を接触させることを包含する無脊椎有害生物の抑制方法も開示される。

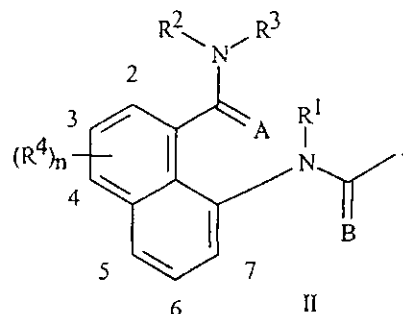
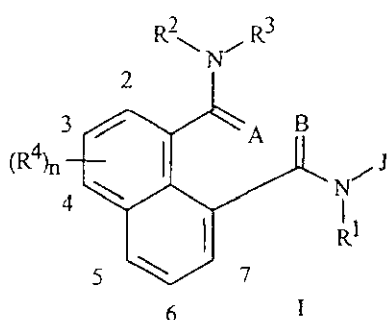


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I または式 II

【化 1】



10

〔式中、

各 J は独立してフェニル環、ナフチル環系、5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環または芳香族8-、9-もしくは10-員の縮合ヘテロ二環式環系であり、ここで各環または環系は場合により1~5個のR⁵で置換されていてもよく、

AおよびBは独立してOまたはSであり、

nは0~4であり、

20

R¹はH、または各々が場合によりハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニル、C₁-C₄アルキルスルホニル、C₂-C₄アルコキシカルボニル、C₁-C₄アルキルアミノ、C₂-C₈ジアルキルアミノおよびC₃-C₆シクロアルキルアミノよりなる群から選択される1個もしくはそれ以上の置換基で置換されていてもよいC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニルもしくはC₃-C₆シクロアルキルであり、或いはR¹はC₂-C₆アルキルカルボニル、C₂-C₆アルコキシカルボニル、C₂-C₆アルキルアミノカルボニルまたはC₃-C₈ジアルキルアミノカルボニルであり、R²はH、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄アルキルアミノ、C₂-C₈ジアルキルアミノ、C₃-C₆シクロアルキルアミノ、C₂-C₆アルコキシカルボニルまたはC₂-C₆アルキルカルボニルであり、

30

R³はH、または各々が場合によりハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルおよびC₁-C₄アルキルスルホニルよりなる群から選択される1個もしくはそれ以上の置換基で置換されていてもよいC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニルもしくはC₃-C₆シクロアルキルであり、或いは

R²およびR³はそれらが結合している窒素と一緒に2~6個の炭素原子および場合により窒素、硫黄または酸素の1個の追加原子を含有する環を形成し、該環は場合によりC₁-C₂アルキル、ハロゲン、CN、NO₂およびC₁-C₂アルコキシよりなる群から選択される1~4個の置換基で置換されていてもよく、そして

40

各R⁴および各R⁵は独立してH、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₆ハロアルキル、C₂-C₆ハロアルケニル、C₂-C₆ハロアルキニル、C₃-C₆ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、CO₂H、CONH₂、NO₂、ヒドロキシ、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄ハロアルコキシ、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニル、C₁-C₄アルキルスルホニル、C₁-C₄ハロアルキルチオ、C₁-C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₄ハロアルキルスルホニル、C₂-C₄アルコキシカルボニル、C₁-C₄アルキルアミノ、C₂-C₈ジアルキルアミノ、C₃-C₆シクロアルキルアミノ、C₂-C₆アルキルカルボニル、C₂-C₆アルコキシカルボニル、C₂-C₆アルキルアミ

50

ノカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、または $C_3 - C_6$ トリアルキルシリルであり、或いは

各 R^4 および各 R^5 は独立してフェニル、ベンジル、フェノキシ、5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環または芳香族8-、9-もしくは10-員の縮合ヘテロ二環式環系であり、各環は場合により $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ (アルキル)シクロアルキルアミノ、 $C_2 - C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 - C_6$ トリアルキルシリルよりなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、或いは

10

(R^5)₂ は隣接炭素原子と結合される場合には一緒になって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ または $-OCF_2CF_2O-$ であることができる]

から選択される化合物、並びにそのN-オキシド類および農業的に適する塩類。

【請求項2】

A および B が両者とも O であり、

R^1 が H、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニルであり、そして

20

n が 0 ~ 2 である、

請求項1の式Iの化合物。

【請求項3】

A および B が両者とも O であり、

R^1 が H、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニルであり、そして

30

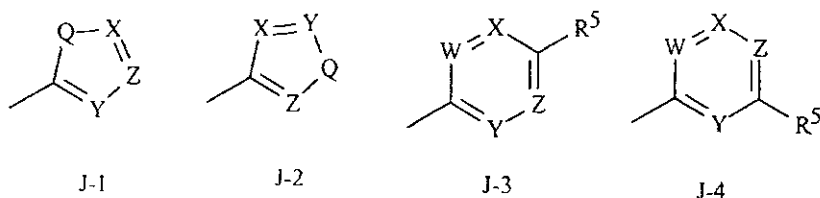
n が 0 ~ 2 である、

請求項1の式IIの化合物。

【請求項4】

J がフェニル環または J-1、J-2、J-3 および J-4

【化2】



40

よりなる群から選択される5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環であり、各J環は場合により1~3個の R^5 で置換されていてもよく、

QがO、Sまたは NR^5 であり、

W、X、YおよびZが独立してNまたは CR^5 であり、但しJ-3およびJ-4においてW、X、YおよびZの少なくとも1個はNであり、

R^2 が H、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニルであり、

R^3 が各々が場合によりハロゲン、CN、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ アルキルチ

50

オ、 $C_1 - C_2$ アルキルスルフィニルおよび $C_1 - C_2$ アルキルスルホニルよりなる群から選択される 1 個もしくはそれ以上の置換基で置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニルまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、

1 個の R^4 基がナフチル環系に対して 2-位置または 7-位置で結合され、そして該 R^4 が $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

各 R^5 が独立して H 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニルまたは $C_2 - C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニルであり、
或いは

各 R^5 が独立してフェニル、ベンジルまたは 5-もしくは 6-員のヘテロ芳香族環であり、各環は場合により $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ (アルキル) シクロアルキルアミノ、 $C_2 - C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 - C_6$ トリアルキルシリルで置換されていてもよく、或いは

(R^5)₂ が隣接炭素原子と結合される場合には一緒になって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ または $-OCF_2CF_2O-$ であることができ、そして

n が 1 ~ 2 である、

請求項 2 または請求項 3 の化合物。

【請求項 5】

R^2 が H であり、 R^3 が $C_1 - C_4$ アルキルであり、そして R^5 置換基の少なくとも 1 個が $NR^1C(=B)$ 部分に対してオルトである請求項 4 の式 I の化合物。

【請求項 6】

R^3 がメチルである請求項 5 の化合物。

【請求項 7】

R^1 が H または $C_1 - C_4$ アルキルであり、

R^2 が H または $C_1 - C_4$ アルキルであり、

R^3 が場合によりハロゲン、 CN 、 OCH_3 、または $S(O)_pCH_3$ で置換されていてもよい $C_1 - C_4$ アルキルであり、

1 個の R^5 が $C(=B)NR^1$ 部分に対してオルト位置で J に結合され、そして

該 R^5 が $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニルもしくは $C_2 - C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、またはフェニル、ベンジル、または 5-もしくは 6-員のヘテロ芳香族環であり、各環は場合によりハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシまたは $C_1 - C_4$ ハロアルコキシで置換されていてもよく、

そして場合により存在する第二の R^5 基が独立して $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロ

10

20

30

40

50

アルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁－C₄アルコキシ、C₁－C₄ハロアルコキシ、C₁－C₄アルキルチオ、C₁－C₄アルキルスルフィニル、C₁－C₄アルキルスルホニル、C₁－C₄ハロアルキルチオ、C₁－C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁－C₄ハロアルキルスルホニもしくはC₂－C₄アルコキシカルボニル、C₃－C₈ジアルキルアミノカルボニル、またはフェニル、ベンジル、または5－もしくは6－員のヘテロ芳香族環であり、各環は場合によりハロゲン、CN、NO₂、C₁－C₄アルキル、C₂－C₄アルケニル、C₂－C₄アルキニル、C₃－C₆シクロアルキル、C₁－C₄ハロアルキル、C₁－C₄アルコキシまたはC₁－C₄ハロアルコキシで置換されているいてもよい、

請求項4の式I Iの化合物。

10

【請求項7】

Jがフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンであり、各々がC(=B)NR¹部分に対してオルト位置でJに結合された1個のR⁵および場合により存在する第二のR⁵で置換されている請求項6の化合物。

【請求項8】

R¹およびR²が各々Hであり、

1個のR⁴がNR¹C(=X)J部分に対してオルトである7－位置で結合されておりそしてC₁－C₃アルキル、CF₃、OCF₃、OCHF₂、S(O)_pCF₃、S(O)_pCHF₂およびハロゲンよりなる群から選択されそして場合により存在する第二のR⁴はNR¹C(=X)J部分に対してパラである5－位置で結合されておりそしてハロゲン、C₁－C₃アルキルおよびC₁－C₃ハロアルキルよりなる群から選択される、

20

請求項7の化合物。

【請求項9】

JがJ－1であり、

QがNR^{5a}であり、

XがNまたはCHであり、

YがCHであり、

ZがCR^{5b}であり、

R^{5a}がハロゲン、C₁－C₄アルキル、C₁－C₄ハロアルキルまたはC₁－C₄ハロアルコキシよりなる群から選択される1個もしくは2個の置換基で置換されたフェニルまたは2－ピリジル環であり、そして

30

R^{5b}がハロゲンまたはCF₃である、

請求項8の化合物。

【請求項10】

N－メチル－N'－(2－ブロモ－4－フルオロフェニル)－1, 8－ナフタレンジカルボキサミド、

N－メチル8－[(3, 4－ジフルオロフェニル)カルボニルアミノ]－1－ナフタレンカルボキサミドおよび

N－メチル8－[(2－チエニル)カルボニルアミノ]－1－ナフタレンカルボキサミドよりなる群から選択される請求項1の化合物。

40

【請求項11】

生物学的に有効な量の請求項1の化合物および界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤の少なくとも1種を含んでなる無脊椎有害生物を抑制するための組成物。

【請求項12】

有効な量の少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤をさらに含んでなる請求項11の組成物。

【請求項13】

少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤がピレスロイド類、カルバメート類、ネオニコチノイド類、神経ナトリウムチャネル遮断剤、殺昆虫性大環式ラクトン類、γ－アミノ酪酸(GABA)拮抗物質、殺昆虫性ウレア類および幼若ホルモン模倣体

50

(m i m i c) よりなる群の殺節足動物剤から選択される請求項 1 2 の組成物。

【請求項 1 4】

少なくとも 1 種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤がアバメクチン (a b a m e c t i n)、アセフェート (a c e p h a t e)、アセタミプリド (a c e t a m i p r i d)、アベルメクチン (a v e r m e c t i n)、アザジラクチン (a z a d i r a c h t i n)、アジンフォス-メチル (a z i n p h o s - m e t h y l)、ビフェンスリン (b i f e n t h r i n)、ビンフェナゼート (b i n f e n a z a t e)、ブプロフェジン (b u p r o f e z i n)、カルボフラン (c a r b o f u r a n)、クロルフェナピル (c h l o r f e n a p y r)、クロルフルアズロン (c h l o r f l u a z u r o n)、クロルピリフォス (c h l o r p y r i f o s)、クロルピリフォス-メチル (c h l o r p y r i f o s - m e t h y l)、クロマフェノジド (c h r o m a f e n o z i d e)、クロチアニジン (c l o t h i a n i d i n)、シフルスリン (c y f l u t h r i n)、ベータ-シフルスリン (b e t a - c y f l u t h r i n)、シハロスリン (c y y h a l o t h r i n)、ラムダーシハロスリン (l a m b d a - c y h a l o t h r i n)、シペルメスリン (c y p e r m e t h r i n)、シロマジン (c y r o m a z i n e)、デルタメスリン (d e l t a m e t h r i n)、ジアフェンチウロン (d i a f e n t h i u r o n)、ジアジノン (d i a z i n o n)、ジフルベンズロン (d i f l u b e n z u r o n)、ジメトエート (d i m e t h o a t e)、ジオフェノラン (d i o f e n o l a n)、エマメクチン (e m a m e c t i n)、エンドスルファン (e n d o s u l f a n)、エスフェンヴァレレート (e s f e n v a l e r a t e)、エチプロール (e t h i p r o l e)、フェノチカルブ (f e n o t h i c a r b)、フェノキシカルブ (f e n o x y c a r b)、フェンプロパスリン (f e n p r o p a t h r i n)、フェンプロキシメート (f e n p r o x i m a t e)、フェンヴァレレート (f e n v a l e r a t e)、フィプロニル (f i p r o n i l)、フロニカミド (f l o n i c a m i d)、フルシスリネート (f l u c y t h r i n a t e)、タウ-フルヴァリネート (t a u - f l u v a l i n a t e)、フルフェノクスロン (f l u f e n o x u r o n)、フォノフォス (f o n o p h o s)、ハロフェノジド (h a l o f e n o z i d e)、ヘキサフルムロン (h e x a f l u m u r o n)、イミダクロプリド (i m i d a c l o p r i d)、インドキサカルブ (i n d o x a c a r b)、イソフェンフォス (i s o f e n p h o s)、ルフエスロン (l u f e n u r o n)、マラチオン (m a l a t h i o n)、メトアルデヒド (m e t a l d e h y d e)、メタミドフォス (m e t h a m i d o p h o s)、メチダチオン (m e t h i d a t h i o n)、メトミル (m e t h o m y l)、メトブレン (m e t h o p r e n e)、メトキシクロル (m e t h o x y c h l o r)、モノクロトフォス (m o n o c r o t o p h o s)、メトキシフェノジド (m e t h o x y f e n o z i d e)、ニチアジン (n i t h i a z i n)、ノヴァルロン (n o v a l u r o n)、オキサミル (o x a m y l)、パラチオン (p a r a t h i o n)、パラチオン-メチル (p a r a t h i o n - m e t h y l)、ペルメスリン (p e r m e t h r i n)、フォレート (p h o r a t e)、フォサロン (p h o s a l o n e)、フォスメット (p h o s m e t)、フォスファミドン (p h o s p h a m i d o n)、ピリミカルブ (p i r i m i c a r b)、プロフェノフォス (p r o f e n o f o s)、ピメトロジン (p y m e t r o z i n e)、ピリダリル (p y r i d a l y l)、ピリプロキシフェン (p y r i p r o x y f e n)、ロテノン (r o t e n o n e)、スピノサド (s p i n o s a d)、スルプロフォス (s u l p r o f o s)、テブフェノジド (t e b u f e n o z i d e)、テフルベンズロン (t e f l u b e n z u r o n)、テフルスリン (t e f l u t h r i n)、テルブフォス (t e r b u f o s)、テトラクロルヴィンフォス (t e t r a c h l o r v i n p h o s)、チアクロプリド (t h i a c l o p r i d)、チアメトキサム (t h i a m e t h o x a m)、チオジカルブ (t h i o d i c a r b)、チオスルタプ-ナトリウム (t h i o s u l t a p - s o d i u m)、トラロメスリン (t r a l o m e t h r i n)、トリクロルフォン (t r i c h l o r f o n) およびトリフルムロン (t r i f l u m u r o n)、アルジカルブ (a l d i

carb)、オキサミル(oxamyl)、フェナミフォス(fenamiphos)、アミトラズ(amitraz)、キノメチオナト(chinomethionat)、クロロベンジレート(chlorobenzilate)、シヘキサチン(cyhexatin)、ジコフォル(dicofol)、ジエノクロル(dienochlor)、エトキサゾール(etoxazole)、フェナザクイン(fenazaquin)、フェンブタチンオキシド(fenbutatin oxide)、フェンプロパスリン(fenpropathrin)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、ヘキシチアゾックス(hexythiazox)、プロパルガイト(propargite)、ピリダベン(pyridaben)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、バシルス・スリンジエンシス(Bacillus thuringiensis)、バシルス・スリンジエンシス・デルタ・エンドトキシン(Bacillus thuringiensis delta endotoxin)、バクロウイルス(baculovirus)、並びに昆虫病原性バクテリア、ウイルスおよび真菌よりなる群中の殺昆虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤または生物学的薬剤から選択される請求項12の組成物。

10

【請求項15】

少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤がシペルメスリン、シハロスリン、シフルスリン、ベーターシフルスリン、エスフェンヴァレレート、フェンヴァレレート、トラロメスリン、フェノチカルブ、メトミル、オキサミル、チオジカルブ、クロチアニジン、イミダクロプリド、チアクロプリド、インドキサカルブ、スピノサド、アバメクチン、アベルメクチン、エマメクチン、エンドスルファン、エチプロール、フィプロニル、フルフェンノクスロン、トリフルムロン、ジオフェノラン、ピリプロキシフェン、ピメトロジン、アミトラズ、バシルス・スリンジエンシス、バシルス・スリンジエンシス・デルタ・エンドトキシンおよび昆虫病原性真菌よりなる群から選択される請求項14の組成物。

20

【請求項16】

無脊椎有害生物またはその環境に生物学的に有効な量の請求項1の化合物または請求項11の組成物を接触させることを含んでなる無脊椎有害生物の抑制方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

発明の背景

本発明は、ある種の1, 8-ナフタレンジカルボキサミド類、それらの農業的に適する塩類および組成物、並びに農耕および非農耕環境の両方で無脊椎有害生物を抑制するためのそれらの使用に関する。

30

【0002】

無脊椎有害生物の抑制は高い栽培作物効率を得る際に非常に重要である。成育しているおよび貯蔵された農耕栽培作物に対する無脊椎有害生物による被害は生産量の有意な減少をもたらす。そしてそれにより消費者に対して価格上昇をもたらす。林業、温室栽培作物、装飾品、養成栽培作物、貯蔵食品および繊維製品、家畜、家財、並びに公衆および動物の健康における無脊椎有害生物の抑制も重要である。多くの製品がこれらの目的のために市販されているが、より有効であり、より安価であり、より毒性が少なく、環境的により安全であり、または異なる作用方式を有する新規な化合物に対する要望が持続している。

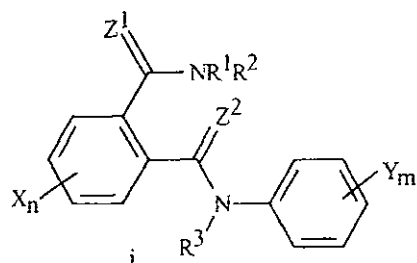
40

【0003】

EP919542は殺昆虫剤として式i

【0004】

【化3】



【0005】

[式中、とりわけ、 Z^1 および Z^2 はOまたはSであり、そして R^1 、 R^2 および R^3 は 10
、とりわけ、H、アルキルまたは置換されたアルキルである]
のフタル酸ジアミド類を開示している。

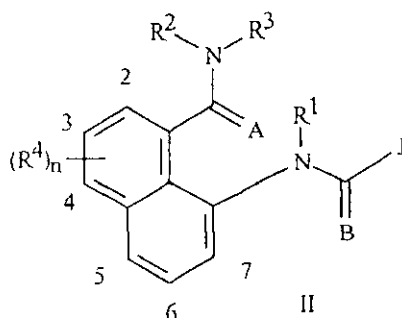
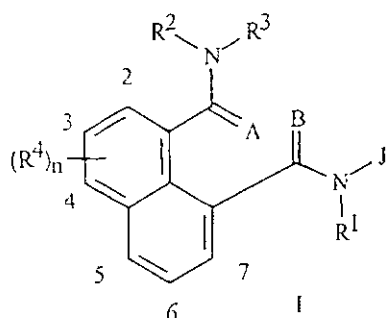
【0006】

発明の要旨

本発明は、全ての幾何学および立体異性体、N-オキシド類並びに農業的に適する塩類
を包含する式 I および式 II の化合物に関する：

【0007】

【化4】



20

【0008】

[式中、 30
各Jは独立してフェニル環、ナフチル環系、5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環または
芳香族8-、9-もしくは10-員の縮合ヘテロ二環式環系であり、ここで各環または環
系は場合により1~5個の R^5 で置換されていてもよく、
AおよびBは独立してOまたはSであり、
nは0~4であり、

R^1 はH、または各々が場合によりハロゲン、CN、 NO_2 、ヒドロキシ、 C_1-C_4 ア
ルコキシ、 C_1-C_4 アルキルチオ、 C_1-C_4 アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 アル
キルスルホニル、 C_2-C_4 アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_2-C
 C_8 ジアルキルアミノおよび C_3-C_6 シクロアルキルアミノよりなる群から選択される
1個もしくはそれ以上の置換基で置換されていてもよい C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 40
アルケニル、 C_2-C_6 アルキニルもしくは C_3-C_6 シクロアルキルであり、或いは
 R^1 は C_2-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 ア
ルキルアミノカルボニルまたは C_3-C_8 ジアルキルアミノカルボニルであり、 R^2 はH
、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、 C_3-C_6 シク
ロアルキル、 C_1-C_4 アルコキシ、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_2-C_8 ジアルキル
アミノ、 C_3-C_6 シクロアルキルアミノ、 C_2-C_6 アルコキシカルボニルまたは C_2
 C_6 アルキルカルボニルであり、

R^3 はH、または各々が場合によりハロゲン、CN、 NO_2 、ヒドロキシ、 C_1-C_4 ア
ルコキシ、 C_1-C_4 アルキルチオ、 C_1-C_4 アルキルスルフィニルおよび C_1-C_4
アルキルスルホニルよりなる群から選択される1個もしくはそれ以上の置換基で置換され 50

ていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニルもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、或いは R^2 および R^3 はそれらが結合している窒素と一緒にあって 2 ～ 6 個の炭素原子および場合により窒素、硫黄または酸素の 1 個の追加原子を含有する環を形成し、該環は場合により $C_1 - C_2$ アルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 および $C_1 - C_2$ アルコキシよりなる群から選択される 1 ～ 4 個の置換基で置換されていてもよく、そして

各 R^4 および各 R^5 は独立して H、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 - C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 - C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、または $C_3 - C_6$ トリアルキルシリルであり、或いは

各 R^4 および各 R^5 は独立してフェニル、ベンジル、フェノキシ、5-もしくは 6-員のヘテロ芳香族環または芳香族 8-、9-もしくは 10-員の縮合ヘテロ二環式環系であり、各環は場合により $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ (アルキル) シクロアルキルアミノ、 $C_2 - C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 - C_6$ トリアルキルシリルよりなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよく、或いは

(R^5)₂ は隣接炭素原子と結合される場合には一緒にあって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ または $-OCF_2CF_2O-$ であることができる]。

【0009】

本発明はまた、生物学的に有効な量の式 I または式 I I の化合物並びに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤よりなる群から選択される少なくとも 1 種の追加成分を含んでなる無脊椎有害生物を抑制するための組成物にも関する。本発明はまた、生物学的に有効な量の式 I または式 I I の化合物および有効な量の少なくとも 1 種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤を含んでなる組成物にも関する。

【0010】

本発明はまた、無脊椎有害生物またはその環境に生物学的に有効な量の式 I または式 I I の化合物（例えば、ここに記載されている組成物として）を接触させることを含んでなる無脊椎有害生物の抑制方法にも関する。本発明はまた、無脊椎有害生物を抑制するための無脊椎有害生物またはその環境に生物学的に有効な量の式 I または式 I I の化合物を含んでなる組成物または生物学的に有効な量の式 I または式 I I の化合物および有効な量の少なくとも 1 種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤を含んでなる組成物を接触させる方法にも関する。

【0011】

発明の詳細

以上の記述で、単独でまたは例えば「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」の如き複合語の中で使用される用語「アルキル」は直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、または種々のブチル、ペンチルもしくは

10

20

30

40

50

ヘキシル異性体を包含する。「アルケニル」は直鎖状もしくは分枝鎖状のアルケン類、例えば1-プロペニル、2-プロペニル、並びに種々のブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体を包含する。「アルケニル」はポリエン類、例えば1, 2-プロパンジエニルおよび2, 4-ヘキサジエニルも包含する。「アルキニル」は直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキン類、例えば1-プロピニル、2-プロピニル並びに種々のブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体を包含する。「アルキニル」は複数の三重結合を含む部分、例えば2, 5-ヘキサジイニル、も包含できる。「アルコキシ」は、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、イソプロピルオキシ並びに種々のブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体を包含する。「アルキルチオ」は分枝鎖状もしくは直鎖状のアルキルチオ部分、例えばメチルチオ、エチルチオ、並びに種々のプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体を包含する。「シクロアルキル」は、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルを包含する。「アルキルアミノ」、「アルケニルチオ」、「アルケニルスルフィニル」、「アルケニルスルホニル」、「アルキニルチオ」、「アルキニルスルフィニル」、「アルキニルスルホニル」などは以上の例と同様に定義される。「アルコキシカルボニル」の例は $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ および種々のブトキシ-またはペントキシカルボニル異性体を包含する。「アルキルアミノカルボニル」の例は $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ および種々のブチルアミノ-またはペンチルアミノカルボニル異性体を包含する。用語「ジアルキルアミノ」は同一もしくは相異なりうる2個のアルキル基で置換されたアミノ官能基を包含する。「ジアルキルアミノカルボニル」は同様に定義され、そして例は $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NCH}_2\text{C}(=\text{O})$ を包含する。

10

20

30

40

【0012】

用語「複素環式環」または「複素環式環系」は、少なくとも1個の環原子が炭素でなく且つ窒素、酸素および硫黄よりなる群から独立して選択される1~4個のヘテロ原子を含んでなるが、但し条件として各複素環式環が4個より多い窒素、2個より多い酸素および2個より多い硫黄を含有しない環または環系を示す。複素環式環は利用可能な炭素または窒素を介して該炭素または窒素上の水素の置換により結合できる。用語「芳香族環系」は、多環式環系が芳香族性である完全に不飽和の炭素環および複素環を示す（ここで芳香族性はヒュッケル則が環系に関して満たされることを示す）。用語「ヘテロ芳香族環」は、少なくとも1個の環原子が炭素でなく且つ窒素、酸素および硫黄よりなる群から独立して選択される1~4個のヘテロ原子を含んでなるが、但し条件として各複素環式環が4個より多い窒素、2個より多い酸素および2個より多い硫黄を含有しない完全に芳香族性の環を示す（ここで芳香族性はヒュッケル則が環系に関して満たされることを示す）。複素環式環は利用可能な炭素または窒素を介して該炭素または窒素上の水素の置換により結合できる。用語「芳香族複素環式環系」は完全に芳香族性の複素環および多環式環系の少なくとも1個の環が芳香族性である複素環を包含する（ここで芳香族性はヒュッケル則が環系に関して満たされることを示す）。用語「縮合されたヘテロ二環式環系」は、少なくとも1個の環原子が炭素でなく且つ以上で定義したような芳香族性または非芳香族性でありうる2個の縮合環から構成される環系を包含する。

【0013】

単独でまたは例えば「ハロアルキル」の如き複合語の中の用語「ハロゲン」は弗素、塩素、臭素またはヨウ素を包含する。さらに、例えば「ハロアルキル」の如き複合語の中で使用される場合には、該アルキルは同一もしくは相異なりうるハロゲン原子で部分的にまたは完全に置換されうる。「ハロアルキル」の例は F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 および CF_3CCl_2 を包含する。用語「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」、「ハロアルコキシ」などは用語「ハロアルキル」と同様に定義される。「ハロアルケニル」の例は $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ を包含する。「ハロアルキニル」の例は $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ および $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{C}$

50

CH₂ を包含する。「ハロアルコキシ」の例はCF₃O、CCl₃CH₂O、HCF₂CH₂CH₂OおよびCF₃CH₂Oを包含する。

【0014】

置換基中の合計炭素数は「C_i - C_j」接頭辞により示され、ここでiおよびjは1～6の数である。例えば、C₁ - C₃ アルキルスルホニルはメチルスルホニルないしプロピルスルホニルを示し、C₂ アルコキシアルキルはCH₃OCH₂を示し、C₃ アルコキシアルキルは、例えば、CH₃CH(OCH₃)、CH₃OCH₂CH₂またはCH₃CH₂OCH₂を示し、そしてC₄ アルコキシアルキルは合計炭素数が4のアルコキシ基で置換されたアルキルの種々の異性体を示し、例はCH₃CH₂CH₂OCH₂およびCH₃CH₂OCH₂CH₂を包含する。以上の記述で、式Iの化合物が複素環式環を含有する場合 10

【0015】

水素でありうる置換基、例えばR³、を基が含有し、この置換基が水素として組み入れられる場合には、これは該基が未置換であることと同等であると認識される。基上の場合により存在する置換基の数が0である場合には、例えばnが0である場合、これは該基が未置換であることと同等であると認識される。結合が浮動性である場合には、置換基は環上の利用可能な炭素のいずれかに対して水素の置換により結合することができ、二環式環系に関しては、1個もしくは複数の置換基は二環式環系のいずれかの環または両方の環に結合することができる。例えば、nが1である場合には、1個のR⁴置換基が式Iまたは式 20
I Iに対して指定された位置2、3、4、5、6または7で結合することができ、そしてnが2である場合には、2個の独立しているR⁴置換基は2、3、2、4、2、5、2、6または2、7位置でまたは他の2つの位置の組み合わせで置換されうる。R²およびR³がそれらが結合している窒素と一緒になって環を形成する場合には、該環は場合により該環中の利用可能な炭素または場合により存在する窒素上で置換されていてもよい。

【0016】

本発明の化合物は1種もしくはそれ以上の立体異性体として存在することができる。種々の立体異性体は、エナンチオマー類、ジアステレオマー類、アトロプ異性体および幾何学的異性体を包含する。当業者は、1種の立体異性体が、1種もしくは複数の他の立体異性体と比べて富んでいる場合にまたは1種もしくは複数の他の立体異性体から分離される場合 30
に、より活性が大きくおよび／または有利な効果を示すことは理解するであろう。さらに、当業者は該立体異性体の分離、富裕化、および／または選択的製造方法を認識する。本発明の化合物は立体異性体の混合物、個別の立体異性体、または光学的に活性な形態として存在することができる。

【0017】

本発明は、式Iまたは式I Iから選択される化合物、それらのN-オキシド類および農業的に適する塩類を包括する。当業者は、窒素はオキシドへの酸化用に利用可能な孤立対を必要とするため、必ずしも全ての窒素含有複素環がN-オキシドを形成しえないことを認識するであろうし、当業者はN-オキシドを形成しうる窒素含有複素環を認識するであろう。当業者はまた、第三級アミン類がN-オキシド類を形成しうることも認識するであろう。複素環および第三級アミンのN-オキシドの製造用の合成方法は、ペルオキシ酸類、 40
例えば過酢酸およびm-クロロ過安息香酸(MCPBA)、過酸化水素、アルキルヒドロペルオキシド類、例えばt-ブチルヒドロペルオキシド、過ホウ酸ナトリウム、並びにジオキシラン類、例えばジメチルジオキシランを用いる複素環および第三級アミン類の酸化を含めて、非常に良く知られている。N-オキシド類のこれらの製造方法は大量に記載されておりそして文献中で論評され、例えば下記のものを参照のこと：T. L. Gilchrist in Comprehensive Organic Synthesis, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in Comprehensive Heterocyclic Chemistry, vol. 3, pp 50

18-19, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 139-151, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; and G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press. 10

【0018】

本発明の化合物の塩類は、無機もしくは有機酸類、例えば臭化水素酸、塩酸、硝酸、磷酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸、との酸一付加塩類を包含する。

【0019】

合成の容易さおよび／またはより大きい殺節足動物効果を包含する理由のために好適なものは以下のものである： 20

好適1.

AおよびBが両者ともOであり、

R^1 がH、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニルであり、そして

nが0～2である、

式Iの化合物。

好適2.

AおよびBが両者ともOであり、

R^1 がH、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニルであり、そして 30

nが0～2である、

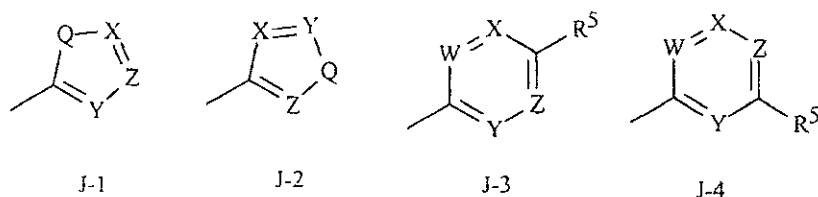
式IIの化合物。

好適3.

Jがフェニル環またはJ-1、J-2、J-3およびJ-4

【0020】

【化5】



40

【0021】

よりなる群から選択される5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環であり、各J環は場合により1～3個の R^5 で置換されていてもよく、

QがO、Sまたは NR^5 であり、

W、X、YおよびZが独立してNまたは CR^5 であり、但しJ-3およびJ-4において 50

W、X、YおよびZの少なくとも1個はNであり、

R^2 がH、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニルであり、

R^3 が各々が場合によりハロゲン、CN、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ アルキルチオ、 $C_1 - C_2$ アルキルスルフィニルおよび $C_1 - C_2$ アルキルスルホニルよりなる群から選択される1個もしくはそれ以上の置換基で置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニルまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、

1個の R^4 基がナフチル環系に対して2-位置または7-位置で結合され、そして該 R^4 が $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

各 R^5 が独立してH、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニルまたは $C_2 - C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニルであり、
或いは

各 R^5 が独立してフェニル、ベンジルまたは5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環であり、各環は場合により $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ (アルキル) シクロアルキルアミノ、 $C_2 - C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 - C_6$ トリアルキルシリルで置換されていてもよく、或いは

(R^5)₂ が隣接炭素原子と結合される場合には一緒になって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ または $-OCF_2CF_2O-$ であることができ、そして
nが1~2である、

好適1または好適2の化合物。

好適4. R^2 がHであり、 R^3 が $C_1 - C_4$ アルキルであり、そして R^5 置換基の少なくとも1個が $NR^1C(=B)$ 部分に対してオルトである、好適3の式Iの化合物。

好適5. R^3 がメチルである、好適4の化合物。

好適6.

R^1 がHまたは $C_1 - C_4$ アルキルであり、

R^2 がHまたは $C_1 - C_4$ アルキルであり、

R^3 が場合によりハロゲン、CN、 OCH_3 、または $S(O)_pCH_3$ で置換されていてもよい $C_1 - C_4$ アルキルであり、

1個の R^5 が $C(=B)NR^1$ 部分に対してオルト位置でJに結合され、そして

該 R^5 が $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニルもしくは $C_2 - C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、またはフェニル、ベンジル、または5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環であり、各環は場合によりハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル

10

20

30

40

50

、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシまたは $C_1 - C_4$ ハロアルコキシで置換されていてもよく、
 そして場合により存在する第二の R^5 基が独立して $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニもしくは $C_2 - C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、またはフェニル、ベンジル、または 5-もしくは 6-員のヘテロ芳香族環であり、各環は場合によりハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシまたは $C_1 - C_4$ ハロアルコキシで置換されていてもよい、

好適 3 の式 I I の化合物。

好適 7. J がフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンであり、各々が $C(=B)NR^1$ 部分に対してオルト位置で J に結合された 1 個の R^5 および場合により存在する第二の R^5 で置換された好適 6 の化合物。

好適 8.

R^1 および R^2 が各々 H であり、

1 個の R^4 が $NR^1C(=X)J$ 部分に対してオルトである 7-位置で結合されておりそして $C_1 - C_3$ アルキル、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ およびハロゲンよりなる群から選択されそして場合により存在する第二の R^4 は $NR^1C(=X)J$ 部分に対してパラである 5-位置で結合されておりそしてハロゲン、 $C_1 - C_3$ アルキルおよび $C_1 - C_3$ ハロアルキルよりなる群から選択される、

好適 7 の化合物。

好適 9.

J が J-1 であり、

Q が NR^{5a} であり、

X が N または CH であり、

Y が CH であり、

Z が CR^{5b} であり、

R^{5a} がハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 - C_4$ ハロアルコキシよりなる群から選択される 1 個もしくは 2 個の置換基で置換されたフェニルまたは 2-ピリジル類であり、そして

R^{5b} がハロゲンまたは CF_3 である、

好適 8 の化合物。

【0022】

特に好適な化合物は、

N-メチル-N'-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-1,8-ナフタレンジカルボキサミド、

N-メチル 8-[(3,4-ジフルオロフェニル)カルボニルアミノ]-1-ナフタレンカルボキサミドおよび

N-メチル 8-[(2-チエニル)カルボニルアミノ]-1-ナフタレンカルボキサミドよりなる群から選択されるものである。

【0023】

本発明はまた、生物学的に有効な量の式 I または式 I I の化合物並びに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤から選択される少なくとも 1 種の追加成分を含んでなる無脊椎生物を抑制するための組成物にも関する。本発明はまた、生物学的に有効な量の式 I または式 I I の化合物および有効な量の少なくとも 1 種の追加の生物学的に活性な化合物または試薬を含んでなる組成物にも関する。好ましい組成物は、好適項 1~9 で好ましいとされる式 I または式 I I の化合物、並びに以上の特に好ましい化合物を含んでなるものである

。

【0024】

本発明はまた、節足動物またはそれらの環境に殺節足動物有効量の式 I もしくは式 I I の化合物、およびその N-オキシドまたは農業的に適する塩類（例えば式 I または式 I I の化合物を含んでなる組成物として）を接触させることを含んでなる節足動物の抑制方法にも関する。本発明はまた、無脊椎有害生物を抑制するための無脊椎有害生物またはその環境に生物学的に有効な量の式 I もしくは式 I I の化合物、または式 I もしくは式 I I の化合物および生物学的に有効な量の少なくとも 1 種の追加化合物もしくは試薬を含んでなる組成物を接触させる方法にも関する。好ましい方法は好適 1～9 に好ましいとして挙げられた式 I または式 I I の化合物並びに上記の特に好ましい化合物を含むものである。

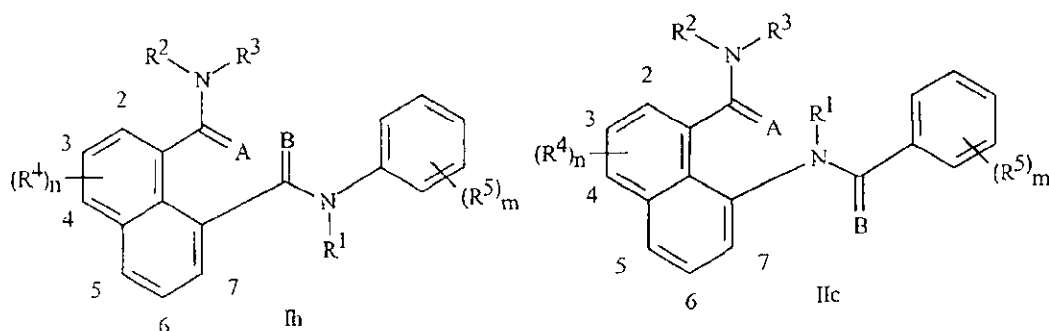
10

【0025】

全ての幾何学および立体異性体を包含する式 I h および式 I I c のある種の化合物、並びにそれらの農業的に適する塩類が注目される：

【0026】

【化 6】



20

【0027】

〔式中、

A および B は独立して O または S であり、

m は 1～5 であり、

n は 0～4 であり、

R^1 は H、または各々が場合によりハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、C₁－C₄ アルコキシ、C₁－C₄ アルキルチオ、C₁－C₄ アルキルスルフィニル、C₁－C₄ アルキルスルホニル、C₂－C₄ アルコキシカルボニル、C₁－C₄ アルキルアミノ、C₂－C₈ ジアルキルアミノおよび C₃－C₆ シクロアルキルアミノよりなる群から選択される 1 個もしくはそれ以上の置換基で置換されていてもよい C₁－C₆ アルキル、C₂－C₆ アルケニル、C₂－C₆ アルキニルもしくは C₃－C₆ シクロアルキルであり、或いは R^1 は C₂－C₆ アルキルカルボニル、C₂－C₆ アルコキシカルボニル、C₂－C₆ アルキルアミノカルボニルまたは C₃－C₈ ジアルキルアミノカルボニルであり、 R^2 は H、C₁－C₆ アルキル、C₂－C₆ アルケニル、C₂－C₆ アルキニル、C₃－C₆ シクロアルキル、C₁－C₄ アルコキシ、C₁－C₄ アルキルアミノ、C₂－C₈ ジアルキルアミノ、C₃－C₆ シクロアルキルアミノ、C₂－C₆ アルコキシカルボニルまたは C₂－C₆ アルキルカルボニルであり、

30

R^3 は H、または各々が場合によりハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、C₁－C₄ アルコキシ、C₁－C₄ アルキルチオ、C₁－C₄ アルキルスルフィニルおよび C₁－C₄ アルキルスルホニルよりなる群から選択される 1 個もしくはそれ以上の置換基で置換されていてもよい C₁－C₆ アルキル、C₂－C₆ アルケニル、C₂－C₆ アルキニルもしくは C₃－C₆ シクロアルキルであり、或いは

R^2 および R^3 はそれらが結合している窒素と一緒にあって 2～6 個の炭素原子および場合により窒素、硫黄または酸素の 1 個の追加原子を含有する環を形成し、該環は場合により C₁－C₂ アルキル、ハロゲン、CN、NO₂ および C₁－C₂ アルコキシよりなる群

40

50

から選択される 1～4 個の置換基で置換されていてもよく、そして
 各 R^4 および各 R^5 は独立して H、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 C_2-C_6 ハロアルケニル、 C_2-C_6 ハロアルキニル、 C_3-C_6 ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、ヒドロキシ、 C_1-C_4 アルコキシ、 C_1-C_4 ハロアルコキシ、 C_1-C_4 アルキルチオ、 C_1-C_4 アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 アルキルスルホニル、 C_1-C_4 ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 ハロアルキルスルホニル、 C_2-C_4 アルコキシカルボニル、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_2-C_8 ジアルキルアミノ、 C_3-C_6 シクロアルキルアミノ、 C_2-C_6 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 アルキルアミノカルボニル、 C_3-C_8 ジアルキルアミノカルボニル、または C_3-C_6 トリアルキルシリルであり、或いは
 各 R^4 および各 R^5 は独立して場合により C_1-C_4 アルキル、 C_2-C_4 アルケニル、 C_2-C_4 アルキニル、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_4 ハロアルキル、 C_2-C_4 ハロアルケニル、 C_2-C_4 ハロアルキニル、 C_3-C_6 ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 アルコキシ、 C_1-C_4 ハロアルコキシ、 C_1-C_4 アルキルチオ、 C_1-C_4 アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 アルキルスルホニル、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_2-C_8 ジアルキルアミノ、 C_3-C_6 シクロアルキルアミノ、 C_3-C_6 (アルキル) シクロアルキルアミノ、 C_2-C_4 アルキルカルボニル、 C_2-C_6 アルコキシカルボニル、 C_2-C_6 アルキルアミノカルボニル、 C_3-C_8 ジアルキルアミノカルボニルまたは C_3-C_6 トリアルキルシリルで置換されていてもよいフェニルである」。

10

20

【0028】

殺節足動物有効量の上記の式 I h または式 I I c の化合物および界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤よりなる群から選択される少なくとも 1 種の追加成分を含んでなる殺節足動物組成物も注目される。

【0029】

節足動物またはそれらの環境に殺節足動物有効量の上記の式 I h または式 I I c の化合物を接触させることを含んでなる節足動物の抑制方法も注目される。

【0030】

選抜 1.

A および B が両者とも O であり、

m が 1～3 であり、

n が 0～2 であり、

R^1 が H、 C_1-C_4 アルキル、 C_2-C_4 アルケニル、 C_2-C_4 アルキニル、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_2-C_6 アルキルカルボニルまたは C_2-C_6 アルコキシカルボニルであり、そして

各 R^4 および各 R^5 が独立して H、 C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 アルコキシ、 C_1-C_4 ハロアルコキシ、 C_1-C_4 アルキルチオ、 C_1-C_4 アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 アルキルスルホニル、 C_1-C_4 ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 ハロアルキルスルホニルまたは C_2-C_4 アルコキシカルボニルである、

式 I h の選択される化合物が注目される。

40

【0031】

選抜 2.

R^2 が H であり、

R^3 が C_1-C_4 アルキルであり、

各 R^4 および各 R^5 が独立して H、 C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1-C_4 アルコキシ、 C_1-C_4 ハロアルコキシ、 C_1-C_4 アルキルチオ、 C_1-C_4 アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 アルキルスルホニル、 C_1-C_4

50

C₄ ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ ハロアルキルスルホニルまたはC₂ - C₄ アルコキシカルボニルであり、そして
R⁵ 置換基の少なくとも1個がアミド結合に関してオルトである、
選抜1の選択される化合物が注目される。

【0032】

選抜3. R³ がメチルである選抜2の選択される化合物が注目される。

【0033】

選抜4.

AおよびBが両者ともOであり、

mが1～3であり、

10

nが0～2であり、

R¹ がH、C₁ - C₄ アルキル、C₂ - C₄ アルケニル、C₂ - C₄ アルキニル、C₃ - C₆ シクロアルキル、C₂ - C₆ アルキルカルボニルまたはC₂ - C₆ アルコキシカルボニルであり、そして

各R⁴ および各R⁵ が独立してH、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ ハロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₄ ハロアルコキシ、C₁ - C₄ アルキルチオ、C₁ - C₄ アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ アルキルスルホニル、C₁ - C₄ ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ ハロアルキルスルホニルまたはC₂ - C₄ アルコキシカルボニルである、

式I I cの選択される化合物が注目される。

20

【0034】

選抜5.

R² がHであり、

R³ が場合によりC₁ - C₄ アルコキシまたはC₁ - C₄ アルキルチオで置換されていてもよいC₁ - C₆ アルキルであり、

各R⁴ および各R⁵ が独立してH、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ ハロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₄ ハロアルコキシ、C₁ - C₄ アルキルチオ、C₁ - C₄ アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ アルキルスルホニル、C₁ - C₄ ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ ハロアルキルスルホニルまたはC₂ - C₄ アルコキシカルボニルであり、そして

30

R⁵ 置換基の少なくとも1個がアミド結合に関してオルトである、

選抜4の選択される化合物が注目される。

【0035】

上記のように、各Jは独立してフェニル環、ナフチル環系、5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環または芳香族8-、9-もしくは10-員の縮合ヘテロ二環式環系であり、ここで各環または環系は場合により1～5個のR⁵ で置換されていてもよい。これらのJ基に関する用語「場合により置換されていてもよい」は、未置換であるかまたは未置換同族体が保有する殺節足動物活性を消失させない少なくとも1個の非水素置換基を有する基をさす。場合により1～5個のR⁵ で置換されていてもよいフェニルの例は例示1にU-1として示されている環であり、ここでR^v はR⁵ でありそしてrは1～5の整数である。場合により1～5個のR⁵ で置換されていてもよいナフチル基の例は例示1にU-85として示され、ここでR^v はR⁵ でありそしてrは1～5の整数である。場合により1～5個のR⁵ で置換されていてもよい5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環は例示1に示されている環U-2～U-53であり、ここでR^v はR⁵ でありそしてrは1～5の整数である。以下のJ-1～J-4も5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環を示すことに注目すること。U-2～U-20がJ-1の例であり、U-21～U-35およびU-40がJ-2の例であり、U-41～U-48がJ-3の例であり、そしてU-49～U-53がJ-4の例であることに注目すること。場合により1～4個のR³ で置換されていてもよい芳香族8-、9-もしくは10-員の縮合ヘテロ二環式環系の例は例示1に示されているU-54～U-84を包含し、ここでR^v はR⁵ でありそしてrは1～5の整数である。

40

50

【0036】

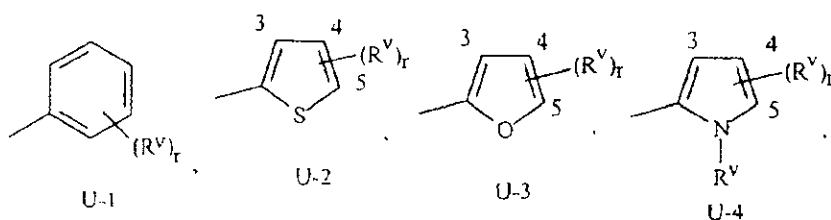
R^v 基は構造U-1～U-85に示されているが、それらは場合により存在する置換基であるためそれらは必ずしも存在する必要はないことが注目される。 R^v がある原子に結合されているHである場合には、これは該原子が未置換であることと同義であることに注目すること。それらの原子価を満たすために置換を必要とする窒素原子はHまたは R^v で置換される。一部のU基は5個より少ない R^v 基でのみ置換されることが注目される（例えばU-14、U-15、U-18～U-21およびU-32～U-34は1個の R^v でのみ置換されう）。 $(R^v)_r$ とU基との間の結合点が浮動性として示される場合には、 $(R^v)_r$ はU基のいずれかの利用可能な炭素原子に結合されうること注目すること。U基上の結合点が浮動性として示される場合には、U基は式Iの残部とU基のいずれかの利用可能な炭素を介して水素原子の置換により結合されうること注目すること。

10

【0037】

【化7】

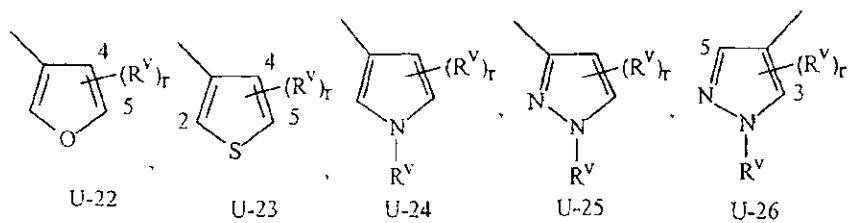
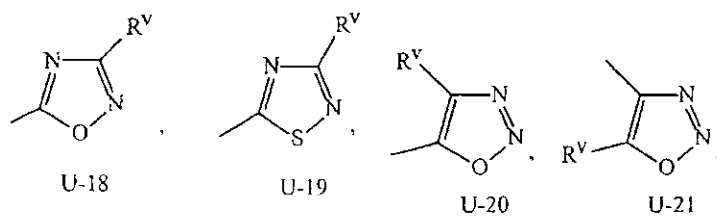
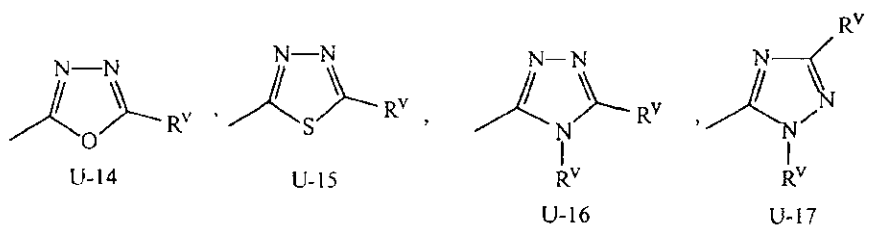
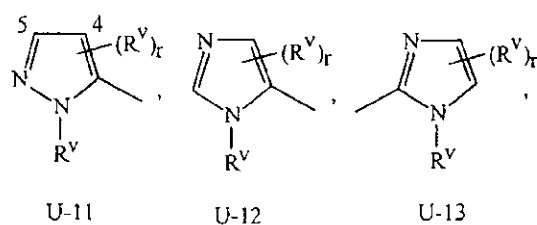
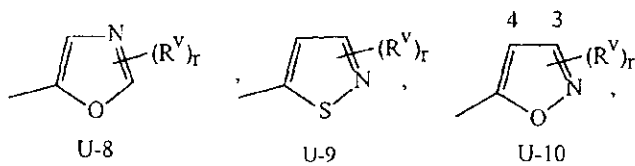
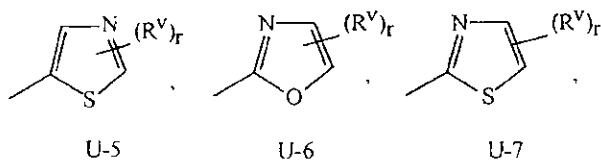
例示1



20

【0038】

【化8】



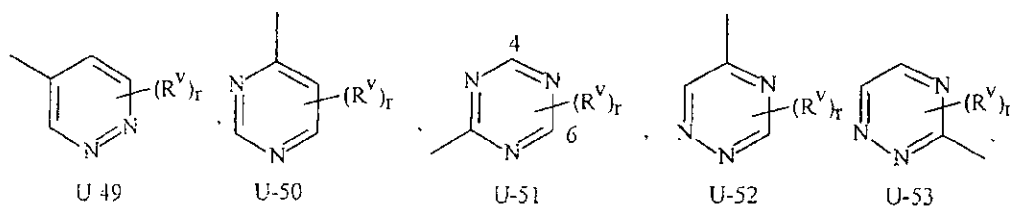
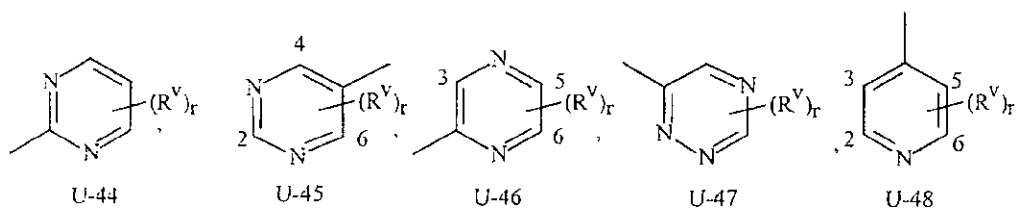
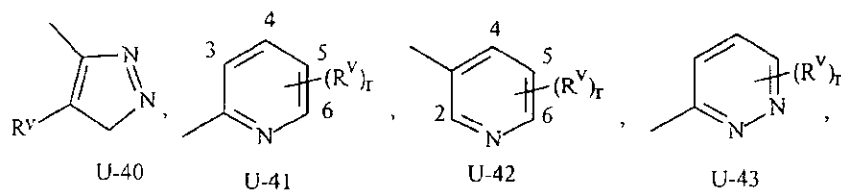
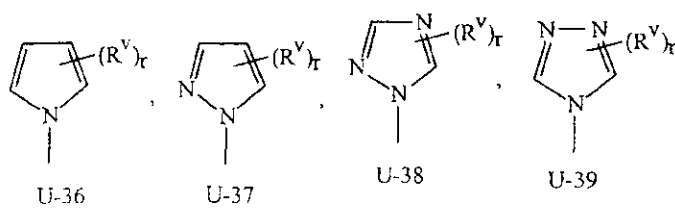
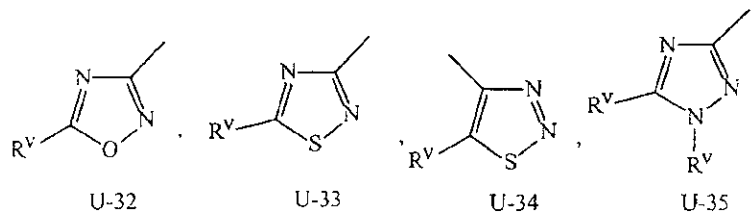
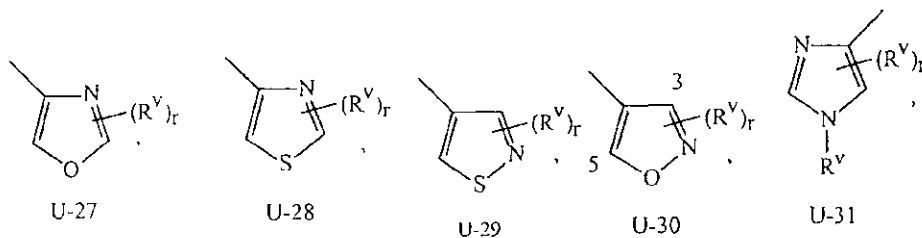
10

20

30

40

【 0 0 3 9 】
【 化 9 】



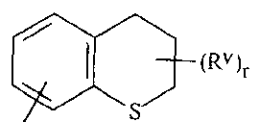
【 0 0 4 0 】
【 化 1 0 】

10

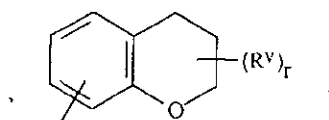
20

30

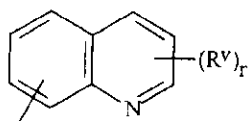
40



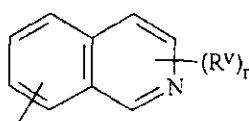
U-54



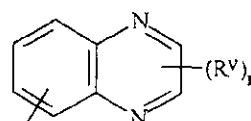
U-55



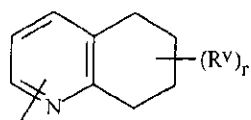
U-56



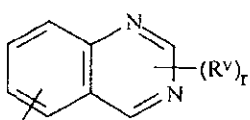
U-57



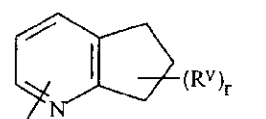
U-58



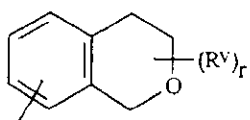
U-59



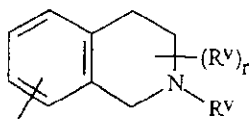
U-60



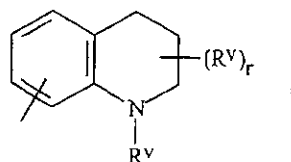
U-61



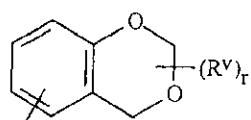
U-62



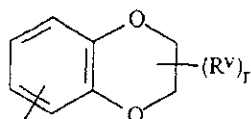
U-63



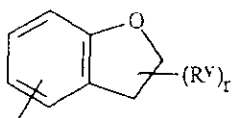
U-64



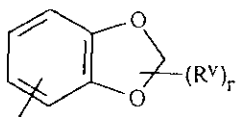
U-65



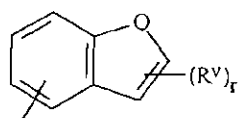
U-66



U-67



U-68



U-69

10

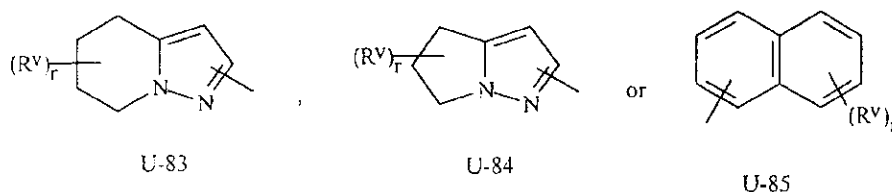
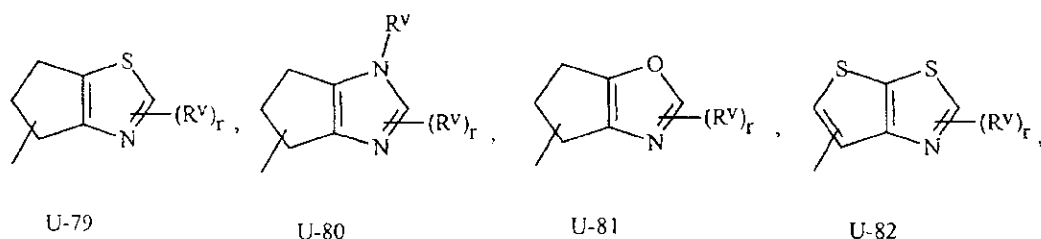
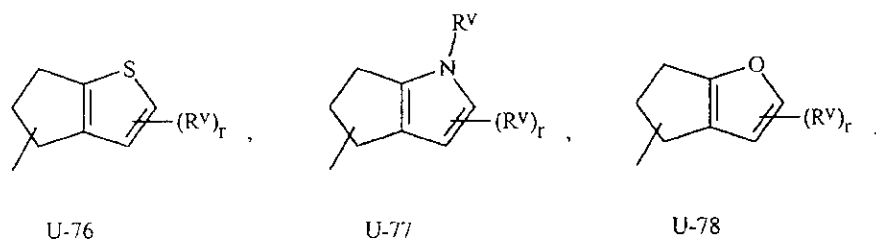
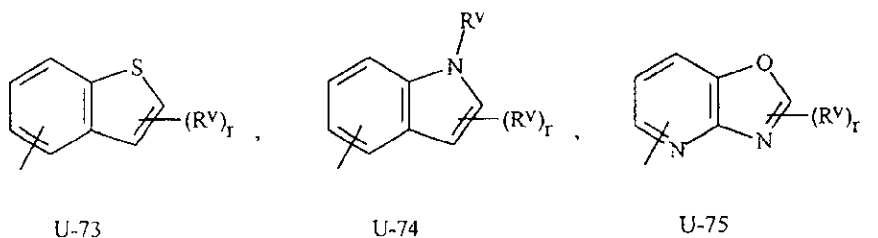
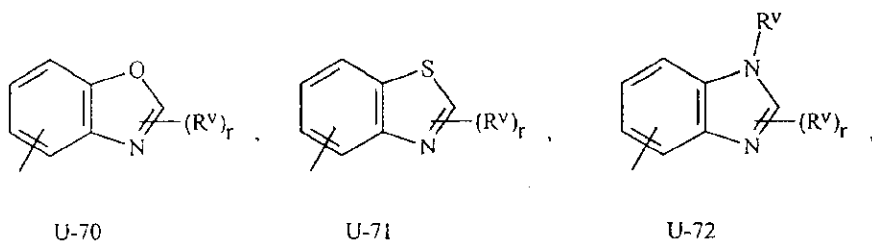
20

30

40

【 0 0 4 1 】

【 化 1 1 】



【0042】

式 I および式 I I の化合物はスキーム 1-21 に記載されている 1 種もしくはそれ以上の
下記の方法および変法により製造することができる。以下のスキームに記載される化合物
中の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、A、B、m および n の定義は本発明の要旨で以上で定義し
た通りかまたはそれらの亜群である。

【0043】

式 I の化合物はスキーム 1-9 に略記されている工程により製造することができる。式 I
a-h の化合物は式 I の化合物の種々の亜群である。

【0044】

代表的な工程はスキーム 1 に記載されておりそして塩基の存在下または不存在下における
式 2 のイソナフタルイミドと式 3 のアミンとのカップリングまたは式 4 の化合物と式 5 の
アミンとのカップリングのいずれかを包含する。代表的な塩基はアミン塩基、例えばトリ
エチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジン、を包含する。ある種の場合

10

20

30

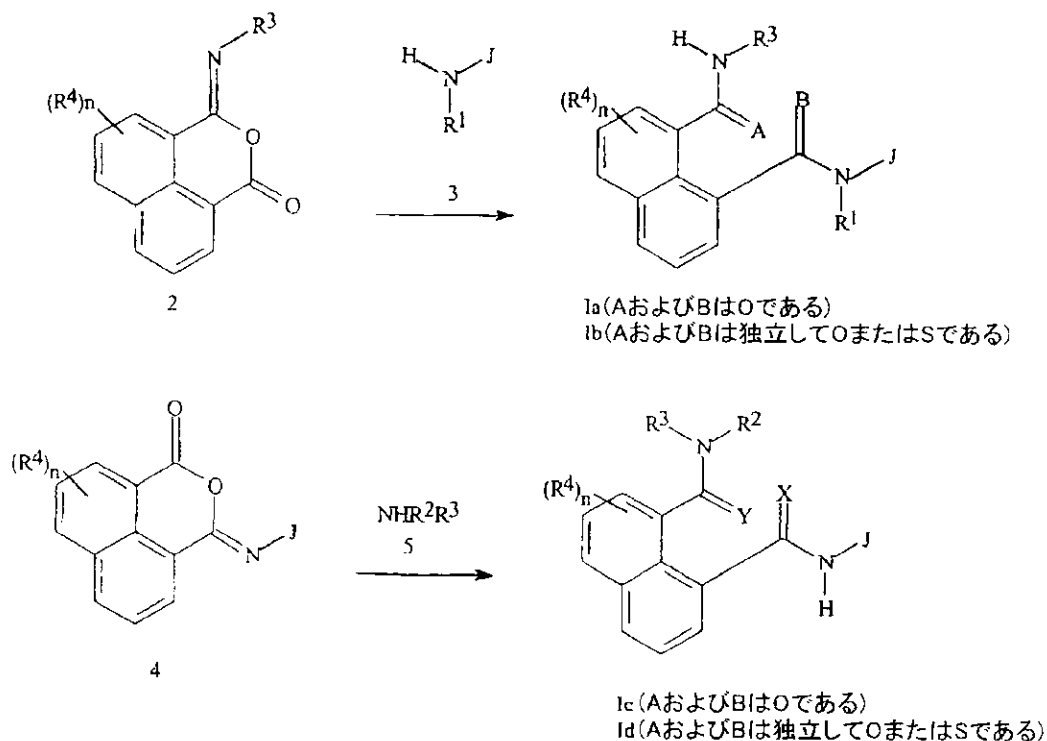
50

には、重合体に担持された酸スカベンジャー、例えば重合体と結合されたジイソプロピルエチルアミンおよび重合体と結合されたジメチルアミノピリジン、を使用することが有用である。式 3 および式 5 のアミン類は市販されているか、化学文献に十分に発表されているか、または確立された文献工程から容易に入手可能である。式 I a のアミド類は五硫化磷およびローソン試薬を包含する種々の標準的なチオ転換試薬を用いて式 I b のチオアミド類に転化させることができる。

【 0 0 4 5 】

【 化 1 2 】

スキーム 1



10

20

30

40

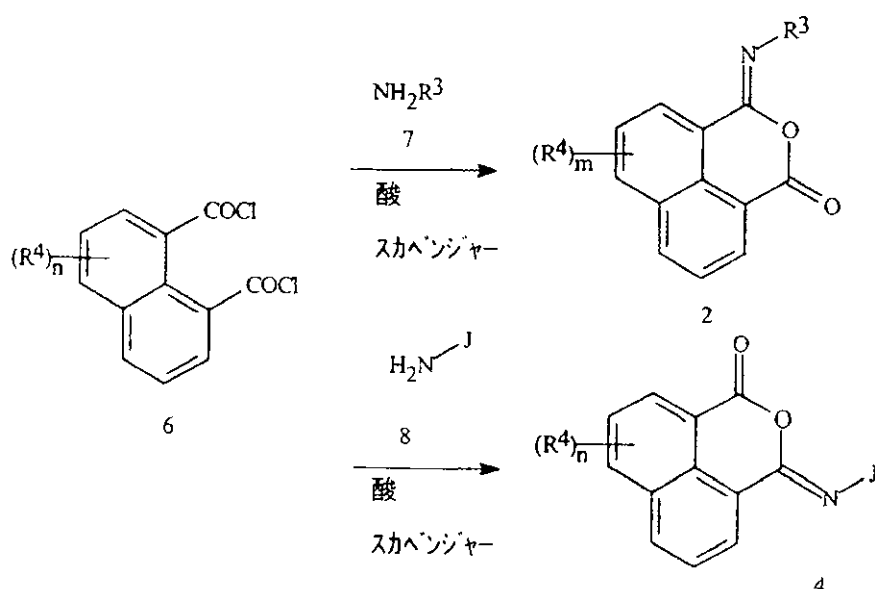
【 0 0 4 6 】

式 2 および式 4 の化合物は典型的には式 6 の 1, 8-ナフタロイルクロリドとそれぞれ式 7 のアミンまたは式 8 のアミンとのカップリングにより製造される (スキーム 2)。代表的な酸スカベンジャーはアミン塩基、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジン、を包含する。ある場合には、重合体に担持された酸スカベンジャー、例えば重合体と結合されたジイソプロピルエチルアミンおよび重合体と結合されたジメチルアミノピリジン、を使用することが有用である。ある場合には、式 7 のアミンは、過剰に使用される場合には、酸スカベンジャーとして作用しうる。式 6 の 1, 8-ナフタロイルクロリドの化合物は化学文献に十分に発表されておりそして典型的には対応する 1, 8-ナフタレン酸類または無水物からカルボン酸からカルボン酸クロリドへの転換用に一般的に使用される塩素化剤の使用で製造される。これらの一般的に使用される塩素化試薬はオキシ塩化磷および五塩化磷を包含する。

【 0 0 4 7 】

【 化 1 3 】

スキーム2



10

【0048】

式2および式4の化合物の製造用の別の工程は、脱水試薬を使用する不活性溶媒中での $-30 \sim 30^\circ\text{C}$ の範囲内の温度における、酸スカベンジャーの存在下または不存在下でのそれぞれ式9および10の8-アミノカルボニル-1-ナフタレンカルボン酸の化合物の環化を包含する（スキーム3）。代表的な脱水試薬はジシクロヘキシルカルボジイミドおよび無水トリフルオロ酢酸を包含する。重合体に担持された試薬、例えば重合体と結合されたシクロヘキシルカルボジイミド、が有用である。代表的な酸スカベンジャーはアミン塩基、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジン、を包含する。ある場合には、重合体に担持された酸スカベンジャー、例えば重合体と結合されたジイソプロピルエチルアミンおよび重合体と結合されたジメチルアミノピリジン、を使用することが有用である。代表的な不活性溶媒は非プロトン性溶媒、例えばジクロロメタンおよび1-クロロブタン、を包含する。典型的な反応温度範囲は $-5 \sim 25^\circ\text{C}$ である。

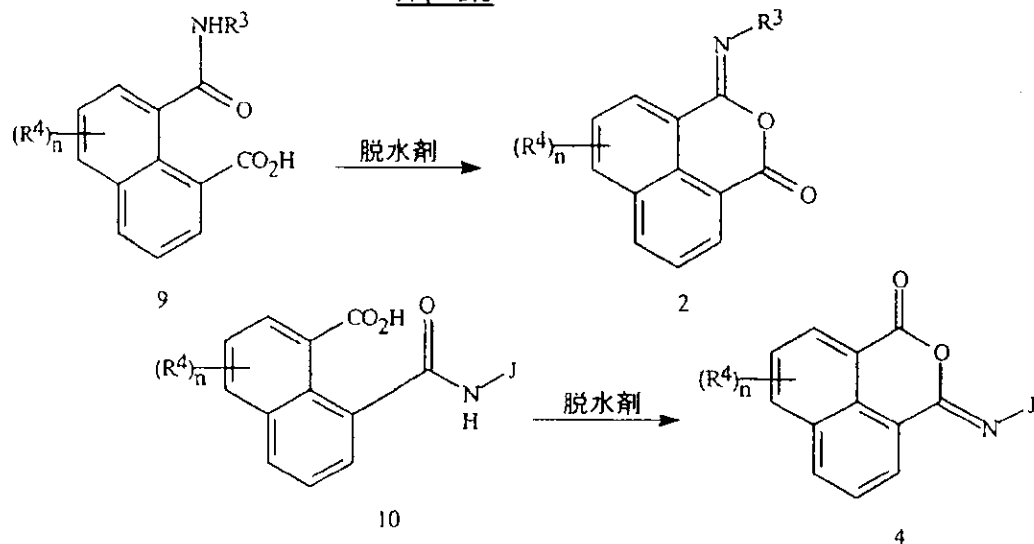
20

30

【0049】

【化14】

スキーム3



40

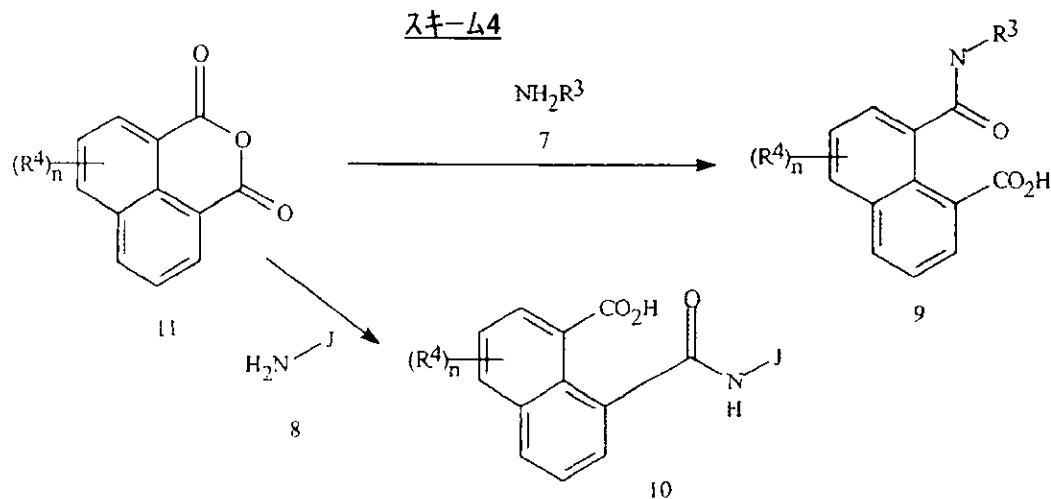
50

【0050】

式9および式10の8-アミノカルボニル-1-ナフタレンカルボン酸類の製造は、不活性溶媒中での0～30℃の範囲内の温度における式11の無水1,8-ナフタル酸とそれぞれ式7のアミン類または式8のアミン類とのカップリングを包含する（スキーム4）。代表的な不活性溶媒はジメチルホルムアミドである。反応は一般的には5～10℃の温度範囲内で行われる。

【0051】

【化15】



10

20

【0052】

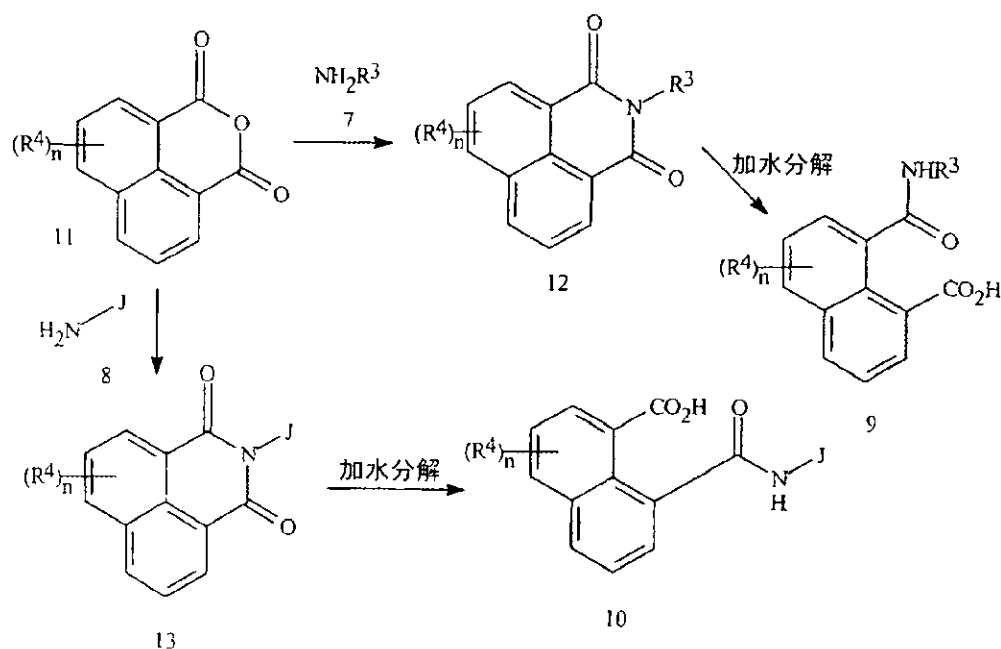
式9および式10の8-アミノカルボニル-1-ナフタレンカルボン酸の化合物の製造用の別の工程は、プロトン性溶媒系、例えば水-メタノールまたは水-ジオキサン、中での高められた温度における水酸化物、例えば水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウム、を用いるそれぞれ式12および式13の1,8-ナフタルイミドの化合物の加水分解を包含する（スキーム5）。反応は一般的には反応混合物の還流温度において行われる。式12および式13の1,8-ナフタルイミドの化合物は典型的には、高められた温度において、一般的には酸の存在下で、式11の無水1,8-ナフタル酸をそれぞれ式7または式8のアミンと縮合させることにより製造される。代表的な反応は、酢酸中で式11の無水1,8-ナフタル酸および式7または式8のアミンを還流させることを包含する。

30

【0053】

【化16】

スキーム5



10

20

【0054】

式 I の化合物の製造用の別の工程は、酸スカベンジャーの存在下における式 14 および式 15 の 8-アミノカルボニル-1-ナフタロイルクロリド類とそれぞれ式 3 のアミンまたは式 5 のアミンとのカップリングを包含する。代表的な酸スカベンジャーはアミン塩基、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジン、を包含する。ある場合には、重合体に担持された酸スカベンジャー、例えば重合体と結合されたジイソプロピルエチルアミンおよび重合体と結合されたジメチルアミノピリジン、を使用することが有用である。典型的には、反応温度範囲は 0 ~ 25 °C である。

【0055】

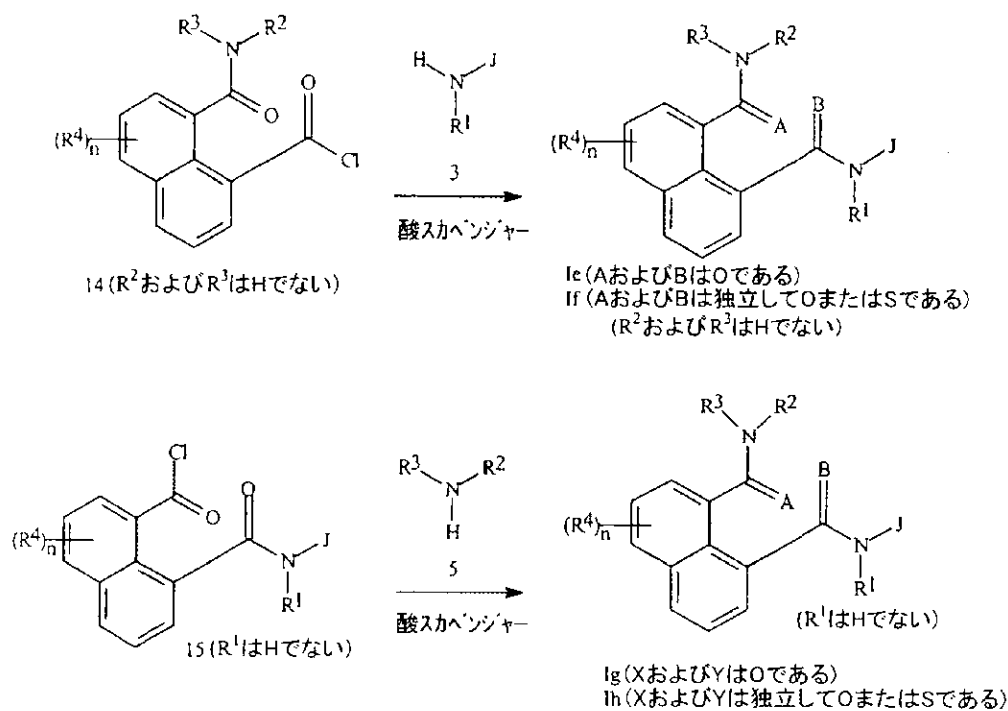
式 14 および式 15 の 8-アミノカルボニル-1-ナフタロイルクロリド類は対応する式 6 の 1, 8-ナフタロイルジクロリドを酸スカベンジャーの存在下でそれぞれ式 5 または式 3 のアミンを用いてカップリングすることから入手可能である (スキーム 7)。代表的な酸スカベンジャーはアミン塩基、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジン、を包含する。ある場合には、重合体に担持された酸スカベンジャー、例えば重合体と結合されたジイソプロピルエチルアミンおよび重合体と結合されたジメチルアミノピリジン、を使用することが有用である。

30

【0056】

【化 17】

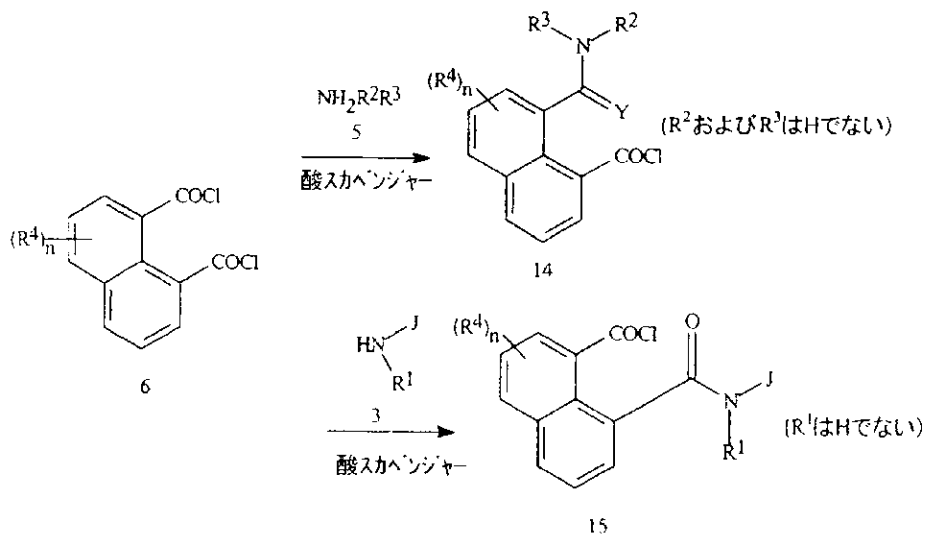
スキーム6



10

20

スキーム7



30

【0057】

式Iの化合物の製造用の別の工程は、式20のナフタレンの段階的なカルバモイル化またはチオカルバモイル化を包含する（スキーム8および9）。フリーデルークラフツ反応条件下でのルイス酸を用いる処理で、式16または式17の1-ナフタレンカルボキサミドまたは1-ナフタレンチオカルボキサミドの化合物が式18または式19のカルバモイルクロリドまたはチオカルバモイルクロリドとカップリングして式Iの化合物を与える（スキーム8）。一般的に使用されるルイス酸類は塩化アルミニウムおよび塩化第二錫を包含する。

40

【0058】

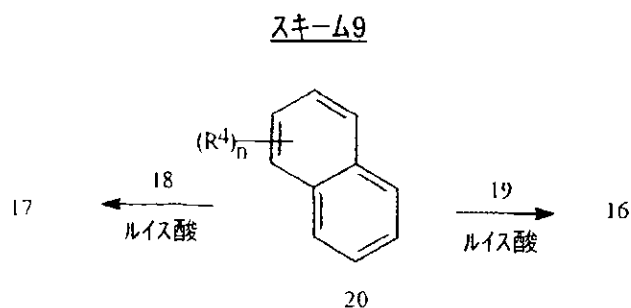
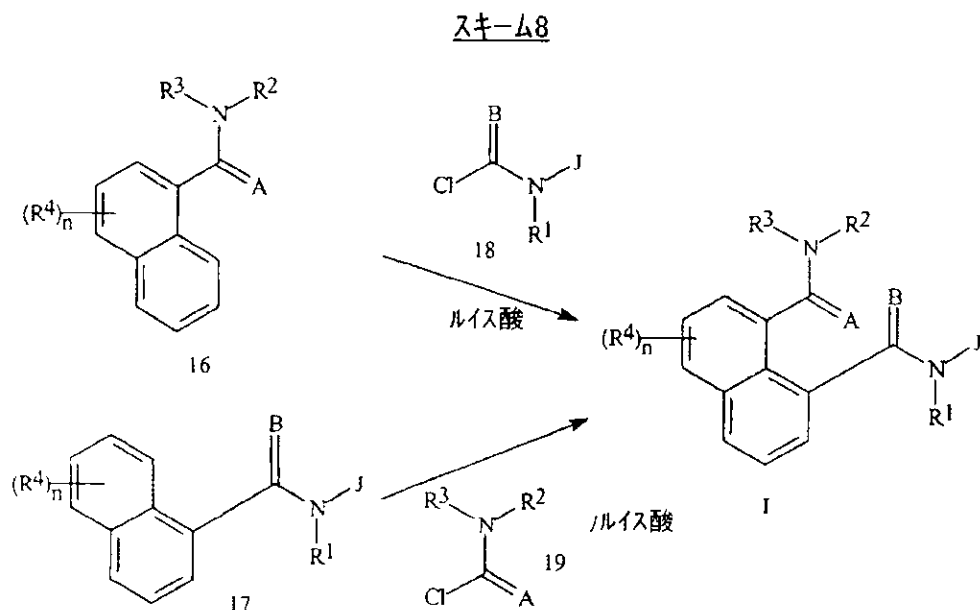
式16または式17の1-ナフタレンカルボキサミド類または1-ナフタレンチオカルボキサミド類の化合物の製造（スキーム9）は、ルイス酸、例えば塩化アルミニウムおよび塩化第二錫の存在下におけるフリーデルークラフツ反応条件下での式20のナフタレンとそれぞれ式19または式18のカルバモイルクロリドまたはチオカルバモイルクロリドと

50

のカップリングを包含する。式 20 のナフタレン類、式 18 および式 19 のカルバモイルクロリド類およびチオカルバモイルクロリド類は市販されているか、化学文献に十分に記載されているか、または確立された文献工程に従い製造することができる。

【0059】

【化18】



【0060】

式 I I の化合物はスキーム 10-13 に記載されているような下記の方法および変法の 1 種もしくはそれ以上により製造することができる。式 I I a-b の化合物は式 I I の化合物の亜群である。

【0061】

代表的な工程はスキーム 10 に記載されており、そして酸スカベンジャーの存在下における式 21 の 8-アミノナフタレン-1-カルボキサミドと式 I I a の化合物を与えるための式 22 のカルボニルクロリドとの、または式 I I b を与えるためのアレンセレノレートの存在下における式 22 のチオカルボニルクロリドとのカップリングを包含する。代表的な酸スカベンジャーはアミン塩基、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジン、を包含し、他のスカベンジャーは水酸化物、例えば水酸化ナトリウムおよびカリウム並びに炭酸塩類、例えば炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムを包含する。ある場合には、重合体に担持された酸スカベンジャー、例えば重合体と結合されたジイソプロピルエチルアミンおよび重合体と結合されたジメチルアミノピリジン、を使用することが有用である。代表的なアレンセレノレート類はナトリウムフェニルセレノレートを包含する。式 22 のカルボニルクロリド類およびチオカルボニルクロリド類は市販されているか、化学文献に十分に記載されているか、または確立された文献工程に従い容易に製造される。式 I I a のアミド類は標準的なチオ転換試薬、例えば五硫化燐およびローソン

10

20

30

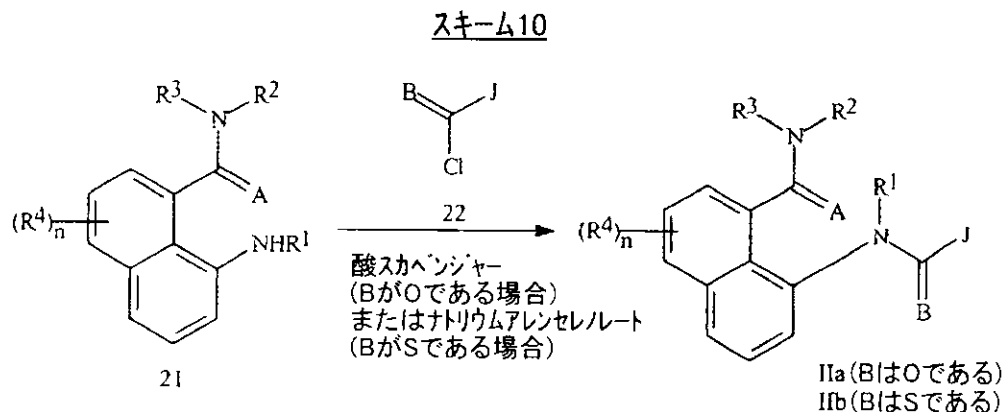
40

50

試薬、を用いて式 I I b のチオアミド類に転化させることができる。

【0062】

【化19】



10

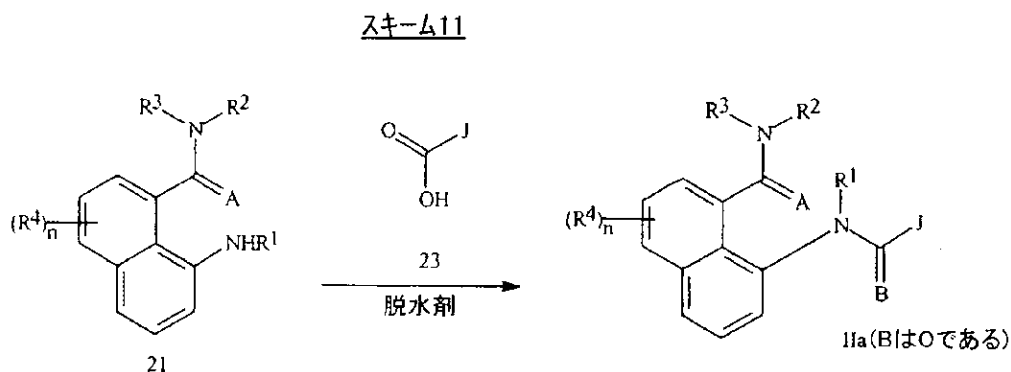
【0063】

式 I I a の化合物の製造用の別の工程は、脱水試薬、例えばジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、の存在下における式 21 の 1-アミノ-ナフタレン-8-カルボキサミドまたは 1-アミノ-ナフタレン-8-チオカルボキサミドと式 23 のカルボン酸とのカップリングを包含する。重合体に担持された試薬、例えば重合体と結合されたシクロヘキシルカルボジイミド、が有用である。式 23 の安息香酸類は市販されているか、化学文献に十分に記載されているか、または確立された文献工程に従い容易に製造される。カルボキサミド類の製造に関する文献は大量にあるため、スキーム 10 およびスキーム 11 の工程は式 I I の化合物の製造用の有用な方法の単なる代表例である。

20

【0064】

【化20】



30

【0065】

式 21 の 8-アミノ-ナフタレン-1-カルボキサミド類および 8-アミノ-ナフタレン-1-チオカルボキサミド類は典型的にはそれぞれ式 24 の対応する 8-ニトロ-ナフタレン-1-カルボキサミド類および 8-ニトロ-ナフタレン-1-チオカルボキサミド類からニトロ基の還元により入手可能である。代表的な工程は、金属触媒、例えば炭素上パラジウムまたは酸化白金、の存在下におけるヒドロキシル系溶媒、例えばエタノールおよびイソプロパノール、中での水素を用いる還元を包含する。これらの工程は化学文献に大量に情報提供されている。R¹ 置換基、例えばアルキル、置換されたアルキルなどは一般的にはこの段階において直接的なアルキル化を包含する既知の工程によりまたはアミンの還元的アルキル化の一般的に好ましい方法により導入することができる。普遍的に使用さ

40

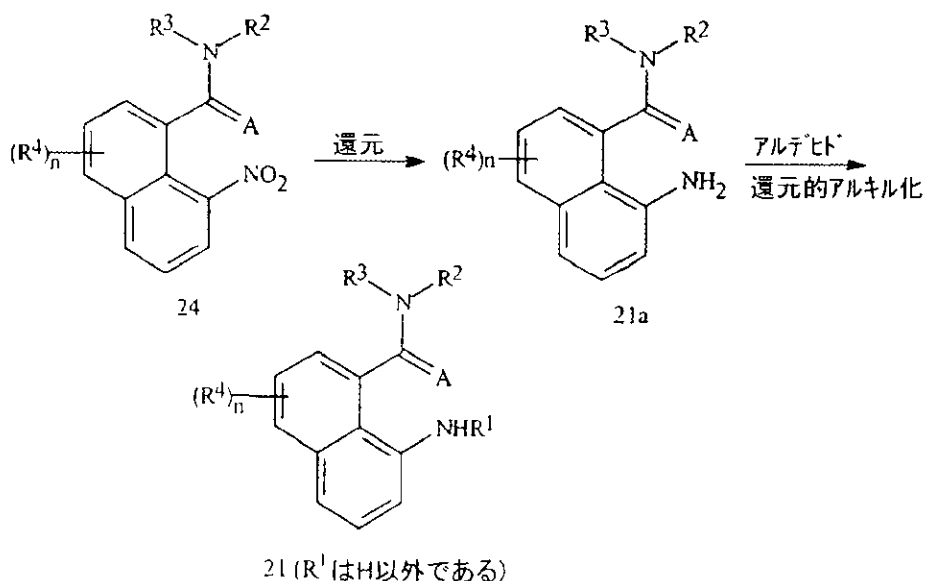
50

れる工程は、 R^1 がH以外である式21の化合物を製造するための還元剤、例えばシアノホウ水素化ナトリウム、の存在下においてアミノナフタレン21aをアルデヒドと組み合わせることである。

【0066】

【化21】

スキーム12



10

20

【0067】

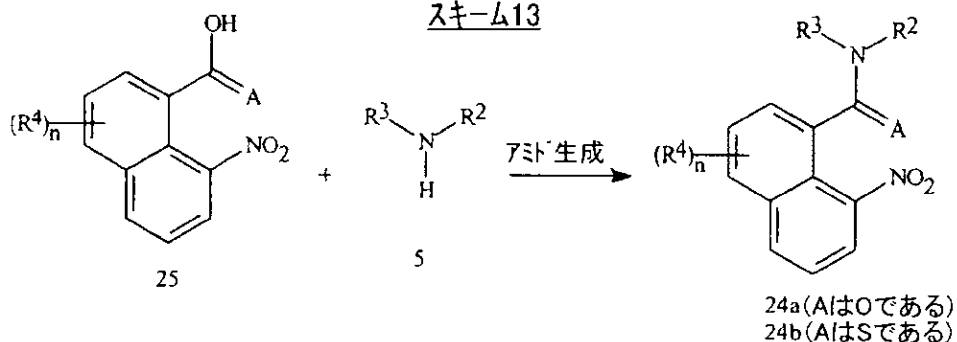
式24の中間体アミド類は8-ニトロナフタレン-1-カルボン酸類から容易に製造され、それらは市販されているか、文献から既知であるか、または一般的にはナフタレン類または芳香族基の誘導化に関する確立された文献工程により製造することができる。アミド生成のための代表的な方法をここで適用することができる。これらは、例えばDCCを用いる式25の酸類と式5のアミン類の直接的な脱水性カップリング並びに酸類ら例えば酸クロリドまたは無水物の如き活性化形態への転化およびその後の式24aのアミド類を生成するためのアミン類とのカップリングを包含する。また、シアノホスホン酸ジエチルも酸の活性化を包含することのタイプの反応の有用な試薬である。このタイプの反応に関する化学文献は大量にある。式24aのアミド類は、市販のチオ転換試薬、例えば五硫化磷およびローソン試薬、を用いることにより式24bのチオアミド類に容易に転化される。

30

【0068】

【化22】

スキーム13



40

50

【0069】

式23aの安息香酸類（Jが場合により置換されていてもよいフェニル環である式23の化合物）は当該技術で既知である。式4のある種の複素環式酸類の製造はスキーム14-21に記載されている。種々の複素環式酸類およびそれらの合成用の一般的方法是世界特許出願WO98/57397に見ることができる。

【0070】

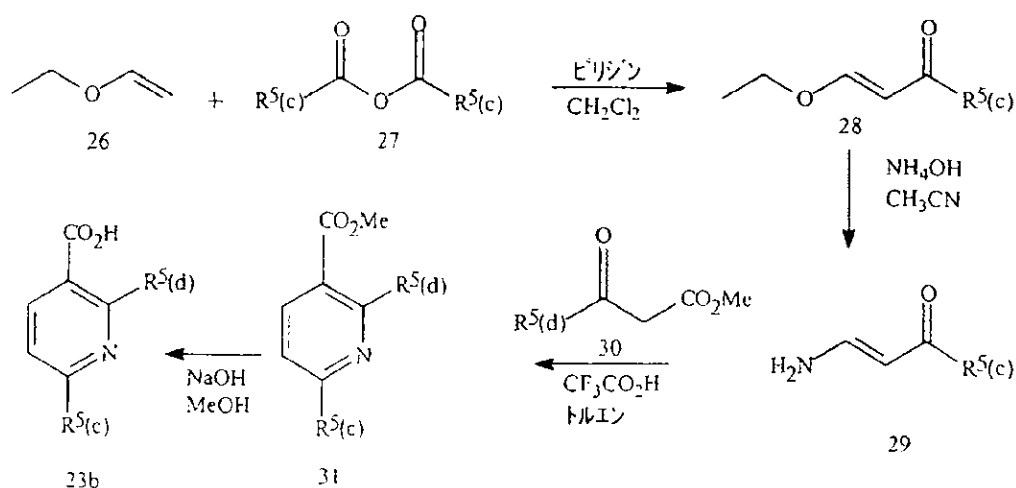
代表的なピリジン酸類（23b）の合成はスキーム14に記述されている。この工程はβ-ケトエステル類および4-アミノブテノン類（29）からのピリジン類の既知の合成を包含する。置換基 $R^5(c)$ および $R^5(d)$ は例えばアルキルおよびハロアルキルを包含する。

10

【0071】

【化23】

スキーム14



20

【0072】

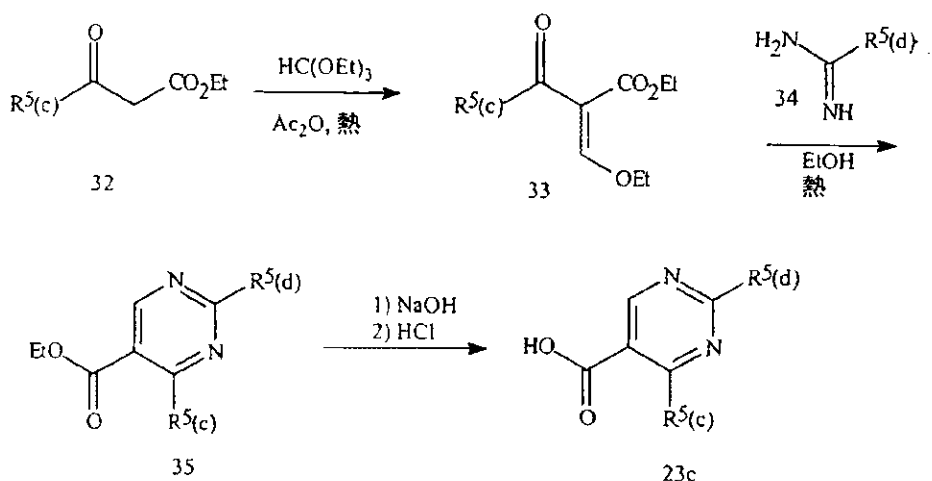
代表的なピリミジン酸類（23c）の合成はスキーム15に記述されている。この工程はピニリデン-β-ケトエステル類（33）およびアミジン類（34）からのピリミジン類の既知の合成を包含する。置換基 $R^5(c)$ および $R^5(d)$ は例えばアルキルおよびハロアルキルを包含する。

30

【0073】

【化24】

スキーム15



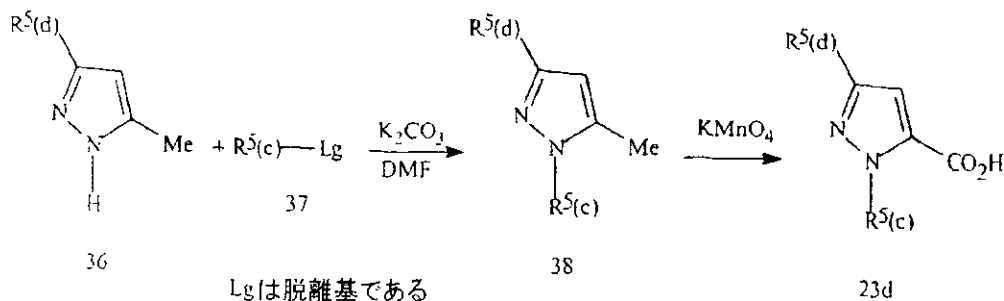
【 0 0 7 4 】

代表的なピラゾール酸類（23d）の合成はスキーム16-21に記述されている。スキーム16中の23dの合成は、重要な段階として、ピラゾールのアリール化またはアルキル化によるR⁵（c）置換基の導入を包含する。アリール化またはアルキル化剤R⁵（c）-Lg（ここでLgは脱離基、例えばCl、Br、I、スルホネート類、例えばp-トルエンスルホネートもしくはメタンスルホネート、またはサルフェート類、例えば-SO₂OR⁵（c））はR⁵（c）基、例えばC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₂-C₆アルキルカルボニル、C₂-C₆アルコキシカルボニル、C₃-C₈ジアルキルアミノカルボニル、C₃-C₆トリアルキルシリル、またはフェニル、ベンジル、ベンゾイル、5-もしくは6-員のヘテロ芳香族環を包含し、各環または環系は場合により置換されていてもよい。メチル基の酸化がピラゾールカルボン酸を与える。より好ましいR⁵（d）基の一部はハロアルキルを包含する。

【 0 0 7 5 】

【化 2 5】

スキーム16



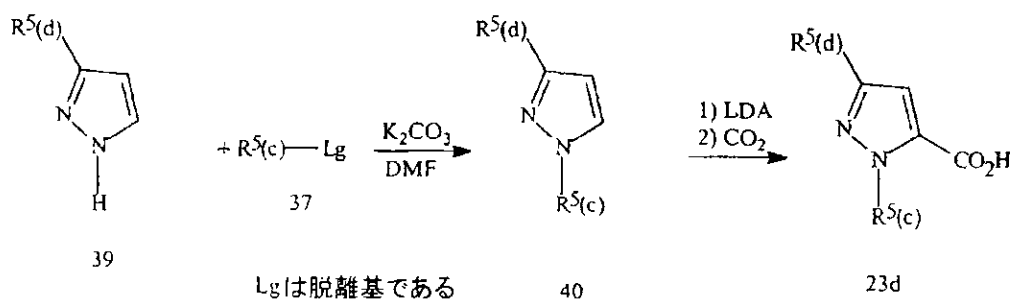
【 0 0 7 6 】

式 2 3 d のピラゾール類の合成はスキーム 1 7 に記載されている。これらの酸類はリチウムジイソプロピルアミド (LDA) を用いる式 4 0 の化合物の金属処理並びにその後のリチウムジイソプロピルアミド (LDA) を用いる金属処理を与えるリチウム塩の二酸化炭素による反応停止および重要段階としての式 4 0 の化合物のカルボキシル化により製造することができる。R⁵ (c) 基はスキーム 1 6 のものと同様な方法で、すなわち式 3 7 の化合物を用いるアルキル化またはアリール化により、導入される。代表的な R⁵ (d) 基は例えばシアノ、ハロアルキルおよびハロゲンを含む。

【 0 0 7 7 】

【 化 2 6 】

スキーム17



10

【 0 0 7 8 】

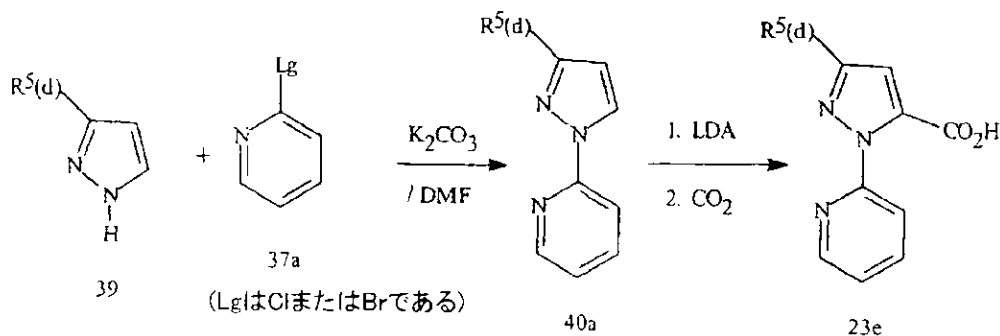
この工程はスキーム18に示されているような式23eの1-(2-ピリジニル)ピラゾールカルボン酸類を製造するために特に有用である。式39のピラゾールと式37aの2,3-ジハロピリジンとの反応が所望する位置化学性に関する良好な特異性を有する式40aの1-ピリジルピラゾールの良好な収率を与える。上記の式40aの化合物の金属処理およびカルボキシル化が式23eの1-(2-ピリジニル)ピラゾールカルボン酸を与える。

20

【 0 0 7 9 】

【 化 2 7 】

スキーム18



30

【 0 0 8 0 】

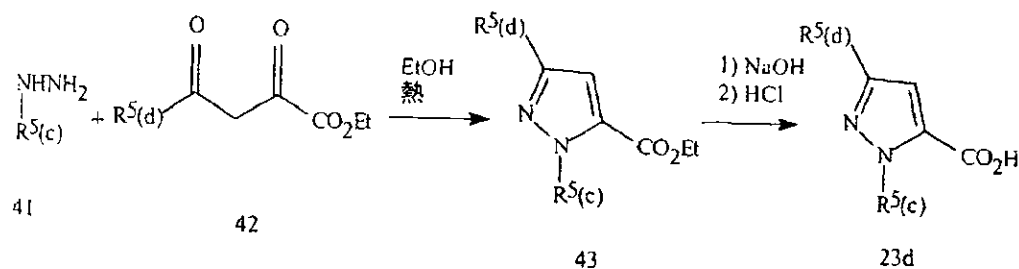
式4cのピラゾール類の合成はスキーム19に記載されている。それらは、式43のピラゾールエステル類を与えるための式41の場合により置換されていてもよいフェニルヒドラジンと式42のケトピルビン酸エステルとの反応により製造される。エステル類の加水分解が式23dのピラゾール酸類を与える。この工程は、R⁵(c)基が場合により置換されていてもよいフェニルでありそしてR⁵(d)基がハロアルキルである化合物の製造用に特に有用である。

40

【 0 0 8 1 】

【 化 2 8 】

スキーム19



10

【0082】

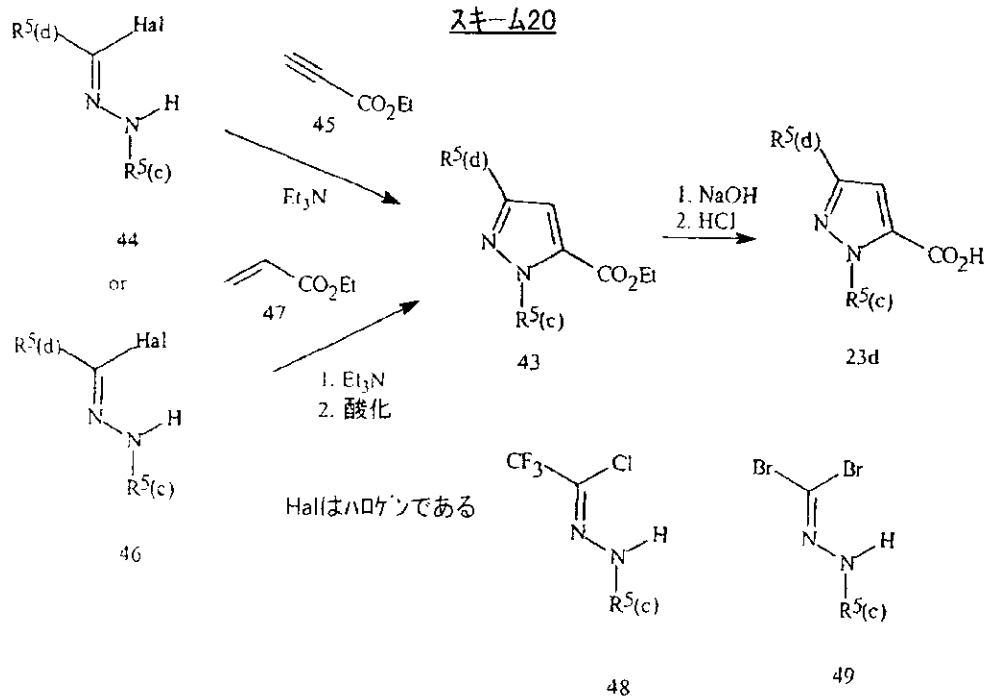
式23dのピラゾール酸類の別の合成はスキーム20に記載されている。それらは適当に置換されたニトリリイミンと式45の置換されたプロピオン酸エステル類または式47のアクリル酸エステル類のいずれかとの3+2付加環化により製造することができる。アクリル酸エステルとの付加環化は中間体ピラズリンからピラゾールへのさらなる酸化を必要とする。エステル類の加水分解が式23dのピラゾール酸類を与える。この反応に好ましいイミノハライド類は式48のトリフルオロメチルイミノクロリドおよび式49のイミノジブロミドを包含する。例えば48の如き化合物は既知である(J. Heterocycl. Chem. 1985, 22(2), 565-8)。例えば49の如き化合物は既知の方法により入手可能である(Tetrahedron Letters 1999, 40, 2605)。これらの工程は、R⁵(c)基が場合により置換されていてもよいフェニルでありそしてR⁵(d)基がハロアルキルまたはプロモである化合物の製造用に特に有用である。

20

【0083】

【化29】

スキーム20



30

40

【0084】

式39の出発ピラゾール類は既知の化合物である。式39aのピラゾール(R⁵(d)基がCF₃である式39の化合物)は市販されている。式39cのピラゾール類(R⁵(d)基がClまたはBrである式39の化合物)は文献工程により製造することができる(

50

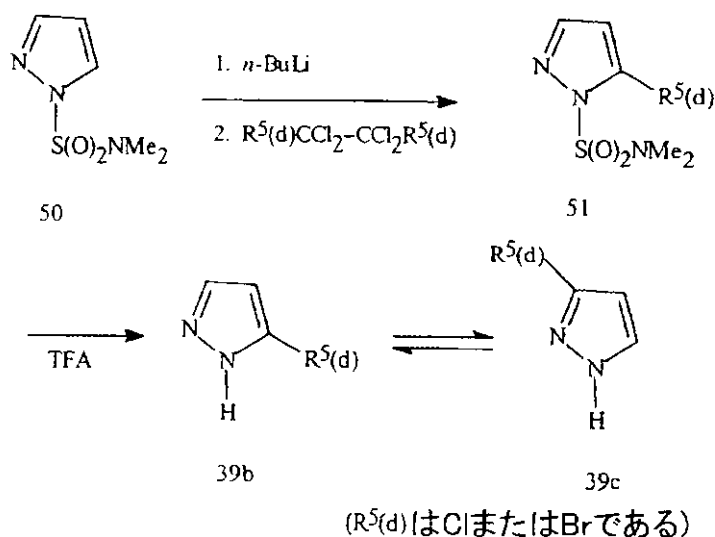
Chem. Ber. 1966, 99(10), 3350-7)。化合物39cの製造の有用な別の方法はスキーム21に記述されている。n-ブチルリチウムを用いる式50のスルファモイルピラゾールの金属処理およびその後のヘキサクロロエタン ($R^{5(d)}$ 基がClであるものの場合) または1, 2-ジブromotetraクロロエタン ($R^{5(d)}$ 基がBrであるものの場合) を用いるアニオンの直接的ハロゲン化が式51のハロゲン化された誘導体を与える。室温におけるトリフルオロ酢酸 (TFA) を用いるスルファモイル基の除去は明白に且つ良好な収率で進行して式39cのピラゾール類を与える。当業者は式39cが式39bの互変異性体であることを認識するであろう。

【0085】

【化30】

10

スキーム21



20

【0086】

30

式Iおよび式IIの化合物を製造するための上記の一部の試薬および反応条件は中間体に存在するある種の官能基と相容性でなくてもよいことは認識される。これらの場合には、合成中への保護／脱保護工程の導入または官能基相互転換が所望する生成物を得るのを助けるであろう。保護基の使用および選択は化学合成の専門家には明白であろう（例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991 参照）。当業者は、一部の場合には、式IおよびIIの化合物の合成を完了させるために詳細には記載されていない追加の定型的な合成段階を行う必要があるかもしれないことを認識するであろう。当業者はまた、式IおよびIIの化合物を製造するために示された特定の工程に含まれるもの以外の順序で上記のスキームに示された段階の組み合わせを行う必要があるかもしれないことを認識するであろう。

40

【0087】

当業者はまた、ここに記載された式IおよびIIの化合物並びに中間体に対して種々の求電気、求核、ラジカル、有機金属、酸化、および還元反応にかけて置換基を加えるかまたは存在する置換基を変更できることも認識するであろう。

【0088】

当業者は以上の記述を用いて本発明をその最大程度まで利用できることは容易に信じられよう。従って、下記の実施例は単なる説明用であり、開示を何らかの方法で制限するものではない。¹H NMRスペクトルはテトラメチルシランからのppmダウンフィールドで報告され、sは一重項であり、dは二重項であり、tは三重項であり、qは四重項であ

50

り、mは多重項であり、d dは二重項の二重項であり、d tは三重項の二重項であり、b r sは広い一重項である。m. p. は融点である。

【0089】

実施例 1

N-メチル-N'-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-1,8-ナフタレンジカルボキサミドの製造

段階 A: 8-[(メチルアミノ)カルボニル]-1-ナフタレンカルボン酸の製造

室温の無水1,8-ナフタル酸(5g、25.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド(50mL)中の攪拌された溶液に、N,N-ジメチルホルムアミド(5mL)中のメチルアミン(0.82g、26.5ミリモル)を加えた。反応混合物を2.5時間にわたり攪拌した。溶媒を減圧下で除去した。このようにして得られた粗製固体を少量のジエチルエーテルで洗浄しそして空気乾燥して生成物(5g)を与え、それは8-[(メチルアミノ)カルボニル]-1-ナフタレンカルボン酸および無水1,8-ナフタル酸をNM 10
R分析により測定して~7対1の比で含有していた。この物質をさらなる精製なしにその後の反応用に使用した。

【0090】

$^1\text{H NMR}$ (DMSO-d6) δ : 2.77 (二重項、3H)、7.55-7.65 (多重項、3H)、7.83 (二重項、1H)、8.03-8.12 (多重項、2H)、8.39 (四重項、1H)。

段階 B: N-メチル-N'-(2-ブロモ-4-フルオロフェニル)-1,8-ナフタレンジカルボキサミドの製造 20

~5℃に冷却された段階Aに記載された通りにして製造された8-[(メチルアミノ)カルボニル]-1-ナフタレンカルボン酸(22.3g、97.4ミリモル)およびピリジン(15.4g、0.195モル)のジクロロメタン(300mL)中の攪拌された溶液に窒素雰囲気下で、ジクロロメタン(50mL)中に希釈された無水トリフルオロ酢酸(22.5g、0.107モル)を滴下した。添加後に、反応混合物を周囲温度において30分間にわたりさらに攪拌した。少量の固体を濾別した。濾液を減圧下で濃縮して固体とし、それを熱いヘキサン(3×250mL)で抽出した。ヘキサン抽出物を一緒にしそして減圧下で濃縮して3-(メチルイミノ)-1H,3H-ナフト[1,8-cd]ピラン-1-オン(15g)の粗製生成物を与えた。 30

【0091】

このようにして得られた3-(メチルイミノ)-1H,3H-ナフト[1,8-cd]ピラン-1-オン(0.25g、1.19ミリモル)をジクロロメタン(3mL)中に溶解しそして2-ブロモ-4-フルオロアニリン(0.17g、1.45ミリモル)を加えた。反応混合物を室温において48時間にわたり攪拌した。固体を濾過し、集めそして少量のジクロロメタン中メタノールで洗浄しそして空気乾燥してN-メチルN'-(2-メチル-4-フルオロフェニル)-1,8-ナフタレンジカルボキサミドを与えた(0.12g、m. p. 249℃)。

【0092】

$^1\text{H NMR}$ (DMSO-d6) δ : 2.37 (一重項、3H)、2.72 (二重項、3H)、7.05-7.12 (多重項、2H)、7.54-7.64 (多重項、3H)、7.75-7.83 (多重項、2H)、8.05-8.10 (多重項、2H)、8.33 (四重項、1H)、9.84 (一重項、1H)。 40

【0093】

実施例 2

N-メチル8-[(3,4-ジフルオロフェニル)カルボニルアミノ]-1-ナフタレンカルボキサミドの製造

段階 A: N-メチル8-ニトロ-1-ナフタレンカルボキサミドの製造

室温の8-ニトロ-1-ナフタレンカルボン酸(1.5g、6.9ミリモル)、メチルアミン(0.22g、7.3ミリモル)、およびイミダゾール(0.68g、8.3ミリモ 50

ル)のN, N-ジメチルホルムアミド(12 mL)中の攪拌された溶液に、シアノホスホン酸ジエチル(1.24 g、7.6ミリモル)を加えた。反応混合物を一晩にわたり攪拌し、水(100 mL)中に注ぎそして酢酸エチル(3×100 mL)で抽出した。酢酸エチル抽出物を一緒にし、無水硫酸マグネシウム上で乾燥し、濾過し、そして減圧下で濃縮して固体を与え、それを少量のメタノールで洗浄して生成物(0.64 g)を与え、それをさらなる精製なしに使用した。

【0094】

¹H NMR(DMSO-d₆) δ: 2.76(二重項、3H)、7.72-8.37(多重項、6H)、8.66(広い四重項、1H)。

段階B: N-メチル8-アミノ-1-ナフタレンカルボキサミドの製造

メタノール(5 mL)およびジクロロメタン(15 mL)中のN-メチル8-ニトロ-1-ナフタレンカルボキサミド(0.5 g、2.17ミリモル)を触媒量のパラジウム(木炭上10%)を用いて30 psiの水素圧下で1時間にわたり水素化した。反応混合物をセライトを通して吸引濾過しそして減圧下で濃縮して生成物(0.42 g)を与え、それをさらなる精製なしに使用した。

【0095】

¹H NMR(DMSO-d₆) δ: 2.82(二重項、3H)、5.46(一重項、2H)、6.81-7.85(多重項、6H)、8.59(広い四重項、1H)。

段階C: N-メチル8-[(3,4-ジフルオロフェニル)カルボニルアミノ]-1-ナフタレンカルボキサミドの製造

N-メチル8-アミノ-1-ナフタレンカルボキサミド(0.2 g、1ミリモル)およびピリジン(0.24 g、3ミリモル)のジクロロメタン(10 mL)中の攪拌された溶液に、ジクロロメタン(2 mL)中の塩化アセチル(94.2 mg、1.2ミリモル)を一部分ずつ加えた。混合物を3時間にわたり攪拌した。固体を吸引濾過した(100 mg、m. p. > 250 °C)。

【0096】

¹H NMR(DMSO-d₆) δ: 2.43(二重項、3H)、7.46-8.10(多重項、9H)、8.51(広い四重項、1H)、10.13(一重項、1H)。

【0097】

実施例3

N-メチル8-[(2-チエニル)カルボニルアミノ]-1-ナフタレンカルボキサミドの製造

N-メチル8-アミノ-1-ナフタレンカルボキサミド(0.2 g、1ミリモル)およびピリジン(0.24 g、3ミリモル)のジクロロメタン(10 mL)中の攪拌された溶液に、ジクロロメタン(2 mL)中の2-チオフェンカルボン酸クロリド(176 mg、1.2ミリモル)を一部分ずつ加えた。混合物を3時間にわたり攪拌した。反応混合物を連続的に希塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、および水で洗浄した。溶媒を減圧下で部分的に除去した。このようにして製造された固体を吸引濾過で集めた(36 mg、m. p. 210 °C)。

【0098】

¹H NMR(DMSO-d₆) δ: 2.53(二重項、3H)、7.26-8.10(多重項、9H)、8.66(広い四重項、1H)、10.17(一重項、1H)。

【0099】

当該技術で既知の方法と一緒にしたここに記載された工程により、表1~10の下記の化合物を製造することができる。下記の略語が表で使用される: tは第三級であり、sは第二級であり、nはノルマルであり、iはイソであり、cはシクロであり、Meはメチルであり、Etはエチルであり、Prはプロピルであり、i-Prはイソプロピルであり、t-Buはtertブチルであり、Phはフェニルであり、OMeはメトキシであり、OEtはエトキシであり、SMeはメチルチオであり、SEtはエチルチオであり、CNはシアノであり、NO₂はニトロであり、TMSはトリメチルシリルであり、S(O)Meは

10

20

30

40

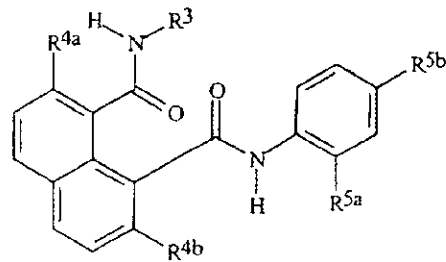
50

メチルスルフィニルであり、そして $S(O)_2Me$ はメチルスルホニルである。

【0100】

【表1】

表1



10

R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	Me	H	CF_3	Me	H	H	H	CF_3
Me	H	Me	H	OCF_3	Me	H	H	H	OCF_3
Et	H	Me	H	OCF_3	Et	H	H	H	OCF_3
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF_3	Me	H	H	Me	CF_3
Me	H	Me	Me	OCF_3	Me	H	H	Me	OCF_3
Et	H	Me	Me	CF_3	Et	H	H	Me	CF_3

20

【0101】

【表2】

30

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃	
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂	
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂	
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃	
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅	
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅	
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃	
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃	10
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃	
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃	
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃	
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe	
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe	
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt	
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et	20
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me	
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me	
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃	
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃	
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂	
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅	30
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅	
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃	
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br	
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl	
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃	
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃	40

【 0 1 0 2 】

【 表 3 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃

10

20

30

40

【 0 1 0 3 】

【 表 4 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃

10

20

30

40

【 0 1 0 4 】

【 表 5 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	Ph	Br
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	2-ヒリジル	Cl

10

20

30

40

【 0 1 0 5 】

【 表 6 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	Me	OMe
Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅					

10

20

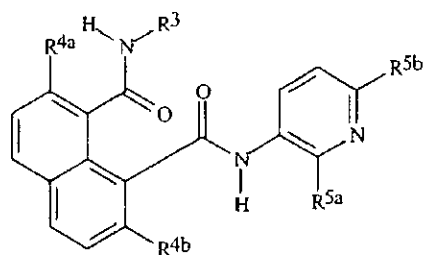
30

40

【 0 1 0 6 】

【 表 7 】

表2



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et

【 0 1 0 7 】

【 表 8 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 0 8 】

【 表 9 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇

10

20

30

40

【 0 1 0 9 】

【 表 1 0 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et	
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me	
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃	
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me	
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃	10
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃	
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃	
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂	
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇	
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇	20
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br	
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl	
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃	
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃	
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl	
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br	
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CF ₃	
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	Cl	
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃	
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃	30
Me	Me	H	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br	
Me	Me	H	2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl	
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂	
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	40

【 0 1 1 0 】

【 表 1 1 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 1 1 】

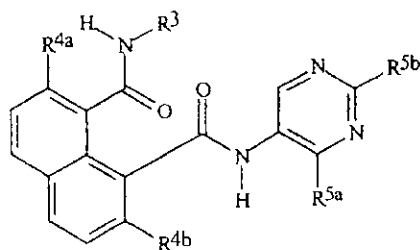
【 表 1 2 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

10

20

表3



30

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃

40

【 0 1 1 2 】

【 表 1 3 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃	
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃	
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃	
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂	
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂	
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃	
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅	
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅	10
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃	
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃	
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃	
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃	
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃	
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe	
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe	
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt	
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇	20
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et	
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me	
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me	
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃	
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃	30
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂	
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅	
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅	
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃	
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br	
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl	40

【 0 1 1 3 】

【 表 1 4 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I

10

20

30

40

【 0 1 1 4 】

【 表 1 5 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃	
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃	
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃	
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃	
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂	
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂	
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃	
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅	10
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃	
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃	
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃	
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃	
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃	
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe	
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe	
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt	
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇	20
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇	
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et	
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me	
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃	
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me	
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃	30
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃	
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃	
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂	
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇	
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇	
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br	40

【 0 1 1 5 】

【 表 1 6 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂

10

20

30

40

【 0 1 1 6 】

【 表 1 7 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

10

20

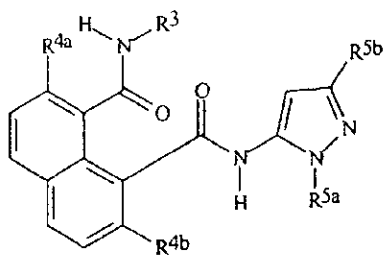
30

40

【 0 1 1 7 】

【 表 1 8 】

表4



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	OCF ₃	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂

10

20

30

40

【 0 1 1 8 】

【 表 1 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CHF ₂	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	CHF ₂	Me	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	Et	Br

10

20

30

40

【 0 1 1 9 】

【 表 2 0 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	Cl	
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Et	Cl	
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	I	
Me	Me	H	Et	Cl	Me	H	Cl	Me	CF ₃	
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	OCF ₃	
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	CF ₃	
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	SCF ₃	
Et	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂	10
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂	
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃	
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅	
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CF ₃	
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃	
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃	
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe	
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe	
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	OEt	20
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇	
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇	
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	Et	
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me	
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃	
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	CF ₃	Me	
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CF ₃	30
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	Ph	Cl	
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	Br	
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ヒリゾル	CF ₃	
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ヒリゾル	Cl	
Me	Me	H	2-ヒリゾル	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ヒリゾル	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br	
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl	
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂	40

【 0 1 2 0 】

【 表 2 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃	
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-OMe	CF ₃	10
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Br	
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	
Me	Me	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃	20
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Br	
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Cl	
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	Et	CF ₃	
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	Me	SMe	
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	Me	OMe	30
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	Me	OEt	
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	Et	
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	CF ₃	Me	40

【 0 1 2 1 】

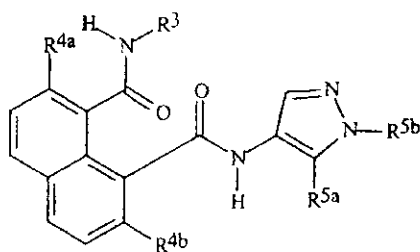
【 表 2 2 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	OMe	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	Ph	Br
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	2-OMe	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	2-ClPh	Br	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃

10

20

表5



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Et	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CBrF ₂	Me	H	H	Me	CBrF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂

30

40

【 0 1 2 2 】

【 表 2 3 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Et	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	n-Pr	Me	H	H	Me	n-Pr
Me	H	Me	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
n-Pr	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CHF ₂	Me	H	H	i-Pr	CHF ₂
Me	H	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	F	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	CClF ₂	Me	H	H	Me	CClF ₂
Me	H	Me	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	アリル	Me	H	H	Me	アリル
Me	H	Me	Et	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	i-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	OMe	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	i-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Ph	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂

10

20

30

40

【 0 1 2 3 】

【 表 2 4 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CHF ₂	Me	H	H	2-ヒリジル	CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	Et	Me	H	H	2-ClPh	Et
Me	H	Me	2-ClPh	CBrF ₂	Me	H	H	2-ClPh	CBrF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CBrF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CBrF ₂
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CClF ₂	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CClF ₂
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Et	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Et	CHF ₂
Me	Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 2 4 】

【 表 2 5 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	CBrF ₂	Me	H	Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Et	H	Cl	Me	CHF ₂
Et	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	CBrF ₂
Me	Me	H	Me	n-Pr	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	n-Pr	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	n-Pr
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	i-Pr	CHF ₂	Me	H	Cl	Cl	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	F	CHF ₂
Me	Me	H	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CClF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CH ₂ Cl
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CClF ₂
Me	Me	H	Me	Allyl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	7/1ル
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	Me
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Et	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 2 5 】

【 表 2 6 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CHF ₂
Me	Me	H	2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-ヒリジル	CHF ₂	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	Et	Me	H	Cl	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	CBrF ₂	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Et
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CBrF ₂
Me	Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CBrF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CBrF ₂
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	3-Me-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CClF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	F	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	CHF ₂
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 2 6 】

【 表 2 7 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CH ₂ Cl
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CClF ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇
Et	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CBrF ₂	Me	Cl	H	Me	7リル
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	i-C ₃ F ₇
n-Pr	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	n-Pr	Me	Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂
Et	Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	Me
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CHF ₂	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂	Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CBrF ₂	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-F-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CClF ₂	Me	Cl	H	Ph	CHF ₂
Me	Cl	H	2-ClPh	CHF ₂	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-ClPh	Et	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	2-ClPh	CBrF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃					

10

20

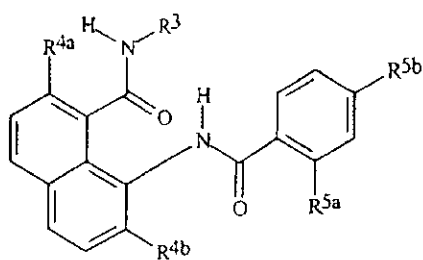
30

40

【 0 1 2 7 】

【 表 2 8 】

表6



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et

10

20

30

40

【 0 1 2 8 】

【 表 2 9 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 2 9 】

【 表 3 0 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇

10

20

30

40

【 0 1 3 0 】

【 表 3 1 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et	
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me	
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃	
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me	
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃	10
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃	
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃	
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂	
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇	
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇	20
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br	
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl	
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃	
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃	
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl	
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br	
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CF ₃	
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	Cl	
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃	
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃	30
Me	Me	H	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br	
Me	Me	H	2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl	
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂	
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	40

【 0 1 3 1 】

【 表 3 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 3 2 】

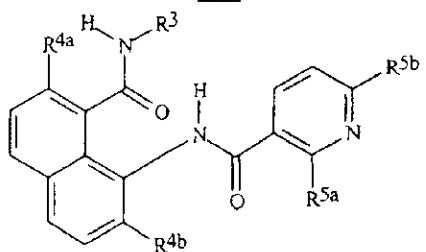
【 表 3 3 】

R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2- ピリジル	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2- ピリジル	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

10

20

表7



R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃

30

40

【 0 1 3 3 】

【 表 3 4 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃	
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃	
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃	
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂	
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂	
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃	
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅	10
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅	
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃	
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃	
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃	
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃	
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃	
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe	
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe	
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt	
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇	20
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et	
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me	
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me	
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃	
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃	30
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂	
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅	
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅	
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃	
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br	
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl	40

【 0 1 3 4 】

【 表 3 5 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I

10

20

30

40

【 0 1 3 5 】

【 表 3 6 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br

10

20

30

40

【 0 1 3 6 】

【 表 3 7 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	Me	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂

10

20

30

40

【 0 1 3 7 】

【 表 3 8 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃	Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

10

20

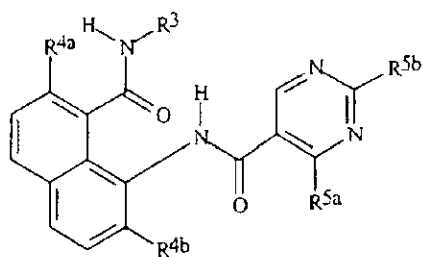
30

40

【 0 1 3 8 】

【 表 3 9 】

表8



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et

10

20

30

40

【 0 1 3 9 】

【 表 4 0 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 4 0 】

【 表 4 1 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇

10

20

30

40

【 0 1 4 1 】

【 表 4 2 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et	
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me	
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃	
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me	
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃	10
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃	
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅	
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃	
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂	
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂	
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇	
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇	20
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br	
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl	
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃	
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃	
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl	
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br	
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-トリジル	CF ₃	
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-トリジル	Cl	
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃	
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃	30
Me	Me	H	2-トリジル	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br	
Me	Me	H	2-トリジル	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl	
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂	
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃	
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	40

【 0 1 4 2 】

【 表 4 3 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 4 3 】

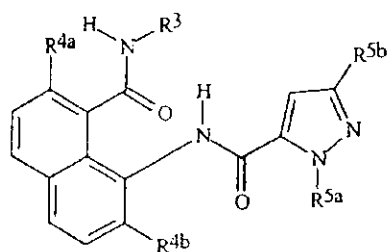
【 表 4 4 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

10

20

表9



30

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃

40

【 0 1 4 4 】

【 表 4 5 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃	
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃	
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃	
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂	
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂	
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃	
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅	
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅	10
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃	
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃	
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃	
Me	H	Me	i-Pr	OCF ₃	Me	H	H	Me	SMe	
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	OMe	
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OEt	
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇	
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	Et	
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	20
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SO ₂ Me	
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	
Me	H	Me	CHF ₂	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	Me	
Me	H	Me	CHF ₂	Me	Me	H	H	Ph	CF ₃	
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	Cl	
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Br	
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₃	30
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-ヒリジル	Cl	
Me	H	Me	2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃	
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃	
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	Br	
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Cl	
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂	
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃	
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃	
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃	40

【 0 1 4 5 】

【 表 4 6 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Cl	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Et	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	OEt

10

20

30

40

【 0 1 4 6 】

【 表 4 7 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OEI	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-OMe	CF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 4 7 】

【 表 4 8 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Br
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	Et	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	Me	SMe
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	Me	OMe
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	Me	OEt
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	Et
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	CF ₃	Me
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	OMe	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	Ph	Br
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ヒリジル	Cl
Me	Cl	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	OCF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Br	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	Cl	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-McPh	CF ₃
Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	2-OMe	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃

10

20

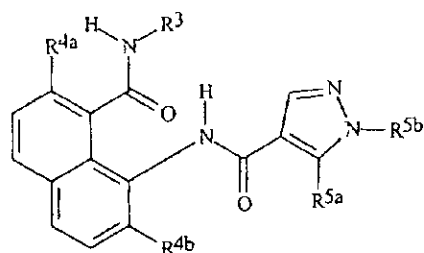
30

40

【 0 1 4 8 】

【 表 4 9 】

表10



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Et	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CBrF ₂	Me	H	H	Me	CBrF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂
Et	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	n-Pr	Me	H	H	Me	n-Pr
Me	H	Me	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
n-Pr	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CHF ₂	Me	H	H	i-Pr	CHF ₂
Me	H	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	F	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	CClF ₂	Me	H	H	Me	CClF ₂
Me	H	Me	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	アリル	Me	H	H	Me	アリル

10

20

30

40

【 0 1 4 9 】

【 表 5 0 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Et	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	i-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	OMe	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	i-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Ph	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂
Me	H	Me	2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CHF ₂	Me	H	H	2-ヒリジル	CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	Et	Me	H	H	2-ClPh	Et
Me	H	Me	2-ClPh	CBrF ₂	Me	H	H	2-ClPh	CBrF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 5 0 】

【 表 5 1 】

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-ヒリジル	CBrF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CBrF ₂
Me	H	Me	3-F-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-ヒリジル	CClF ₂	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CClF ₂
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Et	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Et	CHF ₂
Me	Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CBrF ₂	Me	H	Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Et	H	Cl	Me	CHF ₂
Et	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	CBrF ₂
Me	Me	H	Me	n-Pr	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	n-Pr	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	n-Pr
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	i-Pr	CHF ₂	Me	H	Cl	Cl	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	F	CHF ₂
Me	Me	H	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CClF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CH ₂ Cl

10

20

30

40

【 0 1 5 1 】

【 表 5 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CClF ₂
Me	Me	H	Me	アリル	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	アリル
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	Me
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Et	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CHF ₂
Me	Me	H	2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-ヒリジル	CHF ₂	Me	H	Cl	2-CIPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-CIPh	Et	Me	H	Cl	2-CIPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-CIPh	CBrF ₂	Me	H	Cl	2-CIPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-CIPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	CHF ₂
Me	Me	H	2-CIPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CIPh	Et
Me	Me	H	2-CIPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CBrF ₂
Me	Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 5 2 】

【 表 5 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CBrF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-ヒリジル	CBrF ₂
Me	Me	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2- ヒリジル	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	3-Me-2- ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CClF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃	Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	Ph	CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Et	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CBrF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CHF ₂
n-Pr	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	2-ClPh	Et
Me	Cl	H	Me	n-Pr	Me	Cl	H	2-ClPh	CBrF ₂
Et	Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CHF ₂	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	F	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 1 5 3 】

【 表 5 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ Cl	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CClF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CHF ₂
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-ヒリジル	CBrF ₂
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-F-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Me-2- ヒリジル	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	3-CF ₃ -2- ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-ヒリジル	CClF ₂
Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	H	Me	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Et	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	アリル
Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃					

10

20

【0154】

調合物／用途

本発明の化合物は一般的には液体希釈剤、固体希釈剤または界面活性剤の少なくとも1種を含んでなる農業的に適する担体との調合物または組成物として使用されるであろう。調合物または組成物成分は活性成分の物理的性質、適用方式並びに環境要素、例えば土のタイプ、水分および温度のような環境因子と適合するように選択される。有用な調合物は、液体、例えば液剤（濃厚乳剤を含む）、懸濁剤、乳剤（微細乳剤および／または懸濁乳剤を含む）などを包含し、それらは場合によりゲル状に濃厚化されていてもよい。有用な調合物はさらに固体、例えば、散剤、粉剤、粒剤、ペレット、錠剤、フィルムなどを包含し、それらは水一分散性（水和性）または水溶性でありうる。活性成分は（マイクロ）カプセル化してもよくそしてさらに懸濁剤または固体調合物にしてもよく、或いは活性成分の調合物全体をカプセル化しても（または「オーバーコート」しても）よい。カプセル化は活性成分の放出を調節または遅延させる。噴霧可能な調合物を適当な媒体中で延展しそして1ヘクタール当たり約1～数百リットルの噴霧容量で使用することもできる。高強度組成物は主としてさらなる調合の中間体として使用される。

30

【0155】

調合物は典型的には有効量の活性成分、希釈剤および界面活性剤をほぼ下記の範囲内で含有しており、それらは合計で100重量%となる。

40

	重量%		
	活性成分	希釈剤	界面活性剤
水一分散性および水溶性 粒剤、錠剤および粉剤	5-90	0-94	1-15
懸濁剤、乳剤、液剤 (濃厚乳剤を含む)	5-50	40-95	0-15
散剤	1-25	70-99	0-5
粒剤およびペレット	0.01-99	5-99.99	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

代表的な固体希釈剤は Watkins, et al., Handbook of Ins 50

ecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey に記載されている。代表的な液体希釈剤および溶媒は Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950 に記載されている。McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridge wood, New Jersey 並びに Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964 は界面活性剤およびその推奨用途を示している。全ての調合物は、泡立ち、ケーキ化、腐食、微生物の成長などを減ずるために少量の添加剤を含有することができる。 10

【0156】

界面活性剤は、例えば、ポリエトキシシル化アルコール類、ポリエトキシシル化アルキルフェノール類、またはエトキシシル化ソルビタン脂肪酸エステル類、スルホ琥珀酸ジアルキル類、硫酸アルキル類、スルホン酸アルキルベンゼン類、有機シリコン類、N, N-ジアルキルタウレート類 (N, N-dialkyltaurates)、リグニンスルホネート類、ナフタレンスルホネートホルムアルデヒド縮合物、ポリカルボキシレート類、およびポリオキシエチレン/ポリオキシプロピレンブロック共重合体を包含する。固体希釈剤は、例えば、粘土、例えばベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリン、澱粉、糖、シリカ、滑石、珪藻土、ウレア、炭酸カルシウム、炭酸および炭酸水素ナトリウム、並びに硫酸ナトリウムを包含する。液体希釈剤は、例えば、水、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン、エチレングリコール、ポリプロピレングリコール、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、オリーブ油、ヒマシ油、アマニ油、桐油、ゴマ油、トウモロコシ油、南京豆油、綿実油、大豆油、菜種油およびヤシ油、脂肪酸エステル類、ケトン類、例えばシクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノン、並びにアルコール類、例えばメタノール、シクロヘキサノール、デカノールおよびテトラヒドロフルフリルアルコールを包含する。 20

【0157】

濃厚乳剤を含む液剤は、成分を単に混合することにより製造される。配合しそして一般的にはハンマーミルまたは流体エネルギーミル中で粉碎することにより散剤および粉剤を製造できる。懸濁剤は一般的には湿式ミル処理により製造され、例えば、U. S. 3, 060, 084 を参照のこと。粒剤およびペレットは、活性物質を予備成形した粒状担体上に噴霧することによりまたは凝集法により製造することができる。Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 以下および PCT 公開 WO 91/13546 を参照のこと。ペレットは U. S. 4, 172, 714 に記載されている通りにして製造できる。水一分散性および水溶性の粒剤は U. S. 4, 144, 050、U. S. 3, 920, 442 および DE 3, 246, 493 に教示されている通りにして製造できる。錠剤は U. S. 5, 180, 587、U. S. 5, 232, 701 および U. S. 5, 208, 030 に教示されている通りにして製造できる。フィルムは GB 2, 095, 558 および U. S. 3, 299, 566 に教示されている通りにして製造できる。調合の技術に関するさらなる情報に関しては、T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food - Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on P 30 40 50

esticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133 を参照のこと。U. S. 3, 235, 361、6欄16行-7欄19行および実施例10-41；U. S. 3, 309, 192、5欄43行-7欄62行および実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167および169-182；U. S. 2, 891, 855、3欄66行-5欄17行および実施例1-4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96；並びに Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 も参照のこと。

10

【0158】

下記の実施例において、全ての百分率は重量によるものでありそして全ての調合物は一般的な方法で製造される。化合物番号は索引表A中の化合物を照合する。

【0159】

実施例A水和剤

化合物1	65.0%
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%
シリコアルミン酸ナトリウム	6.0%
モンモリロナイト（か焼された）	23.0%

20

実施例B粒剤

化合物7	10.0%
アタパルジャイト顆粒（低揮発性物質、 0.71/0.30mm、 U. S. S. No. 25-50ふるい）	90.0%

実施例C押し出しペレット

化合物1	25.0%
無水硫酸ナトリウム	10.0%
粗製リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%

30

実施例D濃厚乳剤

化合物7	20.0%
可溶性スルホネート類およびポリオキシエチレン エーテル類の配合物	10.0%
イソホロン	70.0%

40

実施例E粒剤

化合物1	0.5%
セルロース	2.5%
ラクトース	4.0%
コーンミール	93.0%

本発明の化合物は好ましい代謝および／または土壌残留パターンにより特徴づけられそして農耕および非農耕無脊椎有害生物域を抑制する活性を示す。（この開示の概念では「無脊椎有害生物抑制」は有害生物により引き起こされる飼育中のまたは他の損傷もしくは被

50

害の有意な減少をもたらす無脊椎有害生物発育の抑制（死亡を含む）を意味し、関連する表現も同様に定義される。）この開示に言及すると、用語「無脊椎有害生物」は有害生物として経済的に重要な節足動物（arthropods）、腹足類（gastropods）および線虫類（nematodes）を包含する。用語「節足動物」は昆虫類、ダニ類、蜘蛛類、サソリ類、ムカデ類、多足類、ワラジムシ類およびコムカデ類を包含する。用語「腹足類」は腹足類（snails）、移動体（slugs）および他のマイマイ目（Stylommatoptera）を包含する。用語「線虫類」は全ての寄生虫、例えば、回虫、イヌシジョウチュウ、および植物食性線虫（Nematoda）、吸虫類（Trematoda）、鉤頭動物（Acanthocephala）、および条虫類（Cestoda）を包含する。当業者は、必ずしも全ての化合物が全ての有害生物に対して同等に有効ではないことを認識するであろう。本発明の化合物は経済的に重要な農耕、林業、温室作物、装飾物、食品および繊維、公衆および動物の健康、室内および商業用構造体、家財、並びに貯蔵された製品の有害生物に対して活性を示す。これらはチョウ（Lepidoptera）目、例えばヤガ（Noctuidae）科のアワヨトウ類、ヨトウムシ類、シャクトリムシ類、およびヘリオシン類（例えば、フォル・アーミーウォーム（Spodoptera fugiperda J. E. Smith）、ビート・アーミーウォーム（Spodoptera exigua Huebner）、ブラック・カットウォーム（Agrotis ipsilon Hufnagel）、キャベツ・ルーパー（Trichoplusia ni Huebner）、タバコ・バッドウォーム（Heliothis virescens Fabricius））；メイガ（Pyralidae）科からのキクイムシ類、ケースベアラー類、ノメイガ類、コーンウォーム類、アオムシ類およびスケルトナイザー類（例えば、ヨーロピアン・コーン・ボラー（Ostrinia nubilalis Huebner）、ナベル・オレンジウォーム（Amyelois transitella Walker）、コーン・ルート・ウエブウォーム（Crambus caliginosellus Clemens）、ソッド・ウエブウォーム（Herpetogramma licarsisalis Walker））、ハマキガ（Tortricidae）科のハマキムシ類（leaf rollers）、バッドウォーム類（budworms）、シードウォーム類（seed worms）、およびフルーツウォーム類（fruit worms）（例えば、コドリグ・モス（Cydia pomonella Linnaeus）、グレープ・ベリー・モス（Endopiza viteana Clemens）、オリエンタル・フルーツ・モス（Grapholita molesta Busck））、並びに多くの他の経済的に重要な鱗翅目（Lepidoptera）（例えば、ダイアモンドバック・モス（Plutella xylostella Linnaeus）、ピンク・ボールウォーム（Pectinophora gossypiella Saunders）、ジブシー・モス（Lymantria dispar Linnaeus））の幼虫；ブラッテリダエ（Blattellidae）およびゴキブリ科（Blattidae）からのゴキブリを包含するゴキブリ亜目の若虫および成虫（例えば、オリエンタル・コックローチ（Blatta orientalis Linnaeus）、アジア・コックローチ（Blattella asahinai Mizukubo）、ジャーマン・コックローチ（Blattella germanica Linnaeus）、ブラウンバンデッド・コックローチ（Supella longipalpa Fabricius）、アメリカン・コックローチ（Periplaneta americana Linnaeus）、ブラウン・コックローチ（Periplaneta brunnea Burmeister）、メデイラ・コックローチ（Leucophaea maderae Fabricius））；ヒゲナガゾウムシ科（Anthribidae）、マメゾウムシ科（Bruchidae）、およびゾウムシ科（Curculionidae）科からのゾウムシ類を包含する甲虫目（Coleoptera）の葉を食べる幼虫および成虫（例えば、ボール・ウィービル（Anthrenus grandis Boheman）、ライス・ウォーター・ウィービル（Lissorhoptrus oryzophilus Kuschel）、グラナリー・ウィービル（S

itophilus granarius Linnaeus)、ライス・ウィービル (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)) ; ハムシ (Chrysomelidae) 科のノミハムシ類、ウリハムシ類、ネクイムシ類、ハムシ類、ポテトビートル類、およびハモグリムシ類 (例えば、コロラド・ポテト・ビートル (*Leptinotarsa decemlineata* Say)、ウエスタン・コーン・ルーツウォーム (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)) ; スカリバエイダエ (Scarabaeidae) 科からのコガネムシ類および他の甲虫類 (例えば、ジャパニーズ・ビートル (*Popillia japonica* Newman) およびヨーロッパアン・シェファー (*Rhizotrogus majalis*)) ; カツオブシムシ (Dermestidae) 科からのヒメマルカツオブシムシ類 ; コメツキムシ (Elateridae) 科からのハリガネムシ類 ; キクイムシ (Scolytidae) 科からのキクイムシ類並びにゴミムシダマシ (Tenebrionidae) 科からのコクヌストモドキ類を包含する。さらにそれは、クギヌキハサミムシ (Forficulidae) 科からのハサミムシ類を包含する革翅目 (Dermaptera) の成虫および幼虫 (例えば、ヨーロッパアン・イアウィッグ (*Forficula auricularia* Linnaeus)、ブラック・イアウィッグ (*Chelisoches morio* Fabricius)) ; 半翅目 (Hemiptera) および同翅目 (Homoptera) の成虫および若虫、例えば、メクラカメムシ (Miridae) 科からのメクラカメムシ類、セミ (Cicadidae) 科からのセミ類、ヒメヨコバイ (Cicadellidae) 科からのヨコバイ類 (例えば、エンポアスカ (*Empoasca* 種)、ビワハゴロモ (*Fulgoroidea*) 科およびデルファシダエ (*Delphacidae*) 科からのプラントホッパー類、ツノゼミ (*Membracidae*) 科からのツノゼミ類、キジラミ (*Psyllidae*) 科からのキジラミ類、コナジラミ (*Aleyrodidae*) 科からのコナジラミ類、アブラムシ (*Aphididae*) 科からのアブラムシ類、ネアブラムシ (*Phylloxera*) 科からのネアブラムシ類、コナカイガラムシ (*Pseudococcidae*) 科からのコナカイガラムシ類、カタカイガラムシ (*Coccidae*) 科、マルカイガラムシ (*Diaspididae*) 科およびマルガロディダエ (*Margarodidae*) 科からのカイガラムシ類、グンバイムシ (*Tingidae*) 科からのグンバイムシ類、カメムシ (*Plantatommidae*) 科からのカメムシ類、ナガカメムシ (*Lygaeidae*) 科からのシンチバグ類 (例えば、ブリスス (*Blissus*) 種) および他のシードバグ類、アワフキムシ (*Cercopidae*) 科からのアワフキムシ類、ヘリカメムシ (*Coreidae*) 科からのヘリカメムシ類、並びにホシカメムシ (*Pyrrhocoridae*) 科からのレッドバグ類およびアカホシカメムシ類を包含する。他のダニ目 (Acarina) (ダニ類) の成虫および幼虫、例えばナミナダニ (*Tetranychidae*) 科からのスパイダーマイト類およびレッドマイト類 (red mites) (例えば、ヨーロッパアン・レッド・マイト (*Panonychus ulmi* Koch)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae* Koch)、マックダニエル・マイト (*Tetranychus medanieli* McGregor))、テヌイパルピダエ (*Tenuipalpidae*) 科からのフラットマイト類 (例えば、サイトラス・フラット・マイト (*Brevipalpus lewisi* McGregor))、フシダニ (*Eriophyidae*) 科からのサビダニ類およびバドマイト類、並びに他の葉を食べるダニ類および人間や動物の健康で重要なダニ類、すなわちエピデルモプチダエ (*Epidermoptidae*) 科からのサビダニ類、デモジシダエ (*Demodiciidae*) 科からのニキビダニ類、グリシファギダエ (*Glycyphagidae*) 科からのグレインマイト類、マダニ目 (Ixodidae) のマダニ類 (例えば、ディア・ティックス (*Ixodes scapularis* Say)、オーストラリアン・パラリシス・ティック (*Ixodes holocyclus* Neumann)、アメリカン・ドッグ・ティック (*Dermacentor variabilis* Say)、ローン・スター・ティック (*Amblyomma americanum* Linnaeus))、並びにソロプチダエ (

Psoroptidae)、ピエモチダエ(Pyemotidae)、およびサルコプチ
 ダエ(Sarcoptidae)科の癬皮ダニおよびヒゼンダニ;バッタ類、イナゴ類お
 よびコオロギ類を包含する直翅目(Orthoptera)の成虫および幼虫(例えば回
 遊性バッタ類(例えば、*Melanoplus sanguinipes* Fabricius、*M. differentialis* Thomas)、アメリカバッタ類(例えば
Schistocerca americana Drury)、砂漠イナゴ(例えば
Schistocerca gregaria Forskal)、回遊性イナゴ(*Locusta migratoria* Linnaeus)、イエコオロギ(*Achetadomesticus* Linnaeus)、ケラ類(*Gryllotalpa*));ハモ
 グリムシ類、ユスリカ類、ミバエ類(Tephritidae)、キモグリバエ類(*Oscinella frit* Linnaeus)、土壌ウジ類、イエバエ類(*Musca domestica* Linnaeus)、小型イエバエ類(例えば、*Fannia canicularis* Linnaeus、*F. femoralis* Stein)、サシ
 バエ類(例えば、*Stomoxys calcitrans* Linnaeus)、フェー
 スフライ類、ツノサシバエ類、ブローフライ類(例えば、*Chrysomya* 種、*Phormia* 種)、並びに他の苔ハエ有害生物、ウシアブ類(例えば、*Tabanus* 種)、ウマバエ類(例えば、*Gastrophilus* 種、*Oestrus* 種)、ウシバ
 エ類(例えば、*Hypoderma* 種)、シカバエ類(例えば、*Chrysops* 種)、シラミバエ類(例えば、*Melophagus ovinus* Linnaeus)およ
 び他のブラチセラ(Brachycera)、蚊類(例えば、*Aedes* 種、*Anopheles* 種、*Culex* 種)、ブユ類(例えば、*Prosimulium* 種、*Simulium* 種)、ヌカカ類、チョウバエ類、スシアリド類、および他の蚊垂目(Nematocera)を包含する双翅目(Diptera)の成虫および幼虫;タマネギ
 アザミウマ類(*Thrips tabaci* Lindeman)および他の葉を食べるア
 ザミウマ類を包含する総翅目(Thysanoptera)の成虫および幼虫;アリ類(例えば、レッド・カーペンター・アント(*Camponotus ferrugineus* Fabricius)、ブラック・カーペンター・アント(*Camponotus pennsylvanicus* De Geer)、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis* Linnaeus)、小型ハリアリ(*Wasmannia auropunctata* Roger)、ハリアリ(*Solenopsis geminata* Fabricius)、レッド・インポータド・ファイアー・アント(*Solenopsis invicta* Buren)、アルゼンチンアリ(*Iridomyrmex humilis* Mayr)、クレイジー・アント(*Paratrechina longicornis* Latreille)、ペープメント・アント(*Tetramorium caespitum* Linnaeus)、コーンフィールド・アント(*Lasius alienus* Foerster)、悪臭イエアリ(*Tapinoma sessile* Say))、ハチ類(クマバチ類を包含する)、スズメバチ類、ホホナガスズメバチ類およ
 びジガバチ類を包含する膜翅目(Hymenoptera)の昆虫有害生物;イースタ
 ン・サブテラネアン・テルマイト(*Reticulitermes flavipes* Kollar)、ウエスタン・サブテラネアン・ターマイト(*Reticulitermes hesperus* Bnaks)、フォルモサン・サブテラネアン・ターマイト(*Coptotermes formosanus* Shiraki)、ウエスト・インディアン・ドライウッド・ターマイト(*Incisitermes immigrans* Snyder)および経済的に重要な他のシロアリ類を包含する等翅目(Isoptera)の昆虫有害生物;シミ目(Thysanura)、例えばシミ(*Lepisma saccharina* Linnaeus)およびマダラシミ(*Thermobia domestica* Packard)の昆虫有害生物;アタマジラミ(*Pediculus humanus capitis* De Geer)、キモノジラミ(*Pediculus humanus humans* Linnaeus)、ニワトリキモノジラミ(*Menacanthus stramineus* Nitszch)、犬を囓むシラミ(*Trichodectes*

canis De Geer)、ワタジラミ (Goniocotes gallinae De Geer)、ヒツジキモノジラミ (Bovicola ovis Schrank)、ショートノーズド・キャトル・ラウス (Haematopinus eurysternus Nitzsch)、ロングノーズド・キャトル・ラウス (Linognathus vituli Linnaeus) 並びに人間および動物を攻撃する他の吸うおよび噛む寄生性蚤を包含する食毛目 (Mallophaga) の昆虫有害生物; オリエンタル・ラット・フレア (Xenopsylla chopis Rthschild)、ネコノミ (Ctenocephalides felis Bouche)、イヌノミ (Ctenocephalides canis Curtis)、ニワトリノミ (Ceratophyllus gallinae Schrank)、センダングサノミ (Echidnophaga gallinacea Westwood)、ヒトノミ (Pulex irritans Linnaeus) 並びに哺乳動物および鳥類を悩ます他の蚤類を包含するシフォノプテラ (Siphonoptera) の昆虫有害生物も包含される。含まれる別の節足動物有害生物は、クモ目 (Araneae) のクモ類、例えばブラウン・レクルース・スパイダー (Loxosceles relusa Gertsch & Mulai k) およびブラック・ウィドウ・スパイダー (Latrodectus mactans Fabricius)、並びにゲジ目 (Scutigera) のムカデ類、例えばイエムカデ (Scutigera coleoptrata Linnaeus) を包含する。円虫目 (Strongylida)、回虫目 (Ascaridida)、蟯虫目 (Oxyurida)、杆線虫目 (Rhabditida)、旋尾線虫目 (Spirurida) およびエノプルス目 (Enoplida) の経済的に重要な構成員を包含する線虫綱 (Nematoda)、条虫綱 (Cestoda)、吸虫綱 (Trematoda)、および鉤頭虫綱 (Acanthocephala) の構成員、例えば限定するものではないが、経済的に重要な農業有害生物 (すなわち、キタネコブ線虫 (Meloidogyne) 属のネコブ線虫、ネグサレセンチュウ (Pratylenchus) 属の病変線虫、トリコドルス (Trichodorus) 属の切り株根線虫など) 並びに動物および人間の健康上の有害生物 (すなわち全ての経済的に重要な吸虫類、条虫、および回虫、例えばウマの Strongylus vulgaris、イヌの Toxocara canis、ヒツジの Haemonchus contortus、イヌの Dirofilaria immitis Leidy、ウマの Anoplocephala perfoliata、反芻動物の Fasciola hepatica Linnaeus など) も包含される。

【0160】

本発明の化合物は鱗翅目 (Lepidoptera) (例えば、Alabama argillacea Huebner (綿葉の蠕虫)、Archips argyrospila Walker (果樹葉ブッポウソウ)、A. rosana Linnaeus (ヨーロッパ・リーフ・ローラー) および他の Archips 種、Chilo suppressalis Walker (イネ茎・キクイムシ)、Cnaphalocrosis medinalis Guenee (イネ葉・キクイムシ)、Grambus caliginosellus Clement (トウモロコシ根・ノメイガ)、Crambus terrellus Zincken (イチゴツナゴ・ノメイガ)、Cydia pomonella Linnaeus (コドリリング)、Earias insulana Boisduval (刺ありヤガ)、Earias vittella Fabricius (斑点入りヤガ)、Helicoverpa armigera Huebner (アメリカ・ヤガ)、Helicoverpa zea Boddie (トウモロコシ・オオタバコガ)、Heliothis virescens Fabricius (タバコ・バドウォーム)、Herpetogramma licarsalis Walker (芝生・ノメイガ)、Lobesia botrana Denis & Schiffermueller (グレープ・ベリー・ガ)、Pectinophora gossypiella Saunders (ピンク・ヤガ)、Phyllocnistis citrella St

ainton (柑橘類・ハモグリムシ)、*Pieris brassicae* Linnaeus (大型白色チョウ、*Pieris rapae* Linnaeus (小型白色チョウ)、*Plutella xylostella* Linnaeus (コナガ)、*Spodoptera exigua* Huebner (ビート・アワヨトウ)、*Spodoptera litura* Fabricius (タバコ・ヨトウムシ、房毛虫)、*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (行列毛虫ヨトウガ)、*Trichoplusia ni* Haebner (キャベツ・シャクトリムシ) および *Tuta absoluta* Meyrick (トマト・ハモグリムシ) の有害生物に対して特に高い活性を示す。本発明の化合物は、*Acyrtosiphon pisum* Harris (豆アブラムシ)、*Aphis craccivora* Koch (ササゲ・アブラムシ) 10
 、*Aphis fabae* Scopoli (クロマメ・アブラムシ)、*Aphis gossypii* Glover (ワタ・アブラムシ、メロン・アブラムシ)、*Aphis pomi* De Geer (リンゴ・アブラムシ)、*Aphis spiraeicola* Patch (シモツケ・アブラムシ)、*Aulacorthum solani* Kaltenbach (ジギタリス・アブラムシ)、*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (イチゴ・アブラムシ)、*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (ロシアコムギ・アブラムシ)、*Dysaphis plantaginea* Paaserini (ロージー・アップル・アブラムシ)、*Eriosoma lanigerum* Hausmann (ウーリー・アップル・アブラムシ)、*Hyalopterus pruni* Geoffroy (小粒プラム・アブラムシ) 20
 シ)、*Lipaphis erysimi* Kaltenbach (チューリップ・アブラムシ)、*Melopolophium dirrhodum* Walker (穀類アブラムシ)、*Macrosipum euphorbiae* Thomas (ポテト・アブラムシ)、*Myzus persicae* Sulzer (ピーチーポテト・アブラムシ、グリーン・ピーチ・アブラムシ)、*Nasonovia ribisnigri* Mosley (レタス・アブラムシ)、天疱瘡 (*Pemphigus*) 種 (根アブラムシおよび虫瘤アブラムシ)、*Rhopalosiphum maidis* Fitch (トウモロコシ葉アブラムシ)、*Rhopalosiphum padi* Linnaeus (バード・チェリーオーツ・アブラムシ)、*Schizaphis graminum* Rondani (ミドリイロアブラムシ)、*Sitobion avenae* Fabricius (イングリッシュ・グライン・アブラムシ)、*Therioaphis maculata* Buckton (斑点入りアルファルファ・アブラムシ)、*Toxoptera aurantii* Boyer de Fonsclombe (黒色柑橘類アブラムシ) および *Toxoptera citricida* Kirkaldy (褐色柑橘類アブラムシ) ; *Adelges* 種 (アデルギッド類) ; *Phylloxera devastatrix* Pergande (ペカン・フィロキセラ (*pecan phylloxera*))、*Bemisia tabaci* Gennadius (タバコ・シロバエ、サツマイモ・シロバエ)、*Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (銀色葉シロバエ)、*Dialeurodes citri* Ashmead (柑橘類シロバエ) および *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (温室 40
 シロバエ) ; *Empoasca fabae* Harris (ポテト・ヨコバエ)、*Laodelphax striatellus* Fallen (スモラー・ブラウン・プラントホッパー)、*Macrolestes quadrilineatus* Forbes (アスター・ヨコバエ)、*Nephotettix cincticeps* Uhler (ミドリ・ヨコバエ)、*Nephotettix nigropictus* Stal (イネ・ヨコバエ)、*Nilaparvata lugens* Stal (ブラウン・プラントホッパー)、*Peregrinus maidis* Ashmead (コーン・プラントホッパー)、*Sogatella furcifera* Horvath (ホワイトバクト・プラントホッパー)、*Sogatodes orizicola* Muir (ライス・デルファシド)、*Typhlocba pomaria* McAtee (シロリンゴ・ヨコバエ 50

)、*Erythroneoura* 種 (ブドウ・ヨコバエ)、*Magiciada septendecim* Linnaeus (ジュシチネンセミ)；*Icerya purchasi* Maskell (ワタクッション・カイガラムシ)、*Quadraspidotus perniciosus* Comstock (サンノゼ・カイガラムシ)；*Planococcus citri* Risso (柑橘類コナカイガラムシ)；*Pseudococcus* 種 (他のコナカイガラムシ集団)；*Cacopsylla pyricola* Foerster (モモ・キジラミ)、*Trioza diospyri* Ashmead (カキ・キジラミ) を包含する同翅目 (Homoptera) からの構成員に対する商業的に有意な活性を有する。これらの化合物は、*Acrosternum hilarre* Say (グリーン・スチンク・バグ)、*Anasa tristis* De Geer (スクイアッシュ・バグ)、*Blissus leucopterus leucopterus* Say (トコジラミ)、*Corythuca gossypii* Fabricius (ワタ・グンバイムシ)、*Cyrtopeltis modesta* Distant (トマト・バグ)、*Dysdercus suturellus* Herrich-Schaeffer (コットン・ステイナー)、*Euchistus servus* Say (ブラウン・スチンク・バグ)、*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (ワンスポットド・スチンク・バグ)、*Graptosthetus* (シード・バグ類の集団)、*Leptoglossus corculus* Say (リーフフットド・パイン・シード・バグ)、*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (変色メクラカメムシ)、*Nezara viridula* Linnaeus (サザン・グリーン・スチンク・バグ)、*Oebalus pugnax* Fabricius (ライス・スチンク・バグ)、*Oncopeltus fasciatus* Dallas (ラージ・ミルクウィード・バグ)、*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (ワタ・ノミハムシ) を包含する半翅目 (Hemiptera) からの構成員に対しても活性を有する。本発明の化合物により抑制される他の昆虫目は、総翅目 (Thysanoptera) (例えば、*Frankliniella occidentalis* Pergande (ウエスタン・フラワー・スリップ)、*Scirtothrips citri* Moulton (柑橘類スリップ)、*Sericothrips variabilis* Beach (大豆スリップ)、および *Thrips tabaci* Lindeman (タマネギ・スリップ)；並びに鞘翅目 (Coleoptera) (例えば、*Leptinotarsa decemlineata* Say (コロラド・ポテト甲虫)、*Epilachna varivestis* Mulsant (メキシコマメ甲虫) および *Agriotes*、*Athous* または *Limonitus* 属の回虫を包含する。

【0161】

本発明の化合物は、殺昆虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺線虫剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、成長調節剤、例えば発根刺激剤、化学殺菌剤、セミオケミカルズ (semiochemicals)、忌避剤、誘引剤、フェロモン、飼育刺激剤、他の生物学的に活性な化合物または昆虫病原性のバクテリア、ウイルスもしくは真菌を包含する1種もしくはそれ以上の他のと混合してさらに広い農業的利用域を与える多成分有害生物防除剤を製造することもできる。それ故、本発明の組成物は生物学的有効量の少なくとも1種の追加の生物学的活性化合物または試薬をさらに含むことができる。本発明の化合物と共に調合できるそのような活性化合物または試薬の例を以下に示す：アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセタミプリド (acetamiprid)、アベルメクチン (avermectin)、アザジラクチン (azadirachtin)、アジンフォスーメチル (azinphos-methyl)、ビフェンスリン (bifenthrin)、ビンフェナゼート (bifentazate)、ブプロフェジン (buprofezin)、カルボフラン (carbofuran)、クロルフェナピル (chlorfenvapir)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、クロルピリフォス (chlorpyrifos)、クロルピリフォスーメチル (chlorpyrif

os-methyl)、クロマフェノジド(chromafenozide)、クロチア
 ニジン(clothianidin)、シフルスリン(cyfluthrin)、ベータ
 シフルスリン(beta-cyfluthrin)、シハロスリン(cyhaloth
 rin)、ラムダーシハロスリン(lambda-cyhalothrin)、シペルメ
 スリン(cypermethrin)、シロマジン(cyromazine)、デルタメ
 スリン(deltamethrin)、ジアフェンチウロン(diafenthuiro
 n)、ジアジノン(diazinon)、ジフルベンズロン(diflubenzuro
 n)、ジメトエート(dimethoate)、ジオフェノラン(diofenolan
)、エマメクチン(emamectin)、エンドスルフアン(endosulfan)
 、エスフェンヴァレレート(esfenvalerate)、エチプロール(ethip
 role)、フェノチカルブ(fenothicarb)、フェノキシカルブ(feno
 xycarb)、フェンプロパスリン(fenpropathrin)、フェンプロキシ
 メート(fenproximate)、フェンヴァレレート(fenvalerate)
 、フィプロニル(fipronil)、フロニカミド(flonicamid)、フルシ
 スリネート(flucythrinate)、タウフルヴァリネート(tau-flu
 valinate)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、フォノフォス
 (fonophos)、ハロフェノジド(halofenozide)、ヘキサフルムロ
 ン(hexaflumuron)、イミダクロプリド(imidacloprid)、イン
 ドキサカルブ(indoxacarb)、イソフェンフォス(isofenphos)
 、ルフエヌロン(lufenuron)、マラチオン(malathion)、メトアル
 デヒド(metaldehyde)、メタミドフォス(methamidophos)、
 メチダチオン(methidathion)、メトミル(methomyl)、メトプレ
 ン(methoprene)、メトキシクロル(methoxychlor)、モノクロ
 トフォス(monocrotophos)、メトキシフェノジド(methoxyfen
 ozide)、ニチアジン(nithiazin)、ノヴァルロン(novaluron
)、オキサミル(oxamyl)、パラチオン(parathion)、パラチオンーメ
 チル(parathion-methyl)、ペルメスリン(permethrin)、
 フォレート(phorate)、フォサロン(phosalone)、フォスメット(p
 hosmet)、フォスファミドン(phosphamidon)、ピリミカルブ(pi
 rimicarb)、プロフェノフォス(profenofos)、ピメトロジン(py
 metrozine)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリプロキシフェン(py
 riproxyfen)、ロテノン(rotenone)、スピノサド(spinosad
)、スルプロフォス(sulprofos)、テブフェノジド(tebufenozid
 e)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、テフルスリン(teflu
 thrin)、テルブフォス(terbufos)、テトラクロルヴィンフォス(tet
 rachlorvinphos)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメ
 トキサム(thiamethoxam)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオ
 スルタプーナトリウム(thiosultap-sodium)、トラロメスリン(t
 ralomethrin)、トリクロルフォン(trichlorfon)およびトリフ
 ルムロン(triflumuron)；殺菌・殺カビ剤、例えばアシベンゾラル(aci
 benzolar)、アゾキシストロビン(azoxystrobin)、ベノミル(b
 enomyl)、プラスチックジン-S(blasticidin-S)、ボルドー混合物
 (Bordeaux mixture) (三塩基性硫酸銅)、ブロムコナゾール(bro
 muconazole)、カルプロパミド(carpropamid)、カプタフォル(c
 aptafol)、カプタン(captan)、カルベンダジム(carbenda
 zim)、クロロネブ(chloroneb)、クロロタロニル(chlorothal
 onil)、オキシ塩化銅、銅塩類、シフルフェナミド(cyfluafenamid)、
 シモキサニル(cymoxanil)、シプロコナゾール(cyproconazole
)、シプロジニル(cyprodinil)、(S)-3,5-ジクロロ-N-(3-ク
 ロロ-1-エチル-1-メチル-2-オキソプロピル)-4-メチルベンズアミド(RH

10

20

30

40

50

7281)、ジクロシメット(diclocymet)(S-2900)、ジクロメジン
 (diclomezin)、ジクロラン(dichloran)、ジフェノコナゾール(
 difeniconazole)、(S)-3,5-ジヒドロ-5-メチル-2-(メチ
 ルチオ)-5-フェニル-3-(フェニルアミノ)-4H-イミダゾール-4-オン(R
 P407213)、ジメトモルフ(dimethomorph)、ジメトキシストロビン
 (dimoxystrobin)、ジニコナゾール(diniconazole)、ジニ
 コナゾール-M(diniconazole-M)、ドジン(dodine)、エジフェ
 ンフォス(edifenphos)、エポキシコナゾール(epoxyconazole)
 、ファモキサドン(femoxadone)、フェナミドン(fenamidone)
 、フェナリモル(fenarimol)、フェンブコナゾール(fenbuconazo
 le)、フェンカラミド(fencaramide)(SZX07222)、フェンピク
 ロニル(fenpiclonil)、フェンプロピジン(fenpropidin)、フ
 ェンプロピモルフ(fenpropimorph)、フェンチンアセテート(fenti
 n acetate)、フェンチンヒドロキシド(fentin hydroxide)、
 フルアジラム(flauazinam)、フルジオキシニル(fludioxonil)、
 フルメトバー(flumetover)(RPA403397)、フルキンコナゾール(
 fluquinconazole)、フルシラゾール(flusilazole)、フル
 トラニル(flutolanil)、フルトリアフォル(flutriafol)、フ
 オルペット(folpet)、フォセチル-アルミニウム(fosetyl-alumi
 num)、フララキシル(furalaxyl)、フラメタピル(furametapy
 r)(S-82658)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、イブコナゾ
 ール(ipconazole)、イプロベンフォス(iprobenfos)、イプロジ
 オン(iprodione)、イソプロチオラン(isoprothiolane)、カ
 スガマイシン(kasugamycin)、レスキシム-メチル(kresoxim-m
 ethyl)、マンコゼブ(mancozeb)、マネブ(maneb)、メフェノキサ
 ム(mefenoxam)、メプロニル(mepronil)、メタラキシル(meta
 laxyl)、メトコナゾール(metconazole)、メトミノストロビン/フェ
 ノミノストロビン(metominostrobin/fenominostrobin)
)(SSF-126)、ミクロブタニル(myclobutanil)、ネオーアソジン
 (neo-asozin)(メタン砒素酸第一鉄)、オキサジキシル(oxadixyl
)、ペンコナゾール(penconazole)、ペンシクロン(pencycuron
)、プロベナゾール(probenazole)、プロクロラズ(prochlora
 z)、プロバモカルブ(propamocarb)、プロピコナゾール(propico
 nazole)、ピリフェノックス(pyriphenox)、ピラクロストロビン(py
 raclostrobin)、ピリメタニル(pyrimethanil)、ピロキロン
 (pyroquilon)、キノキシフェン(quinoxyfen)、スピロキサミン
 (spiroxamine)、硫黄、テブコナゾール(tebuconazole)、テ
 トラコナゾール(tetraconazole)、チアベンダゾール(thiabend
 azole)、チフルザミド(thifluzamide)、チオフアネート-メチル(
 thiophanate-methyl)、チラム(thiram)、チアジニル(ti
 adinil)、トリアジメフォン(triadimefon)、トリアジメノール(t
 riadimenol)、トリシクラゾール(tricyclazole)、トリフロキ
 シストロビン(trifloxystrobin)、トリチコナゾール(tritico
 nazole)、バリダマイシン(validamycin)およびビンクロゾリン(
 vinclozolin);殺線虫剤、例えばアルジカルブ(aldicarb)、オキ
 サミル(oxamyl)およびフェナミフォス(fenamiphos)、殺細菌剤、例
 えばアミトラズ(amitraz)、チノメチオナト(chinomethionat)
 、クロロベンジレート(chlorobenzilate)、シヘキサチン(cyhex
 atin)、ジコフォル(dicofol)、ジエノクロル(dienochlor)、
 エトキサゾール(etoxazole)、フェナザクイン(fenazaquin)、フ

10

20

30

40

50

エンブタチンオキシド (fenbutatin oxide)、フェンプロパスリン (fenpropathrin)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、プロパルガイト (propargite)、ピリダベン (pyridaben) およびテブフェンピラド (tebufenpyrad) ; 並びに生物学的試薬、例えばアイザワイ (aizawai) およびクルスタキ (kurstaki) 種を包含するバシルス・スリンジエンシス (Bacillus thuringiensis)、バシルス・スリンジエンシス・デルタ・エンドトキシン (Bacillus thuringiensis delta endotoxin)、バクテリオウイルス (baculovirus)、並びに昆虫病原性バクテリア、ウイルスおよび真菌。

10

【0162】

これらの農業保護剤の一般的な参考文献は、The Pesticide Manual, 12th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2000 である。

【0163】

本発明の化合物と混合するための好ましい殺昆虫剤および殺ダニ剤は、ピレスロイド類、例えばシベルメスリン、シハロスリン、シフルスリン、ベーターシフルスリン、エスフェンヴァレレート、フェンヴァレレートおよびトラロメスリン；カルバミン酸エステル類、例えばフェノチカルブ、メトミル、オキサミルおよびチオジカルブ；ネオニコチノイド類、例えばクロチアニジン、イミダクロプリドおよびチアクロプリド；神経ナトリウムチャネル遮断剤、例えばインドキサカルブ；殺昆虫性大環式ラクトン (macrocyclic lactone) 類、例えばスピノサド、アバメクチン、アベルメクチンおよびエマメクチン； γ -アミノ酪酸 (GABA) 拮抗物質、例えばエンドスルファン、エチプロールおよびフィプロニル；殺昆虫性ウレア類、例えばフルフェノクスロンおよびトリフルムロン；幼若ホルモン模倣体 (mimics)、例えばジオフェノランおよびピリプロキシフェン；ピメトロジン；並びにアミトラズを包含する。本発明の化合物と混合するための好ましい生物学的試薬はバシルス・スリンジエンシスおよびバシルス・スリンジエンシス・デルタ・エンドトキシン並びにバクテリオウイルス性殺昆虫剤並びに食虫真菌を包含する。

20

30

【0164】

最も好ましい混合物は、本発明の化合物とシハロスリンとの混合物、本発明の化合物とベーターシフルスリンとの混合物、本発明の化合物とエスフェンヴァレレートとの混合物、本発明の化合物とメトミルとの混合物、本発明の化合物とイミダクロプリドとの混合物、本発明の化合物とチアクロプリドとの混合物、本発明の化合物とインドキサカルブとの混合物、本発明の化合物とアバメクチンとの混合物、本発明の化合物とエンドスルファンとの混合物、本発明の化合物とエチプロールとの混合物、本発明の化合物とフィプロニルとの混合物、本発明の化合物とフルフェノクスロンとの混合物、本発明の化合物とピリプロキシフェンとの混合物、本発明の化合物とピメトロジンとの混合物、本発明の化合物とアミトラズとの混合物、本発明の化合物とバシルス・スリンジエンシスとの混合物、本発明の化合物とバシルス・スリンジエンシス・デルタ・エンドトキシンの混合物を包含する。

40

【0165】

ある場合には、同様な抑制域を有するが異なる活性方式を有する他の無脊椎有害生物抑制化合物または試薬との組み合わせが耐性処理に特に有利であろう。それ故、本発明の組成物は生物学的有効量の同様な抑制域を有するが異なる活性方式を有する少なくとも1種の追加の無脊椎有害生物抑制化合物または試薬をあらに含むことができる。植物保護化合物（例えば、蛋白質）を発現するために遺伝子就職された植物または植物区域と生物学的有効量の本発明の化合物との接触がより広い植物保護域を与え且つ耐性処理にも有利である。

50

【0166】

無脊椎有害生物は抑制され、そして農耕および／または非農耕蔓延地域を包含する有害生物の環境に、保護しようとする場所に、または抑制しようとする有害生物に直接的に1種もしくはそれ以上の本発明の化合物を、有効量で、適用することにより農耕、牧畜および特殊栽培作物、動物および人間の健康の保護が得られる。それ故、本発明はさらに無脊椎動物またはそれらの環境に生物学的有効量の1種もしくはそれ以上の本発明の化合物または少なくとも1種のそのような化合物および有効量の少なくとも1種の追加の生物学的活性化化合物または試薬を含んでなる組成物を接触させることを含んでなる葉および土壌に棲息する無脊椎動物の抑制並びに農業および／または非農業作物の保護方法も含んでなる。好適な適用方法は噴霧による。本発明の化合物は、植物を液体調合物、粒状調合物の土壌水葉として土壌、温室箱処理または移植物の浸漬物に適用される本発明の化合物を含んでなる組成物と接触させることにより摂取される植物吸収による分配において有効である。他の接触方法は、直接的なおよび残留性の噴霧、空気噴霧、種子コート、マイクロカプセル化、全身的吸収、餌、耳札、大型丸剤、噴霧剤、薫煙剤、エーロゾル、粉剤などによる本発明の化合物または組成物の適用を包含する。

【0167】

本発明の化合物は、無脊椎動物により摂取される餌の中にまたは例えばトラップの如き装置内に導入することができる。0.01-5%の間の活性成分、0.05-10%の1種もしくは複数の水分保持剤および40-99%の植物粉を含んでなる粒剤または餌が非常に低い適用割合で、特に直接接触でなく摂取により致死性となる活性成分の薬用量で、土壌昆虫を抑制する際に有効である。

【0168】

本発明の化合物はそれらの純粋形で適用することもできるが、最も頻繁には1種もしくはそれ以上の化合物を適当な担体、希釈剤、および界面活性剤と共に含んでなりそして可能なら意図する最終用途に応じて食品と組み合わせてある調合物が適用されるであろう。好適な適用方法は、化合物の水性分散液または精製油溶液の噴霧を含む。噴霧油との組み合わせ、噴霧油濃縮物、スプレッダー粘着剤、佐薬、他の溶媒および相乗剤、例えばピペロニルブトキシド、が化合物の効果をしばしば増加させる。

【0169】

有効な抑制用に必要な適用割合（すなわち「生物学的に有効な量」）は例えば抑制しようとする無脊椎動物の種、有害生物の寿命サイクル、成長段階、その大きさ、位置、季節、宿主栽培作物または動物、摂食行動、交配行動、周囲水分、温度などの如き因子に依存するであろう。通常的环境下では、農耕形態系で有害生物を抑制するためには1ヘクタール当たり約0.01-2kgの活性成分の適用割合で十分であるが、0.001kg/ヘクタール程度の少量で十分であるかもしれない。非農耕適用では、有効な使用割合は約1.0-50mg/平方メートルの範囲となるであろうが、0.1mg/平方メートル程度の少量で十分であるかもしれない。当業者は所望する水準の無脊椎有害生物抑制に必要な生物学的に有効な量を容易に決めることができる。

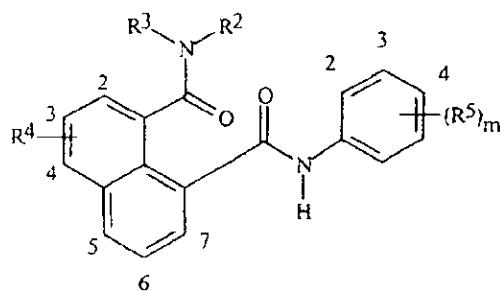
【0170】

本発明の生物学的実施例中の下記の試験は具体的な有害生物に対する本発明の化合物の抑制効果を示す。「抑制効果」は有意に減じられた摂食をもたらし節足動物の成長抑制（死亡を含む）を表す。しかしながら、該化合物により得られる有害生物抑制保護はこれらの種に限定されるものではない。化合物の記述に関しては索引表A-Eを参照のこと。下記の略語が以下の索引表で使用される：tは第三級であり、nはノルマルであり、iはイソであり、sは第二級であり、Meはメチルであり、Etはエチルであり、PrはプロピルでありそしてBuはブチルであり、従ってi-Prはイソプロピルであり、s-Buは第二級ブチルであるなどである。AcはCOCH₃である。略語「Ex.」は「実施例」を示しそしてその次に示される数は化合物の製造例を示す。

【 0 1 7 1 】

【 表 5 5 】

索引表A



化合物	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	m.p. °C
1 (Ex. 1)	Me	H	H	2	2-Me-4-F	249
2	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-Cl	>250
3	<i>n</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-Cl	212

10

20

【 0 1 7 2 】

【 表 5 6 】

4	<i>i</i> -Bu	H	H	2	2-Me-4-Cl	***	
5	Me	Me	H	2	2-Me-4-Cl	***	
6	Et	H	H	2	2-Me-4-Cl	***	
7	Me	H	H	2	2-Me-4-Cl	244	
8	アリル	H	H	2	2,4-ジ-Me	243	
9	シクロ-Pr	H	H	2	2-Me-4-Cl	246	
10	H	H	H	2	2-Me-4-Cl	***	
11	Me	H	H	2	2-Me-4-OCF ₃	>250	
12	Me	H	H	1	4-OCF ₃	>250	10
13	Me	H	H	2	2,4-ジ-Cl	>250	
14	Me	H	H	2	2-Me-5-Cl	241	
15	Me	H	H	2	2-Me-3-Cl	>250	
16	Me	H	H	1	2-Me	236	
17	Me	H	H	2	2-Me-4-Br	234	
18	Me	H	H	1	4- <i>i</i> -Pr	>250	
19	Me	H	H	1	4-NHAc	224	
20	Me	H	H	1	2-Br	210	
21	Me	H	H	1	2-OPh	193	
22	Me	H	H	1	4-OMe	188	20
23	Me	H	H	1	4-(ホルホリン-4-イル)	246	
24	Me	H	H	1	2-F	177	
25	Me	H	H	1	4-I	235	
26	Me	H	H	2	2-Me-4-NO ₂	242	
27	Me	H	H	1	3-CF ₃	235	
28	Me	H	H	1	3-I	216	
29	Me	H	H	2	2-Me-4-OMe	205	
30	Me	H	H	1	3-Br	230	
31	Me	H	H	1	4-Ac	226	
32	Me	H	H	1	4-Br	220	30
33	Me	H	H	1	4-CN	216	
34	Me	H	H	1	3-NO ₂	242	
35	Me	H	H	1	4-Cl	197	
36	Me	H	H	1	3-CH ₃	220	
37	Me	H	H	1	3-Cl	209	
38	Me	H	H	2	2,5-ジ-Me	204	
39	Me	H	H	2	2-Me-6-OMe	223	
40	Me	H	H	2	2,3-ジ-Me	187	
41	Me	H	H	1	2-OMe	192	40

【 0 1 7 3 】

【 表 5 7 】

42	Me	H	H	1	4-CO ₂ Et	202
43	Me	H	H	1	4-NMeAc	210
44	Me	H	H	2	2,6-ジ-Me	>250
45	Me	H	H	1	2-(ヒドロ-1-イル)	208
46	Me	H	H	1	4-NO ₂	224
47	Me	H	H	1	3-OCH ₂ Ph	214
48	Me	H	H	2	2,4-ジ-Me	213
49	Me	H	H	1	3-CN	200
50	Me	H	H	1	3-OCF ₃	>250
51	Me	H	H	2	2-Me-3-NO ₂	233
52	Me	H	H	1	2-OEt	224
53	Me	H	H	1	4-(4-ClPhO)	224
54	Me	H	H	1	4-CH ₃	248
55	Me	H	H	1	4-O- <i>i</i> -Pr	183
56	Me	H	H	1	4-F	247
57	Me	H	H	1	2-SMe	204
58	Me	H	H	1	2- <i>t</i> -Bu	248
59	Me	H	H	1	3-SMe	218
60	Me	H	H	1	4-OEt	195
61	Me	H	H	1	2-CH ₂ CN	191
62	Me	H	H	1	2-Et	200
63	<i>i</i> -Pr	H	4-NO ₂ / 5-NO ₂ (1/1 混合物)	2	2-Me-4-Cl	***
64	Me	H	4-Br/ 5-Br (1/1 混合物)	2	2-Me-4-Cl	***
65	Me	H	H	1	2-CONH(<i>i</i> -Pr)-6-Me	248
66*	Me	H	H	2	2-Me-4-Cl	***
67*	Me	H	H	2	2-Me-4-OCF ₃	***
68	Me	H	H	2	2-Me-5-NO ₂	242
69	Me	H	H	2	2-Me-4-CF ₃	250
70	Me	H	H	1	4-CF ₃	246
71	Me	H	H	1	2-Ph	163
72	Me	H	H	2	2-(1-Me-テトラゾール-5-イル)-6-Me	202
73	Me	H	H	1	2-CONHMe	235
74	Me	H	H	2	2-Me-6-Cl	231
75	Me	H	H	2	3-NO ₂ -4-Me	223

10

20

30

40

【 0 1 7 4 】

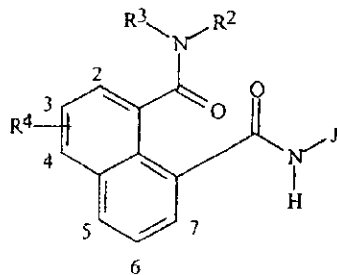
【 表 5 8 】

76	Me	H	H	3	2-F-4-Cl-5-NO ₂	250
77	Me	H	H	2	2-Br-4-Me	198
78	Me	H	H	3	2-Br-4,6-ジ-F	197
79	Me	H	H	2	2,5-ジ-NO ₂	223
80	Me	H	H	2	2-F-4-Cl	250
81	Me	H	H	2	2-Me-3-F	242
82	Me	H	H	2	2-Br-4-F	126.5
83	Me	H	H	1	2-(モルホリン-4-イル)	193
84	Me	H	H	2	3-NO ₂ -4-F	248
85	Me	H	H	2	3,4-ジ-F	110
86	Me	H	H	2	2-Cl-4-F	250
87	Me	H	H	1	2-CF ₃	217
88	Me	H	H	2	2-CN-4-Cl	250
89	Me	H	H	1	2-Ac	237
90	Me	H	H	1	2-OCF ₃	209
91	Me	H	H	1	2-SCF ₃	211
92	Me	H	H	2	2-CF ₃ -4-Br	250

*このサンプルは25重量%の無水1,8-ナフテンを含有していた。

*** NMRデータに関しては索引表E参照

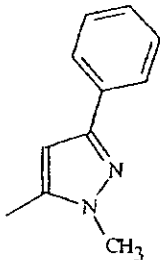
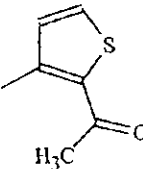
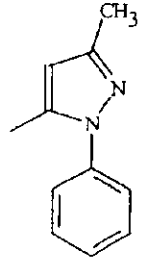
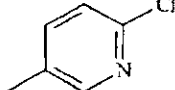
索引表B



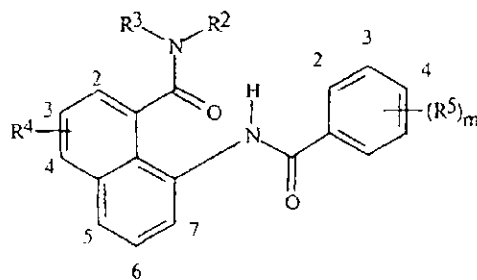
化合物	R ²	R ³	R ⁴	J	m.p. °C
93	Me	H	H		199

【 0 1 7 5 】

【 表 5 9 】

化合物	R ²	R ³	R ⁴	J	m.p. °C
94	Me	H	H		175
95	Me	H	H		126.5
96	Me	H	H		217
97	Me	H	H		171

索引表C



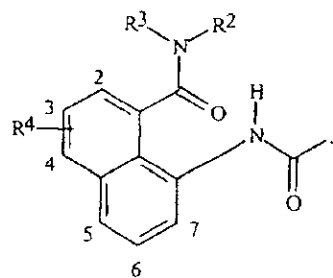
化合物	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	m.p. °C
98 (Ex. 2)	<i>i</i> -Pr	H	H	2	3,4-ジ-F	227
99	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2,3-ジ-Me	242
100	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2,4-ジ-F	204
101	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-OCF ₃	186
102	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-Cl	218
103	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-Et	206

【 0 1 7 6 】

【 表 6 0 】

104	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-CF ₃	165
105	Me	H	H	2	3,4-ジ-F	250
106	Me	H	H	2	2,3-ジ-Me	184.5
107	Me	H	H	2	2,4-ジ-F	207
108	Me	H	H	1	4-Cl	250
109	Me	H	H	1	4-Et	250
110	Me	H	H	1	4-CF ₃	208
111	Me	H	H	1	4-OCF ₃	144
112	Me	H	H	1	2-Me	173.5
113	<i>i</i> -Pr	H	H	1	2-Me	176.5
114	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-O-CF ₃	173.5
115	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-CF ₃	194.5
116	Me	H	H	2	2-Me-4-OCF ₃	173.5
117	Me	H	H	2	2-Me-4-CF ₃	204.5

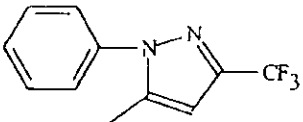
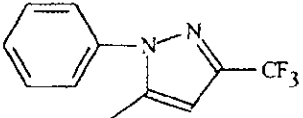
索引表D



化合物	R ²	R ³	R ⁴	J	m.p. °C
118	<i>i</i> -Pr	H	H	1-ナフチル	210
119	<i>i</i> -Pr	H	H	2-チエニル	208
120 (Ex. 3)	Me	H	H	2-チエニル	215
121	Me	H	H	1-ナフチル	214
121	<i>i</i> -Pr	H	H		210
123	Me	H	H		210

【 0 1 7 7 】

【 表 6 1 】

124	Me	H	H		215.5
125	i-Pr	H	H		186

索引表E

化合物	¹ H NMRデータ(断らない限りCDCl ₃ 溶液) ^a
4	(DMSO-d ₆) δ: 0.9 (m, 6H), 2.37 (s, 3H), 3.01 (m, 1H), 3.96 (d, 2H), 7.27-8.48 (m, 10H), 9.84 (br s, 1H).
5	(DMSO-d ₆) δ: 2.36 (s, 3H), 2.88 (s, 3H), 2.94 (s, 3H), 7.28-8.08 (m, 10H), 9.99 (s, 1H).
6	(DMSO-d ₆) δ: 1.07 (t, 3H), 2.37 (s, 3H), 3.22 (m, 2H), 7.30-8.06 (m, 9H), 8.40 (t, 1H), 9.86 (s, 1H).
10	(DMSO-d ₆) δ: 2.36 (s, 3H), 7.25-8.08 (m, 11H), 9.88 (s, 1H).
63	(DMSO-d ₆) δ: 1.09 (d, 6H), 2.36 (s, 3H), 4.03 (m, 1H), 7.27-8.52 (m, 9H), 10.04 (s, 1H).
64	(DMSO-d ₆) δ: 2.36 (s, 3H), 2.69 (d, 3H), 7.33-8.84 (m, 8H), 8.45 (br q, 1H), 9.98 (s, 1H).
66	(DMSO-d ₆) δ: 2.37 (s, 3H), 2.71 (d, 3H), 7.27-8.10 (m, 9H), 8.34 (br q, 1H), 9.88 (s, 1H).
67	(DMSO-d ₆) δ: 2.41 (s, 3H), 2.72 (d, 3H), 7.26-8.08 (m, 9H), 8.36 (br q, 1H), 9.95 (s, 1H).

10

20

【0178】

^a ¹H NMR スペクトルはテトラメチルシランからの ppm ダウンフィールドである。カップリングは (s) — 一重項、(d) — 二重項、(t) — 三重項、(q) — 四重項、(m) — 多重項、(dd) — 二重項の二重項、(dt) — 三重項の二重項、(br s) — 広い一重項、(br q) — 広い四重項により表示される。

【0179】

本発明の生物学的実施例

30

試験 A

フォール・アーミーウォーム (*Spodoptera frugiperda*) の抑制を評価するための試験装置は内部に発芽後 4-5 日のトウモロコシ植物を含む小さい開放容器より構成されていた。これにコアサンプラーの使用により昆虫餌片上に 10-15 匹の生後 1 日の幼虫を予備感染させて、多くの幼虫が成長している硬くなった昆虫の餌のシートからの塊を除去しそして幼虫および餌を含有する塊を試験装置に移した。餌の塊が乾くにつれて、幼虫は試験植物上を移動した。

【0180】

断らない限り、10% のアセトン、90% の水、並びにアルキルアリールポリオキシエチレン、遊離脂肪酸類、グリコール類およびイソプロパノールを含有する 300 ppm の X-77^R スプレッダー・ロ・フォーム・フォーミュラ (*Spreader Lo-Foam Formula*) 非イオン性界面活性剤を含有する溶液を用いて試験化合物を調合した。調合した化合物を、各試験装置の上部から 1.27 cm (0.5 インチ) に置かれた 1/8 J J 在来型本体 (スプレイング・システムズ・カンパニー (*Spraying Systems Co.*)) 付きの SUJ 2 噴霧ノズルを通して、1 mL の液体中に適用した。この審査中の全ての実験化合物は 250 ppm で噴霧されそして 3 回繰り返された。調合した試験化合物の噴霧後に、各試験装置を 1 時間にわたり乾燥しそして次に黒色の審査した蓋を上部においた。試験装置を成育室の中に 25 °C および 70 % 相対湿度で 6 日間にわたり保った。植物の養成被害を次に視覚的に評価した。

40

【0181】

50

試験した化合物の中で、下記のものが植物保護の優れた水準（１０％以下の養成被害）を示した：１、７、１１、１６、４８、６６および６７。

【０１８２】

試験 B

タバコ・バッドウォーム（*Heliothis virescens*）の抑制を評価するための試験装置は内部に発芽後６－７日の綿植物を有する小さい開放容器より構成されていた。これに試験 A に関して記載された通りにしてコアサンプラーの使用により８匹の生後２日の幼虫を予備感染させた。

【０１８３】

試験 A に関して記載された通りにして試験化合物を調合しそして２５０ ppm で噴霧した。適用は３回繰り返された。噴霧後に、試験 A に関して記載された通りにして試験装置を成育室中に保ちそして次に視覚的に評価した。 10

【０１８４】

試験した化合物の中で、下記のものが植物保護の優れた水準（１０％以下の養成被害）を示した：１、７および１６。

【０１８５】

試験 C

ダイヤモンドバック・モス（*Plutella xylostella*）の抑制を評価するための試験装置は内部に発芽後１２－１４日のラディッシュ植物を有する小さい開放容器より構成されていた。これに試験 A に関して記載された通りにしてコアサンプラーの使用により昆虫餌片上の１０－１５匹の生まれたての幼虫を予備感染させた。 20

【０１８６】

試験 A に関して記載された通りにして試験化合物を調合しそして２５０ ppm で噴霧した。適用は３回繰り返された。噴霧後に、試験 A に関して記載された通りにして試験装置を成育室中に保ちそして次に視覚的に評価した。

【０１８７】

試験した化合物の中で、下記のものが植物保護の優れた水準（１０％以下の養成被害）を示した：１、７、１１、１２、１４、１６、２０、２４、３７、４８、５１、５４、５５、５６、６１、６６、６７、６９、７０、７２、７５、８１、８５、８６、８９、９０、９１、９３および９７。 30

【０１８８】

試験 D

ビート・アーミーウォーム（*Spodoptera exigua*）の抑制を評価するための試験装置は内部に発芽後４－５日のトウモロコシ植物を有する小さい開放容器より構成されていた。これに試験 A に関して記載された通りにしてコアサンプラーの使用により昆虫餌片上の１０－１５匹の生後１日の幼虫を予備感染させた。

【０１８９】

試験 A に関して記載された通りにして試験化合物を調合しそして２５０ ppm で噴霧した。適用は３回繰り返された。噴霧後に、試験 A に関して記載された通りにして試験装置を成育室中に保ちそして次に視覚的に評価した。 40

【０１９０】

試験した化合物の中で、下記のものが植物保護の優れた水準（１０％以下の養成被害）を示した：１、４０および５４。

【国際公開パンフレット】

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
25 April 2002 (25.04.2002)

PCT

(10) International Publication Number
WO 02/32856 A2

- (51) International Patent Classification: C07C 237/00 (81) Designated States (*internationally*): AP, AT, AU, AM, AI, AL, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GG, GR, GU, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, VN, YU, ZA, ZW.
- (21) International Application Number: PCT/US91/42632 (84) Designated States (*regionally*): ARIPO patent (BT, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (22) International Filing Date: 11 October 2001 (11.10.2001)
- (25) Filing Language: English
- (26) Publication Language: English
- (30) Priority Data:
60/240,890 17 October 2000 (17.10.2000) US
Not furnished 21 September 2001 (21.09.2001) US
- (71) Applicant (*for all designated States except US*): E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY [US/AU]; 1007 Market Street, Wilmington, DE 19898 (US).

Published:
— without international search report and to be republished upon receipt of that report

- (72) Inventors; and
(73) Inventors/Applicants (*for US only*): SEI, BY, Thomas, Paul [US/CA]; 136 Hunter Court, Wilmington, DE 19808 (US); SUN, King-Mo [US/US]; 22 Pine Grove Lane, Hockessin, DE 19707 (US).
- For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

- (74) Agent: BIRCH, Linda, D., E. I. Du Pont De Nemours and Company, Legal Patent Records Center, 1007 Market Street, Wilmington, DE 19898 (US).

WO 02/32856 A2

(54) Title: INSECTICIDAL 1,8-NAPHTHYLENEDICARBOXAMIDES

(57) Abstract: Compounds of Formula I and Formula II, and their N-oxides and agriculturally suitable salts, are disclosed that are useful for controlling invertebrate pests. Formula (I), Formula (II) wherein A, B, J, R1, R2, R3, R4, and n are as defined in the disclosure. Also disclosed are compositions comprising the compounds of Formula I or Formula II and methods for controlling invertebrate pests that involve contacting the invertebrate pests or their environment with an effective amount of a compound of Formula (I) or Formula (II).

WO 02/32856

PCT/US01/42632

1

TITLE

INSECTICIDAL 1,8-NAPHTHALENEDICARBOXAMIDES

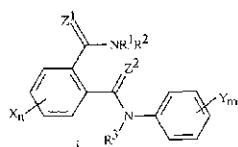
BACKGROUND OF THE INVENTION

This invention relates to certain 1,8-naphthalenedicarboxamides, their agriculturally suitable salts and compositions, and methods of their use for controlling invertebrate pests in both agronomic and nonagronomic environments.

The control of invertebrate pests is extremely important in achieving high crop efficiency. Damage by invertebrate pests to growing and stored agronomic crops can cause significant reduction in productivity and thereby result in increased costs to the consumer.

The control of invertebrate pests in forestry, greenhouse crops, ornamentals, nursery crops, stored food and fiber products, livestock, household, and public and animal health is also important. Many products are commercially available for these purposes, but the need continues for new compounds that are more effective, less costly, less toxic, environmentally safer or have different modes of action.

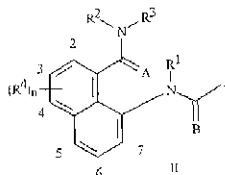
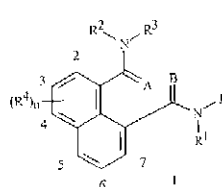
EP919542 discloses phthalic diamides of Formula i as insecticides



wherein, among others, Z¹ and Z² are O or S; and R¹, R² and R³ are, among others, H, alkyl or substituted alkyl.

SUMMARY OF THE INVENTION

This invention is directed to compounds of Formula I and Formula II including all geometric and stereoisomers, N-oxides and agriculturally suitable salts thereof:



wherein

WO 02/32856

PCT/US01/42632

2

each J is independently a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is optionally substituted with 1 to 5 R⁵;

5 A and B are independently O or S;

n is 0 to 4;

R¹ is H, or C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxy carbonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino and C₃-C₆ cycloalkylamino; or

10 R¹ is C₂-C₆ alkyl carbonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl or C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl;

R² is H, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₂-C₆ alkoxy carbonyl or C₂-C₆ alkyl carbonyl;

15 R³ is H; or C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl and C₁-C₄ alkylsulfonyl; or

20 R² and R³ can be taken together with the nitrogen to which they are attached to form a ring containing 2 to 6 atoms of carbon and optionally one additional atom of nitrogen, sulfur or oxygen, said ring may be optionally substituted with 1 to 4 substituents selected from the group consisting of C₁-C₂ alkyl, halogen, CN, NO₂ and C₁-C₂ alkoxy; and

25 each R⁴ and each R⁵ is independently H, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, CO₂H, CONH₂, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxy carbonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₂-C₆ alkyl carbonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₃-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl, or C₂-C₆ trialkylsilyl; or

35 each R⁴ and each R⁵ is independently a phenyl, benzyl, phenoxy, 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system, each ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from the group consisting of C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl,

3

1.5

26

25

36

31

WO 02/32856

PCT/US01/42632

4

include $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ and the different butoxy- or pentoxy-carbonyl isomers. Examples of "alkylaminocarbonyl" include $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ and the different butylamino- or pentylaminocarbonyl isomers. The term "dialkylamino" includes amino functions substituted with two alkyl groups that may be the same or different.

5 "Dialkylaminocarbonyl" is defined analogously, and examples include $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ and $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NCH}_2\text{C}(=\text{O})$.

The term "heterocyclic ring" or "heterocyclic ring system" denotes rings or ring systems in which at least one ring atom is not carbon and comprises 1 to 4 heteroatoms independently selected from the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur, provided that each heterocyclic ring contains no more than 4 nitrogens, no more than 2 oxygens and no more than 2 sulfurs. The heterocyclic ring can be attached through any available carbon or nitrogen by replacement of hydrogen on said carbon or nitrogen. The term "aromatic ring system" denotes fully unsaturated carbocycles and heterocycles in which the polycyclic ring system is aromatic (where aromatic indicates that the Hückel rule is satisfied for the ring system). The term "heteroaromatic ring" denotes fully aromatic rings in which at least one ring atom is not carbon and comprises 1 to 4 heteroatoms independently selected from the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur, provided that each heterocyclic ring contains no more than 4 nitrogens, no more than 2 oxygens and no more than 2 sulfurs (where aromatic indicates that the Hückel rule is satisfied). The heterocyclic ring can be attached through any available carbon or nitrogen by replacement of hydrogen on said carbon or nitrogen. The term "aromatic heterocyclic ring system" includes fully aromatic heterocycles and heterocycles in which at least one ring of a polycyclic ring system is aromatic (where aromatic indicates that the Hückel rule is satisfied). The term "fused heterobicyclic ring system" includes a ring system comprised of two fused rings in which at least one ring atom is not carbon and can be aromatic or non aromatic, as defined above.

The term "halogen", either alone or in compound words such as "haloalkyl", includes fluorine, chlorine, bromine or iodine. Further, when used in compound words such as "haloalkyl", said alkyl may be partially or fully substituted with halogen atoms which may be the same or different. Examples of "haloalkyl" include F_2C , ClCH_2 , CF_3CH_2 and CF_3CCl_2 . The terms "haloalkenyl", "haloalkynyl", "haloalkoxy", and the like, are defined analogously to the term "haloalkyl". Examples of "haloalkenyl" include $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ and $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$. Examples of "haloalkynyl" include $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$, $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ and $\text{FC}_2\text{HC}\equiv\text{CCH}_2$. Examples of "haloalkoxy" include CF_3O , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ and $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$.

The total number of carbon atoms in a substituent group is indicated by the " $\text{C}_i\text{-C}_j$ " prefix where i and j are numbers from 1 to 6. For example, $\text{C}_1\text{-C}_3$ alkylsulfonyl designates methylsulfonyl through propylsulfonyl; C_2 alkoxyalkyl designates CH_3OCH_2 ; C_3

WO 02/32856

PCT/US01/42632

5

alkoxyalkyl designates, for example, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ or $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$; and C_4 alkoxyalkyl designates the various isomers of an alkyl group substituted with an alkoxy group containing a total of four carbon atoms, examples including $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ and $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. In the above recitations, when a compound of Formula I contains a heterocyclic ring, all substituents are attached to this ring through any available carbon or nitrogen by replacement of a hydrogen on said carbon or nitrogen.

When a group contains a substituent which can be hydrogen, for example R^3 , then, when this substituent is taken as hydrogen, it is recognized that this is equivalent to said group being unsubstituted. When the number of optional substituents on a group is 0, for example when n is 0, then it is recognized that this is equivalent to said group being unsubstituted. When a bond is depicted as floating, the substituent may be attached to any of the available carbons on the ring by replacement of hydrogen; for bicyclic ring systems, the substituent or substituents may be attached to either ring of the bicyclic ring system, or both rings. For example, when n is 1, a single R^4 substituent may be attached to Formula I or Formula II at any of the indicated positions 2, 3, 4, 5, 6 or 7; and when n is 2, two independent R^4 substituents may be attached at the 2,3; 2,4; 2,5; 2,6 or 2,7 positions or any other combination of 2 positions. When R^2 and R^3 are taken together with the nitrogen to which they are attached to form a ring, said ring can be optionally substituted on any available carbon or optionally nitrogen in said ring.

Compounds of this invention can exist as one or more stereoisomers. The various stereoisomers include enantiomers, diastereomers, atropisomers and geometric isomers. One skilled in the art will appreciate that one stereoisomer may be more active and/or may exhibit beneficial effects when enriched relative to the other stereoisomer(s) or when separated from the other stereoisomer(s). Additionally, the skilled artisan knows how to separate, enrich, and/or to selectively prepare said stereoisomers. The compounds of the invention may be present as a mixture of stereoisomers, individual stereoisomers, or as an optically active form.

The present invention comprises compounds selected from Formula I or Formula II, N -oxides and agriculturally suitable salts thereof. One skilled in the art will appreciate that not all nitrogen containing heterocycles can form N -oxides since the nitrogen requires an available lone pair for oxidation to the oxide; one skilled in the art will recognize those nitrogen containing heterocycles which can form N -oxides. One skilled in the art will also recognize that tertiary amines can form N -oxides. Synthetic methods for the preparation of N -oxides of heterocycles and tertiary amines are very well known by one skilled in the art including the oxidation of heterocycles and tertiary amines with peroxy acids such as peracetic and m -chloroperbenzoic acid (MCPBA), hydrogen peroxide, alkyl hydroperoxides such as t -butyl hydroperoxide, sodium perborate, and dioxiranes such as dimethyldioxirane. These methods for the preparation of N oxides have been extensively described and

WO 02/32856

PCT/US01/42632

6

reviewed in the literature, see for example: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-19, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 139-151, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; and G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

The salts of the compounds of the invention include acid-addition salts with inorganic or organic acids such as hydrobromic, hydrochloric, nitric, phosphoric, sulfuric, acetic, butyric, fumaric, lactic, maleic, malonic, oxalic, propionic, salicylic, tartaric, 4-toluenesulfonic or valeric acids.

Preferred for reasons including ease of synthesis and/or greater arthropodicidal

efficacy are:

Preferred 1. Compounds of Formula I wherein

A and B are both O;

R¹ is H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl or C₂-C₆ alkoxy carbonyl; and

n is 0 to 2.

Preferred 2. Compounds of Formula II wherein

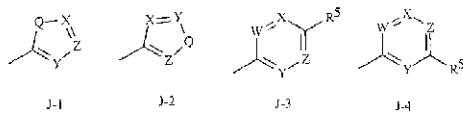
A and B are both O;

R¹ is H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl or C₂-C₆ alkoxy carbonyl; and

n is 0 to 2.

Preferred 3. Compounds of Preferred 1 or Preferred 2 wherein

J is a phenyl ring or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring selected from the group consisting of J-1, J-2, J-3 and J-4, each J ring optionally substituted with 1 to 3 R⁵



Q is O, S or NR⁵;

W, X, Y and Z are independently N or CR⁵, provided that in J-3 and J-4 at least one of W, X, Y or Z is N;

WO 02/32856

PCT/US01/42632

7

R² is H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl or C₂-C₆ alkoxycarbonyl;

R³ is C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₂ alkylthio, C₁-C₂ alkylsulfinyl and C₁-C₂ alkylsulfonyl;

one R⁴ group is attached to the naphthyl ring system at the 2-position or 7-position, and said R⁴ is C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl or C₁-C₄ haloalkylsulfonyl;

each R⁵ is independently H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl or C₂-C₆ alkoxycarbonyl, C₃-C₆ dialkylaminocarbonyl; or

each R⁵ is independently a phenyl, benzyl or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C₂-C₄ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₆ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₃-C₆ (alkyl)cycloalkylamino, C₂-C₄ alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxycarbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₆ dialkylaminocarbonyl or C₃-C₆ trialkylsilyl; or

(R⁵)₂ when attached to adjacent carbon atoms can be taken together as

-OCF₂O-, -CF₂CF₂O- or -OCF₂CF₂O-; and

n is 1 to 2.

Preferred 4. Compounds of Formula 1 of Preferred 3 wherein R² is H, R³ is C₁-C₄ alkyl; and at least one of the R⁵ substituents is *ortho* to the NR⁴C(=B) moiety.

Preferred 5. Compounds of Preferred 4 wherein R³ is methyl.

Preferred 6. Compounds of Formula 11 of Preferred 3 wherein

R¹ is H or C₁-C₄ alkyl;

R² is H or C₁-C₄ alkyl;

R³ is C₁-C₄ alkyl optionally substituted with halogen, CN, OCH₃, or S(O)_pCH₃;

WO 02/32856

PCT/US01/42632

8

- one R⁵ group is attached to the J at the position *ortho* to the C(=B)NR¹ moiety, and said R⁵ is C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl or C₂-C₄ alkoxy carbonyl; C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl or a phenyl, benzyl, or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ haloalkoxy;
- and a second optional R⁵ group is independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl or C₂-C₄ alkoxy carbonyl; C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl or a phenyl, benzyl, or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ haloalkoxy.
- Preferred 7. Compounds of Preferred 6 wherein J is phenyl, pyrazole, pyrrole, pyridine or pyrimidine, each substituted with one R⁵ attached to the J at the position *ortho* to the C(=B)NR¹ moiety and a second optional R⁵.
- Preferred 8. Compounds of Preferred 7 wherein
R¹ and R² are each H;
one R⁴ is attached at the 7-position *ortho* to the NR¹C(=X)J moiety and is selected from the group consisting of C₁-C₃ alkyl, CF₃, OCF₃, OCHF₂, S(O)_pCF₃, S(O)_pCHF₂ and halogen and an optional second R⁴ is attached at the 5-position *para* to the NR¹C(=X)J moiety and is selected from the group consisting of halogen, C₁-C₃ alkyl and C₁-C₃ haloalkyl.
- Preferred 9. Compounds of Preferred 8 wherein
J is J-I;
Q is NR^{5a};
X is N or CH;
Y is CH;
Z is CR^{5b};
R^{5a} is a phenyl or 2-pyridyl ring substituted with one or two substituents selected from the group consisting of halogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl or C₁-C₄ haloalkoxy; and
R^{5b} is halogen or CF₃.

WO 02/32856

PCT/US01/42632

9

Specifically preferred compounds are those selected from the group consisting of
N-methyl-*N'*-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,8-naphthalene dicarboxamide,

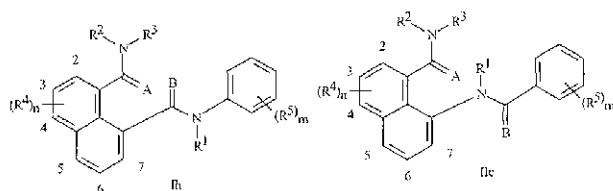
N-methyl-8-[(3,4-difluorophenyl)carbonylamino]-1-naphthalenecarboxamide and

N-methyl-8-[(2-thienyl)carbonylamino]-1-naphthalenecarboxamide.

This invention also pertains to a composition for controlling invertebrates comprising a
 biologically effective amount of a compound of Formula I or Formula II and at least one
 additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and
 liquid diluents. This invention also pertains to a composition comprising a biologically
 effective amount of a compound of Formula I or Formula II and an effective amount of at
 least one additional biologically active compound or agent. Preferred compositions are those
 comprising compounds of Formula I or Formula II as preferred in Preferred 1 through 9, and
 the specifically preferred compounds above.

This invention also pertains to a method for controlling arthropods comprising
 contacting the arthropods or their environment with an arthropodically effective amount of
 a compound of Formula I or Formula II, and *N*-oxide or agriculturally suitable salts thereof
 (e.g. as a composition comprising a compound of Formula I or Formula II). This invention
 also relates to such a method wherein the invertebrate pest or its environment is contacted
 with a biologically effective amount of a compound of Formula I or Formula II or a
 composition comprising a compound of Formula I or Formula II and a biologically effective
 amount of at least one additional compound or agent for controlling invertebrate pests.
 Preferred methods are those comprising compounds of Formula I or Formula II as preferred
 in Preferred 1 through 9, and the specifically preferred compounds above.

Of note are certain compounds of Formula II and Formula IIc including all geometric
 and stereoisomers, and agriculturally suitable salts thereof



wherein:

A and B are independently Q or S;

m is 1 to 5;

n is 0 to 4;

WO 02/32856

PCT/US01/42632

10

- R^1 is H; or C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl or C_3-C_6 cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO_2 , hydroxy, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 alkylthio, C_1-C_4 alkylsulfinyl, C_1-C_4 alkylsulfonyl, C_2-C_4 alkoxycarbonyl, C_1-C_3 alkylamino, C_2-C_8 dialkylamino and C_3-C_6 cycloalkylamino; or
 R^1 is C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxycarbonyl, C_2-C_6 alkylaminocarbonyl or C_3-C_8 dialkylaminocarbonyl;
 R^2 is H, C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 cycloalkyl, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 alkylamino, C_2-C_8 dialkylamino, C_3-C_6 cycloalkylamino, C_2-C_6 alkoxycarbonyl or C_2-C_6 alkylcarbonyl;
 R^3 is H; or C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl or C_3-C_6 cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO_2 , hydroxy, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 alkylthio, C_1-C_4 alkylsulfinyl and C_1-C_4 alkylsulfonyl; or
 R^2 and R^3 can be taken together with the nitrogen to which they are attached to form a ring containing 2 to 6 atoms of carbon and optionally one additional atom of nitrogen, sulfur or oxygen, said ring may be optionally substituted with 1 to 4 substituents selected from the group consisting of C_1-C_2 alkyl, halogen, CN, NO_2 and C_1-C_2 alkoxy; and
each R^4 and each R^5 is independently H, C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_3-C_6 cycloalkyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6 haloalkenyl, C_2-C_6 haloalkynyl, C_3-C_6 halocycloalkyl, halogen, CN, CO_2H , $CONH_2$, NO_2 , hydroxy, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 haloalkoxy, C_1-C_4 alkylthio, C_1-C_4 alkylsulfinyl, C_1-C_4 alkylsulfonyl, C_1-C_4 haloalkylthio, C_1-C_4 haloalkylsulfinyl, C_1-C_4 haloalkylsulfonyl, C_2-C_4 alkoxycarbonyl, C_1-C_4 alkylamino, C_2-C_8 dialkylamino, C_3-C_6 cycloalkylamino, C_2-C_6 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxycarbonyl, C_2-C_6 alkylaminocarbonyl, C_3-C_8 dialkylaminocarbonyl, or C_3-C_6 trialkylsilyl; or
each R^4 and each R^5 is independently phenyl optionally substituted with C_1-C_4 alkyl, C_2-C_4 alkenyl, C_2-C_4 alkynyl, C_3-C_6 cycloalkyl, C_1-C_4 haloalkyl, C_2-C_4 haloalkenyl, C_2-C_4 haloalkynyl, C_3-C_6 halocycloalkyl, halogen, CN, NO_2 , C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 haloalkoxy, C_1-C_4 alkylthio, C_1-C_4 alkylsulfinyl, C_1-C_4 alkylsulfonyl, C_1-C_4 alkylamino, C_2-C_8 dialkylamino, C_3-C_6 cycloalkylamino, C_3-C_6 (alkyl)cycloalkylamino, C_2-C_4 alkylcarbonyl, C_2-C_6 alkoxycarbonyl, C_2-C_6 alkylaminocarbonyl, C_3-C_8 dialkylaminocarbonyl or C_3-C_6 trialkylsilyl.
- Also of note are arthropodocidal compositions comprising an arthropodocidally effective amount of a compound of Formula Ib or Formula IIc noted above and at least one

WO 02/32856

PCT/US01/42632

11

additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents or liquid diluents.

Also of note are methods for controlling arthropods comprising contacting the arthropods or their environment with an arthropodically effective amount of a compound of Formula II or Formula IIC noted above.

Selection 1. Of note are selected compounds of Formula II wherein

A and B are both O;

m is 1 to 3;

n is 0 to 2;

R¹ is H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl or C₂-C₆ alkoxy carbonyl; and

each R⁴ and each R⁵ is independently H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl or C₂-C₄ alkoxy carbonyl.

Selection 2. Of note are selected compounds of Selection 1 wherein

R² is H;

R³ is C₁-C₄ alkyl;

each R⁴ and each R⁵ is independently H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl or C₂-C₄ alkoxy carbonyl; and

at least one of the R⁵ substituents is *ortho* to the amide linkage.

Selection 3. Of note are selected compounds of Selection 2 wherein R³ is methyl.

Selection 4. Of note are selected compounds of Formula IIC wherein

A and B are both O;

m is 1 to 3;

n is 0 to 2;

R¹ is H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl or C₂-C₆ alkoxy carbonyl; and

each R⁴ and each R⁵ is independently H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl or C₂-C₄ alkoxy carbonyl.

Selection 5. Of note are selected compounds of Selection 4 wherein

R² is H;

R³ is C₁-C₆ alkyl optionally substituted with C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ alkylthio;

WO 02/32856

PCT/US01/42632

12

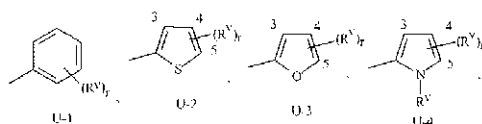
each R^3 and each R^5 is independently H, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, halogen, CN, NO_2 , C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, C_1 - C_4 alkylsulfinyl, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, C_1 - C_4 haloalkylthio, C_1 - C_4 haloalkylsulfinyl, C_1 - C_4 haloalkylsulfonyl or C_2 - C_4 alkoxy carbonyl; and

5 at least one of the R^5 substituents is *ortho* to the amide linkage.

As noted above, each J is independently a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is optionally substituted with 1 to 5 R^5 . The term "optionally substituted" in connection with these J groups refers to groups which are unsubstituted or have at least one non-hydrogen substituent that does not extinguish the arthropodocidal activity possessed by the unsubstituted analog. An example of phenyl optionally substituted with 1 to 5 R^5 is the ring illustrated as U-1 in Exhibit 1, wherein R^5 is R^5 and r is an integer from 1 to 5. An example of a naphthyl group optionally substituted with 1 to 5 R^5 is illustrated as U-85 in Exhibit 1, wherein R^5 is R^5 and r is an integer from 1 to 5. Examples of 5- or 6-membered heteroaromatic rings optionally substituted with 1 to 5 R^5 include the rings U-2 through U-53 illustrated in Exhibit 1 wherein R^5 is R^5 and r is an integer from 1 to 5. Note that J-1 through J-4 below also denote 5- or 6-membered heteroaromatic rings. Note that U-2 through U-20 are examples of J-1, U-21 through U-35 and U-40 are examples of J-2, U-41 through U-48 are examples of J-3 and U-49 through U-53 are examples of J-4. Examples of aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring systems optionally substituted with 1 to 4 R^5 include U-54 through U-84 illustrated in Exhibit 1 wherein R^5 is R^5 and r is an integer from 1 to 5.

Although R^5 groups are shown in the structures U-1 through U-85, it is noted that they do not need to be present since they are optional substituents. Note that when R^5 is H when attached to an atom, this is the same as if said atom is unsubstituted. The nitrogen atoms that require substitution to fill their valence are substituted with H or R^5 . Note that some U groups can only be substituted with less than 5 R^5 groups (e.g. U-14, U-15, U-18 through U-21 and U-32 through U-34 can only be substituted with one R^5). Note that when the attachment point between (R^5)_r and the U group is illustrated as floating, (R^5)_r can be attached to any available carbon atom of the U group. Note that when the attachment point on the U group is illustrated as floating, the U group can be attached to the remainder of Formula I through any available carbon of the U group by replacement of a hydrogen atom.

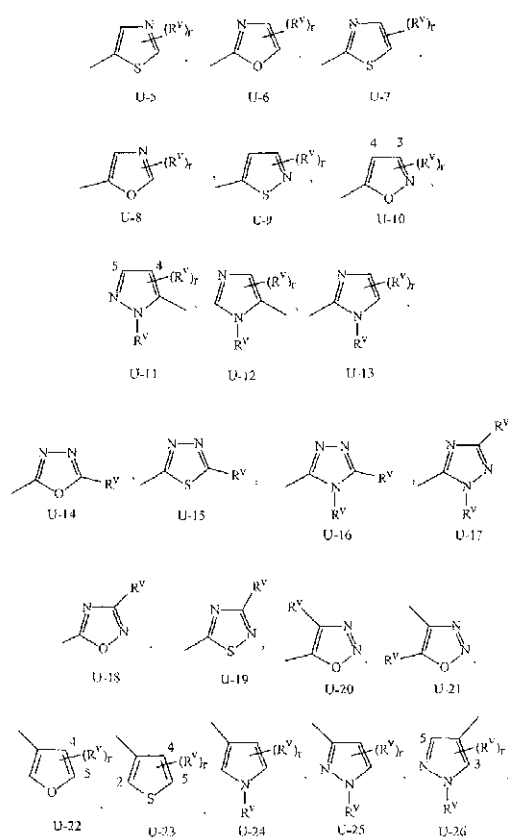
Exhibit 1.



WO 02/32856

PCT/US01/42632

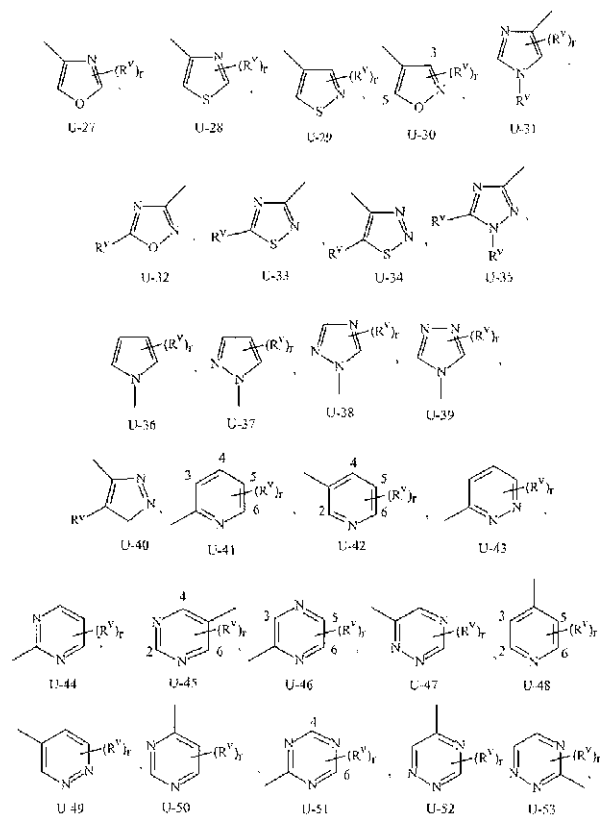
13



WO 02/32856

PCT/US01/42632

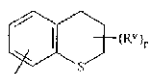
14



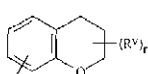
WO 02/32856

PCT/US01/42632

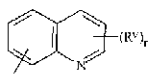
15



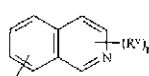
U-54



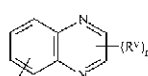
U-55



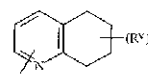
U-56



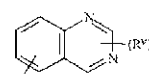
U-57



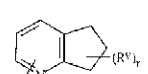
U-58



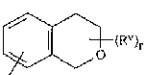
U-59



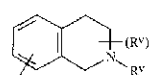
U-60



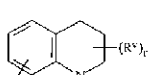
U-61



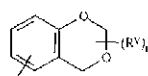
U-62



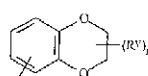
U-63



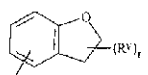
U-64



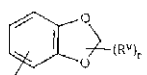
U-65



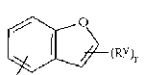
U-66



U-67



U-68

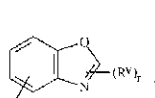


U-69

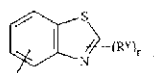
WO 02/32856

PCT/US01/42632

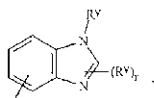
16



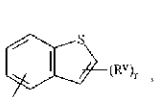
U-70



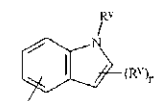
U-71



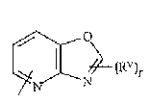
U-72



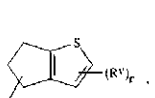
U-73



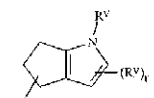
U-74



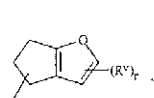
U-75



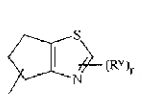
U-76



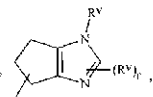
U-77



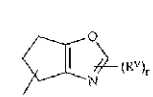
U-78



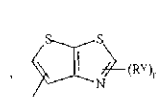
U-79



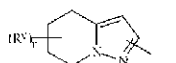
U-80



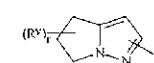
U-81



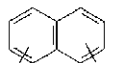
U-82



U-83



U-84



U-85

The compounds of Formula I and Formula II can be prepared by one or more of the following methods and variations as described in Schemes 1-21. The definitions of R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A, B, m and n in the compounds described in the Schemes below are as defined above in the Summary of the Invention or their subsets.

Compounds of Formula I can be prepared by procedures outlined in Schemes 1-9. Compounds of Formulae Ia-h are various subsets of the compounds of Formula I.

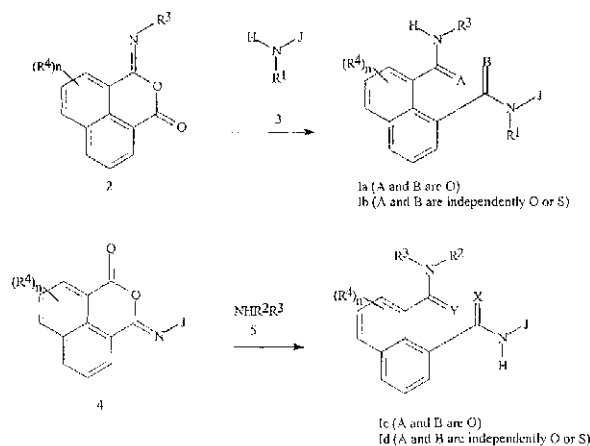
WO 02/32856

PCT/US01/42632

17

Typical procedures are described in Scheme 1 and involve either coupling of a
 isonaphthalimide of Formula 2 with an amine of Formula 3 or coupling of a compound of
 Formula 4 with an amine of Formula 5 with or without the presence of a base. Typical bases
 include amine bases such as triethylamine, diisopropylethylamine and pyridine. In certain
 instances it is useful to use polymer supported acid scavengers such as polymer-bound
 diisopropylethylamine and polymer-bound dimethylaminopyridine. The amines of Formula
 3 and Formula 5 are either commercially available, well represented in the chemical
 literature, or readily available from established literature procedures. Amides of Formula 1a
 can be converted to thioamides of Formula 1b using a variety of standard thio transfer
 reagents including phosphorus pentasulfide and Lawesson's reagent.

Scheme 1



Compounds of Formula 2 and Formula 4 are typically prepared by coupling of a
 1,8-naphthaloyl chloride of the Formula 6 with an amine of Formula 7 or an amine of
 Formula 8 respectively (Scheme 2). Typical acid scavengers include amine bases such as
 triethylamine, diisopropylethylamine and pyridine. In certain instances it is useful to use
 polymer supported acid scavengers such as polymer-bound diisopropylethylamine and
 polymer-bound dimethylaminopyridine. In some instances, the amine of Formula 7 can
 serve as the acid scavenger when used in excess. The compounds of 1,8-naphthaloyl
 chloride of the Formula 6 are well represented in the chemical literature and are typically

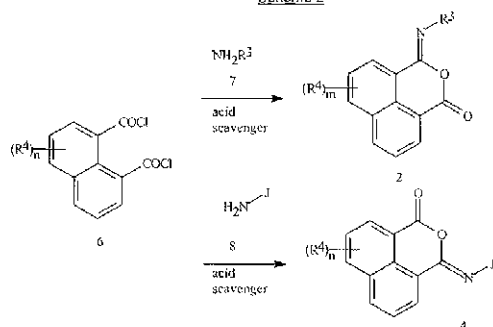
WO 02/32856

PCT/US01/42632

18

prepared from the corresponding 1,8-naphthalic acids or the anhydrides with the use of chlorinating reagents commonly used for the transformation of carboxylic acid to carboxylic acid chloride. These commonly used chlorinating reagents include phosphorous oxychloride and phosphorous pentachloride.

Scheme 2



5

An alternate procedure for the preparation of compounds of Formula 2 and Formula 4 involves the cyclization of compounds of 8-aminocarbonyl-1-naphthalenecarboxylic acid of Formula 9 and Formula 10 respectively (Scheme 3) with the use of a dehydration reagent in an inert solvent at a temperature in the range of -30 to 30°C , with or without the presence of an acid scavenger. Typical dehydration reagents include dicyclohexylcarbodiimide and trifluoroacetic anhydride. Polymer supported reagents such as polymer-bound cyclohexylcarbodiimide are useful. Typical acid scavengers include amine bases such as triethylamine, diisopropylethylamine and pyridine. In certain instances it is useful to use polymer supported acid scavengers such as polymer-bound diisopropylethylamine and polymer-bound dimethylaminopyridine. Typical inert solvents include aprotic solvents such as dichloromethane and *t*-chlorobutane. A typical range of reaction temperature is from -5 to 25°C .

10

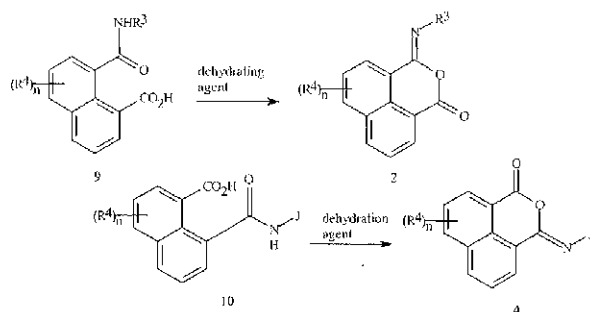
15

WO 02/32856

PCT/US01/42632

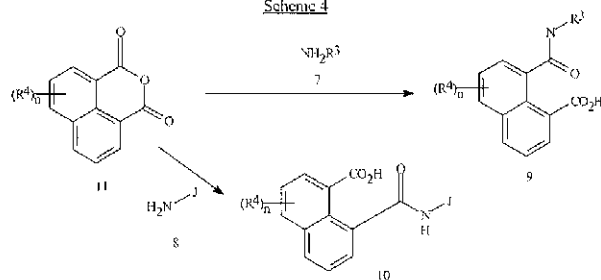
19

Scheme 3



The preparation of 8-aminocarbonyl-1-naphthalenecarboxylic acids of Formula 9 and Formula 10 involves the coupling of 1,8-naphthalic anhydrides of Formula 11 with amines of Formula 7 or amines of Formula 8 respectively (Scheme 4) in an inert solvent at a temperature in the range of 0 to 30 °C. A typical inert solvent is dimethylformamide. The reaction is commonly conducted in the temperature range of 5 to 10 °C.

Scheme 4



Alternate procedures for the preparation of compounds of 8-aminocarbonyl-1-naphthalenecarboxylic acid of Formula 9 and Formula 10 involve the hydrolysis of compounds of 1,8-naphthalimide of Formula 12 and Formula 13 respectively (Scheme 5) using a hydroxide such as sodium hydroxide or potassium hydroxide in a protic solvent system such as water-methanol or water-dioxane at elevated temperature. The reaction is usually conducted at the reflux temperature of the reaction mixture. The compounds of

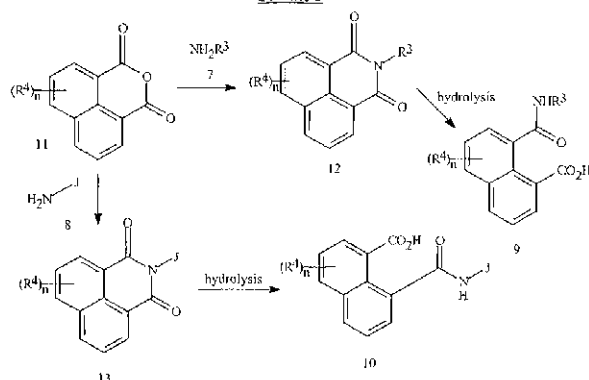
WO 02/32856

PCT/US01/42632

20

1,8-naphthalimide of Formula 12 and Formula 13 are typically prepared by condensing a 1,8-naphthalic anhydride of Formula 11 with an amine of Formula 7 or Formula 8 respectively at an elevated temperature, usually in the presence of an acid. A typical reaction involves refluxing the 1,8-naphthalic anhydride of Formula 11 and the amine of Formula 7 or Formula 8 in acetic acid.

Scheme 5

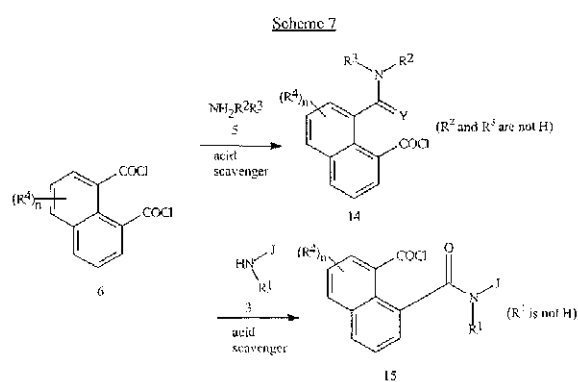
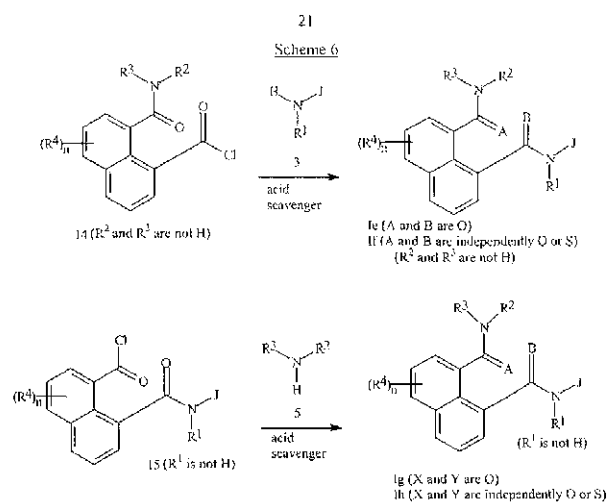


An alternate procedure for the preparation of compounds of Formula 1 involves the coupling of 8-aminocarbonyl-1-naphthoyle chlorides of Formula 14 and Formula 15 with an amine of Formula 3 or an amine of Formula 5 respectively (Scheme 6), in the presence of an acid scavenger. Typical acid scavengers include amine bases such as triethylamine, diisopropylethylamine and pyridine. In certain instances it is useful to use polymer supported acid scavengers such as polymer-bound diisopropylethylamine and polymer-bound dimethylaminopyridine. Typically, the reaction temperature range is 0 to 25 °C.

8-Aminocarbonyl-1-naphthoyle chlorides of Formula 14 and Formula 15 are available from coupling the corresponding 1,8-naphthaloyl dichloride of Formula 6 with an amine of Formula 5 or Formula 3 respectively in the presence of an acid scavenger (Scheme 7). Typical acid scavengers include amine bases such as triethylamine, diisopropylethylamine and pyridine. In certain instances it is useful to use polymer supported acid scavengers such as polymer-bound diisopropylethylamine and polymer-bound dimethylaminopyridine.

WO 02/32856

PCT/US01/42632



Another procedure for the preparation of compounds of Formula I involves the
 5 stepwise carbonylation or thiocarbonylation of a naphthalene of Formula 20 (Schemes 8
 and 9). Upon treatment with a Lewis acid under Friedel-Crafts reaction conditions,

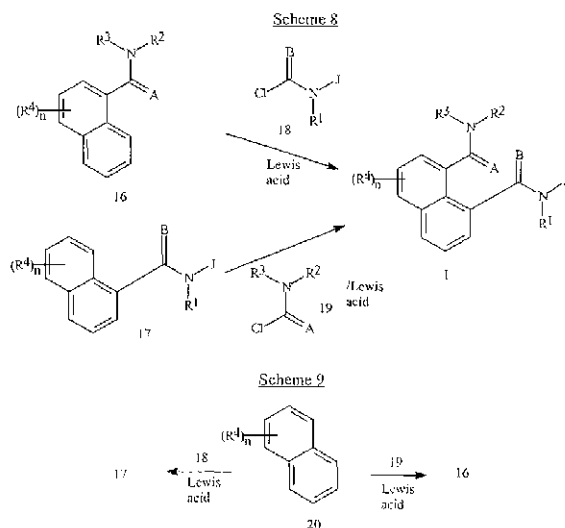
WO 02/32856

PCT/US01/42632

22

compounds of 1-naphthalenecarboxamide or 1-naphthalenethiocarboxamide of Formula 16 or Formula 17 couple with a carbamoyl chloride or thiocarbamoyl chloride of Formula 18 or Formula 19 to provide a compound of Formula 1 (Scheme 8). Commonly used Lewis acids include aluminum chloride and stannic chloride.

- 5 The preparation of compounds of 1-naphthalenecarboxamides or 1-naphthalenethiocarboxamides of Formula 16 or Formula 17 (Scheme 9) involves the coupling of a naphthalene of Formula 20 and a carbamoyl chloride or thiocarbamoyl chloride of Formula 18 or Formula 19 respectively in the presence of a Lewis acid such as aluminum chloride and stannic chloride under Friedel-Crafts reaction conditions. The naphthalenes of Formula 20, the carbamoyl chlorides and the thiocarbamoyl chlorides of
- 10 Formula 18 and Formula 19 are commercially available, well described in the chemical literature, or can be prepared following established literature procedures.



The compounds of Formula II can be prepared by one or more of the following

15 methods and variations as described in Schemes 10-13. Compounds of Formulae IIa-b are subsets of the compounds of Formula II.

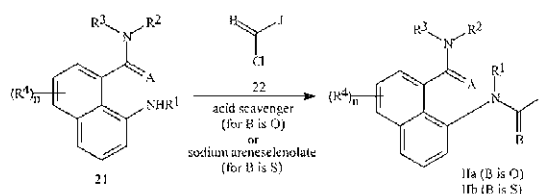
WO 02/32856

PCT/US01/42632

23

A typical procedure is described in Scheme 10 and involves coupling of an 8-amino-naphthalene-1-carboxamide of Formula 21 with a carbonyl chloride of Formula 22 in the presence of an acid scavenger to provide the compounds of Formula 11a, or with thiocarbonyl chloride of Formula 22 in the presence of an areneselenolate to provide the compounds of Formula 11b. Typical acid scavengers include amine bases such as triethylamine, diisopropylethylamine and pyridine, other scavengers include hydroxides such as sodium and potassium hydroxide and carbonates such as sodium carbonate and potassium carbonate. In certain instances it is useful to use polymer supported acid scavengers such as polymer-bound diisopropylethylamine and polymer-bound dimethylaminopyridine. Typical areneselenolates include sodium phenylselenolate. The carbonyl chlorides and the thiocarbonyl chlorides of Formula 22 are commercially available, well represented in the chemical literature, or readily prepared according to established literature procedures. Amides of Formula 11a can be converted to thioamides of Formula 11b using standard thio transfer reagents such as phosphorus pentasulfide and Lawesson's reagent.

Scheme 10

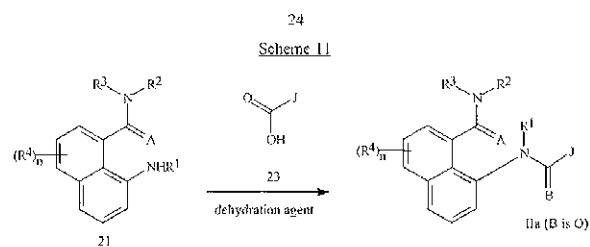


Another procedure for the preparation of compounds of Formula 11a involves coupling of an 1-amino-naphthalene-8-carboxamide or 1-amino-naphthalene-8-thiocarboxamide of Formula 21 with a carboxylic acid of Formula 23 in the presence of a dehydration reagent such as dicyclohexylcarbodiimide (DCC). Polymer supported reagents such as polymer-bound cyclohexylcarbodiimide are useful. Benzoic acids of Formula 23 are commercially available, well represented in the chemical literature, or readily prepared according to established literature procedures. The procedures of Scheme 10 and Scheme 11 are only representative examples of useful methods for the preparation of Formula 11 compounds as the literature is extensive for the preparation of carboxamides.

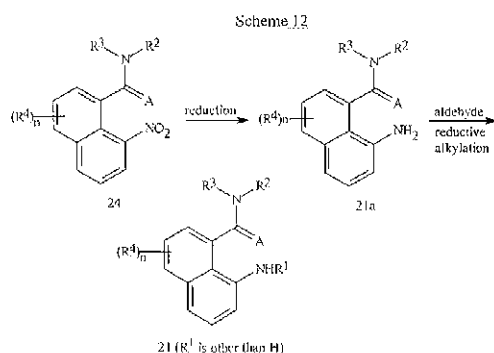
20

WO 02/32856

PCT/US01/42632



- 8-Amino-naphthalene-1-carboxamides and 8-amino-naphthalene-1-thiocarboxamides of Formula 21a are typically available from the corresponding 8-nitro-naphthalene-1-carboxamides and 8-nitro-naphthalene-1-thiocarboxamides of Formula 24 respectively via reduction of the nitro group. Typical procedures involve reduction with hydrogen in the presence of a metal catalyst such as palladium on carbon or platinum oxide and in hydroxylic solvents such as ethanol and isopropanol. These procedures are well documented in the chemical literature. R¹ substituents such as alkyl, substituted alkyl and the like can generally be introduced at this stage through known procedures including either direct alkylation or through the generally preferred method of reductive alkylation of the amine. A commonly employed procedure is to combine the aminonaphthalene 21a with an aldehyde in the presence of a reducing agent such as sodium cyanoborohydride to produce the compounds of Formula 21 where R¹ is other than H.



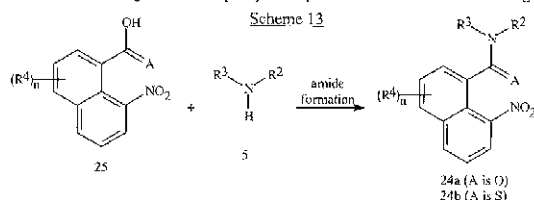
- The intermediate amides of Formula 24 are readily prepared from 8-nitro-naphthalene-1-carboxylic acids that are commercially available, known in the literature, or can be

WO 02/32856

PCT/US01/42632

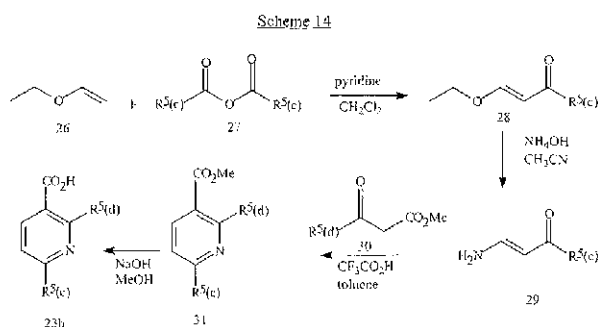
25

prepared by established literature procedures for the derivatization of naphthalenes or aromatic groups in general. Typical methods for amide formation can be applied here. These include direct dehydrative coupling of acids of Formula 25 with amines of Formula 5 using for example DCC, and conversion of the acids to an activated form such as the acid chlorides or anhydrides and subsequent coupling with amines to form amides of formula 24a. Also, diethyl cyanophosphonate is a useful reagent for this type of reaction involving activation of the acid. The chemical literature is extensive on this type of reaction. Amides of Formula 24a are readily converted to thioamides of Formula 24b by using commercially available thio transfer reagents such as phosphorus pentasulfide and Lawesson's reagent.



10 Benzoic acids of Formula 23a, (compounds of Formula 23 wherein J is an optionally substituted phenyl ring) are well known in the art. Preparation of certain heterocyclic acids of Formula 4 are described in Schemes 14-21. A variety of heterocyclic acids and general methods for their synthesis may be found in World Patent Application WO 98/57397.

15 The synthesis of representative pyridine acids (23b) is depicted in Scheme 14. This procedure involves the known synthesis of pyridines from β -ketoesters and 4-aminobutenones (29). Substituent groups $R^{5(c)}$ and $R^{5(d)}$ include e.g. alkyl and haloalkyl.



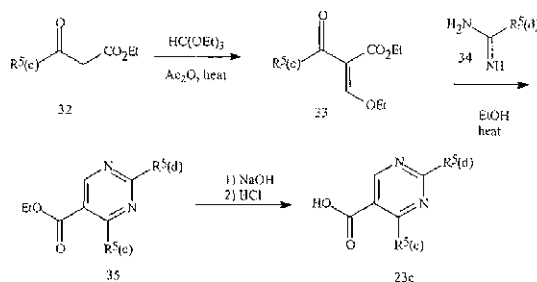
WO 02/32856

PCT/US01/42632

26

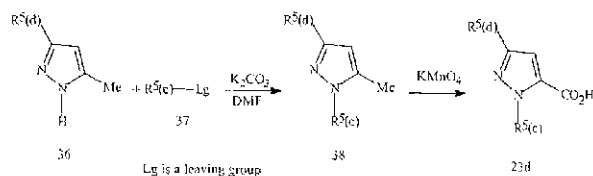
The synthesis of representative pyrimidine acids (23c) is depicted in Scheme 15. This procedure involves the known synthesis of pyrimidines from vinylidene- β -ketoesters (33) and amidines (34). Substituent groups $R^{5(c)}$ and $R^{5(d)}$ include e.g. alkyl and haloalkyl.

Scheme 15



- 5 Syntheses of representative pyrazole acids (23d) are depicted in Schemes 16-21. The synthesis of 23d in Scheme 16 involves as the key step introduction of the $R^{5(c)}$ substituent via arylation or alkylation of the pyrazole. The arylating or alkylating agent $R^{5(c)}-Lg$ (wherein Lg is a leaving group such as Cl, Br, I, sulfonates such as p-toluenesulfonate or methanesulfonate or sulfates such as $-SO_2OR^{5(c)}$) includes $R^{5(c)}$ groups such as C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl, C₃-C₆ trialkylsilyl, or phenyl, benzyl, benzoyl, 5- or 6-membered heteroaromatic ring each ring or ring system optionally substituted. Oxidation of the methyl group affords the pyrazole carboxylic acid. Some of the more preferred $R^{5(d)}$ groups include haloalkyl.
- 10

Scheme 16



15

Synthesis of pyrazoles of Formula 23d are described in Scheme 17. These acids may be prepared via metallation of compounds of Formula 40 with lithium diisopropylamide

WO 02/32856

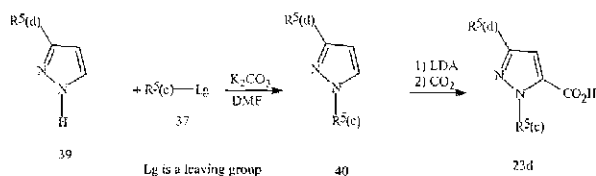
PCT/US01/42632

27

(LDA) followed by quenching of the lithium salt with carbon dioxide affords metallation using lithium diisopropylamide (LDA) and carboxylation of compounds of Formula 40 as the key step. The $R^5(c)$ group is introduced in a manner similar to that of Scheme 16, i.e. via alkylation or arylation with a compound of Formula 37. Representative $R^5(d)$ groups

5 include e.g. cyano, haloalkyl and halogen.

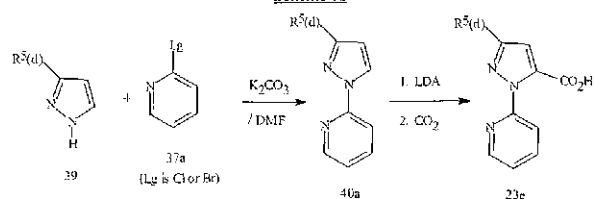
Scheme 17



This procedure is particularly useful for preparing 1-(2-pyridinyl)pyrazolecarboxylic acids of Formula 23c as shown in Scheme 18. Reaction of a pyrazole of Formula 39 with a 2,3-dihalopyridine of Formula 37a affords good yields of the 1-pyridylpyrazole of Formula 40a with good specificity for the desired regiochemistry. Metallation and carboxylation of compounds of Formula 40a as described above affords the 1-(2-pyridinyl)pyrazolecarboxylic acid of Formula 23e.

10

Scheme 18



The synthesis of pyrazoles of Formula 4c is described in Scheme 19. They can be prepared via reaction of an optionally substituted phenyl hydrazine of Formula 41 with a ketopyruvate of Formula 42 to yield pyrazole esters of Formula 43. Hydrolysis of the esters affords the pyrazole acids of Formula 23d. This procedure is particularly useful for the preparation of compounds in which $R^5(c)$ is optionally substituted phenyl and $R^5(d)$ is haloalkyl.

15

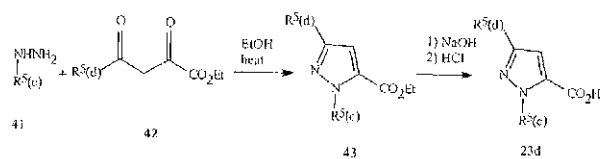
20

WO 02/32856

PCT/US01/42632

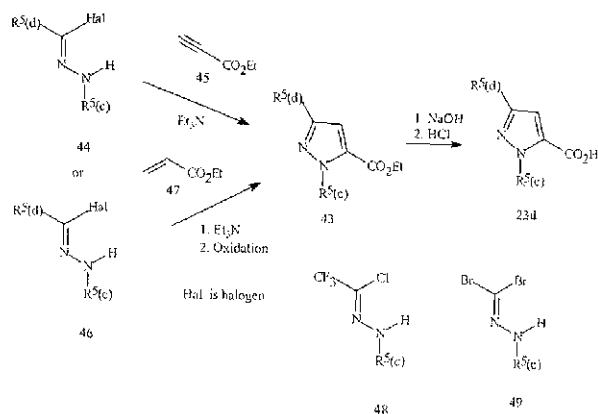
28

Scheme 19



- An alternate synthesis of pyrazole acids of Formula 23d is described in Scheme 20. They can be prepared via 3+2 cycloaddition of an appropriately substituted nitrilimine with either substituted propiolates of Formula 45 or acrylates of Formula 47. Cycloaddition with an acrylate requires additional oxidation of the intermediate pyrazoline to the pyrazole. Hydrolysis of the esters affords the pyrazole acids of Formula 23d. Preferred iminohalides for this reaction include the (trifluoromethyl) iminochloride of Formula 48 and the iminodibromide of Formula 49. Compounds such as 48 are known (*J. Heterocycl. Chem.* **1985**, 22(2), 565-8). Compounds such as 49 are available by known methods (*Tetrahedron Letters* **1999**, 40, 2605). These procedures are particularly useful for the preparation of compounds where $R^5(c)$ is optionally substituted phenyl and $R^5(d)$ is haloalkyl or bromo.

Scheme 20



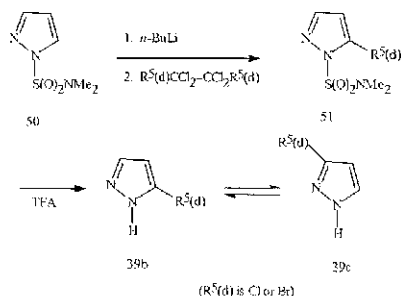
WO 02/32856

PCT/US01/42632

29

The starting pyrazoles of Formula 39 are known compounds. The pyrazole of Formula 39a (the compound of Formula 39 wherein $R^5(d)$ is CF_3) is commercially available. The pyrazoles of Formula 39c (compounds of Formula 39 wherein $R^5(d)$ is Cl or Br) can be prepared by literature procedures (*Chem. Ber.* 1966, 99(10), 3350-7). A useful alternative method for the preparation of compound 39c is depicted in Scheme 21. Metallation of the sulfamoyl pyrazole of Formula 50 with *n*-butyllithium followed by direct halogenation of the anion with either hexachloroethane (for $R^5(d)$ being Cl) or 1,2-dibromotetrachloroethane (for $R^5(d)$ being Br) affords the halogenated derivatives of Formula 51. Removal of the sulfamoyl group with trifluoroacetic acid (TFA) at room temperature proceeds cleanly and in good yield to afford the pyrazoles of Formula 39c. One skilled in the art will recognize that Formula 39c is a tautomer of Formula 39b.

Scheme 21



It is recognized that some reagents and reaction conditions described above for preparing compounds of Formula I and Formula II may not be compatible with certain functional groups present in the intermediates. In these instances, the incorporation of protection/deprotection sequences or functional group interconversions into the synthesis will aid in obtaining the desired products. The use and choice of the protecting groups will be apparent to one skilled in chemical synthesis (see, for example, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). One skilled in the art will recognize that, in some cases, after the introduction of a given reagent as it is depicted in any individual scheme, it may be necessary to perform additional routine synthetic steps not described in detail to complete the synthesis of compounds of Formula I and II. One skilled in the art will also recognize that it may be necessary to perform a combination of the steps illustrated in the above schemes in an order other than that implied by the particular sequence presented to prepare the compounds of Formula I and II.

WO 02/32856

PCT/US01/42632

30

One skilled in the art will also recognize that compounds of Formula I and II and the intermediates described herein can be subjected to various electrophilic, nucleophilic, radical, organometallic, oxidation, and reduction reactions to add substituents or modify existing substituents.

- 5 Without further elaboration, it is believed that one skilled in the art using the preceding description can utilize the present invention to its fullest extent. The following Examples are, therefore, to be construed as merely illustrative, and not limiting of the disclosure in any way whatsoever. ¹H NMR spectra are reported in ppm downfield from tetramethylsilane: s is singlet, d is doublet, t is triplet, q is quartet, m is multiplet, dd is doublet of doublets, 10 dt is doublet of triplets, br s is broad singlet. m. p. is melting point.

EXAMPLE I

Preparation of N-methyl-N'-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,8-naphthalene-dicarboxamideStep A: Preparation of 8-[(methylamino)carbonyl]-1-naphthalenecarboxylic acid

- To a stirred solution of 1,8-naphthalic anhydride (5 g, 25.3 mmole) in 15 N,N-dimethylformamide (50 mL) at room temperature, methylamine (0.82 g, 26.5 mmole) in N,N-dimethylformamide (5 mL) was added. The reaction mixture was stirred for 2.5 hours. The solvent was removed under reduced pressure. The crude solid thus obtained was washed with a small amount of diethyl ether and air dried to give the product (5 g), containing 8-[(methylamino)carbonyl]-1-naphthalenecarboxylic acid and 1,8-naphthalic 20 anhydride in a ratio of ~7 to 1 determined by NMR analysis. This material was used for the subsequent reaction without further purification.

¹H NMR (DMSO-d₆) δ: 2.77 (doublet, 3H), 7.55-7.65 (multiplet, 3H), 7.83 (doublet, 1H), 8.03-8.12 (multiplet, 2H), 8.39 (quartet, 1H).

Step B: Preparation of N-methyl-N'-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,8-naphthalene-dicarboxamide

- To a stirred solution of 8-[(methylamino)carbonyl]-1-naphthalenecarboxylic acid (22.3 g, 97.4 mmole) prepared as described in Step A and pyridine (15.4 g, 0.195 mole) in 30 dichloromethane (300 mL) cooled to ~5 °C under nitrogen atmosphere, trifluoroacetic anhydride (22.5 g, 0.107 mole) diluted in dichloromethane (50 mL) was added in a dropwise manner. After the addition, the reaction mixture was further stirred at ambient temperature for one half of an hour. A small amount of solid was filtered off. The filtrate was concentrated under reduced pressure to a solid that was extracted with hot hexane (3 x 250 mL). The hexane extracts were combined and concentrated under reduced pressure to give a crude product of 3-(methylimino)-1H,3H-naphtho[1,8-cd]pyran-1-one (15 g). 35 The 3-(methylimino)-1H,3H-naphtho[1,8-cd]pyran-1-one (0.25 g, 1.19 mmole) thus obtained was dissolved in dichloromethane (3 mL) and 2-bromo-4-fluoroaniline (0.17 g, 1.45 mmole) was added. The reaction mixture was stirred at room temperature for 48 hours.

WO 02/32856

PCT/US01/42632

31

The solid was filtered, collected and washed with a small amount of methanol in dichloromethane and air dried to give *N*-methyl *N*'-(2-methyl-4-fluorophenyl)-1,8-naphthalene-dicarboxamide (0.12 g, m. p. 249 °C).

¹H NMR (DMSO-d₆) δ: 2.37 (singlet, 3H), 2.72 (doublet, 3H), 7.05-7.12 (multiplet, 2H), 7.54-7.64 (multiplet, 3H), 7.75-7.83 (multiplet, 2H), 8.05-8.10 (multiplet, 2H), 8.33 (quartet, 1H), 9.84 (singlet, 1H).

EXAMPLE 2

Preparation of *N*-methyl 8-[(3,4-difluorophenyl)carbonylamino]-1-naphthalenecarboxamideStep A: Preparation of *N*-methyl 8-nitro-1-naphthalenecarboxamide

To a stirred solution of 8-nitro-1-naphthalenecarboxylic acid (1.5 g, 6.9 mmole), methylamine (0.22 g, 7.3 mmole), and imidazole (0.68 g, 8.3 mmole) in *N,N*-dimethylformamide (12 mL) at room temperature, diethyl cyanophosphonate (1.24 g, 7.6 mmole) was added. The reaction mixture was stirred overnight, poured into water (100 mL) and extracted with ethyl acetate (3 x 100 mL). The ethyl acetate extracts were combined, dried over anhydrous magnesium sulfate, filtered, and concentrated under reduced pressure to give a solid which was washed with a small amount of methanol to give the product (0.64 g) which was used without further purification.

¹H NMR (DMSO-d₆) δ: 2.76 (doublet, 3H), 7.72-8.37 (multiplet, 6H), 8.66 (broad quartet, 1H).

Step B: Preparation of *N*-methyl 8-amino-1-naphthalenecarboxamide

N-methyl 8-nitro-1-naphthalenecarboxamide (0.5 g, 2.17 mmole) in methanol (5 mL) and dichloromethane (15 mL) was hydrogenated with a catalytic amount of palladium (10% on charcoal) under 30 psi hydrogen pressure for 1 hour. The reaction mixture was suction filtered through celite and concentrated under reduced pressure to provide the product (0.42 g) which was used without further purification.

¹H NMR (DMSO-d₆) δ: 2.82 (doublet, 3H), 5.46 (singlet, 2H), 6.81-7.85 (multiplet, 6H), 8.59 (broad quartet, 1H).

Step C: Preparation of *N*-methyl 8-[(3,4-difluorophenyl)carbonylamino]-1-naphthalenecarboxamide

To a stirred solution of *N*-methyl 8-amino-1-naphthalenecarboxamide (0.2 g, 1 mmole) and pyridine (0.24 g, 3 mmole) in dichloromethane (10 mL), acetyl chloride (94.2 mg, 1.2 mmole) in dichloromethane (2 mL) was added in portions. The mixture was stirred for 3 hours. The solid was collected with suction filtration (110 mg, m. p. >250 °C).

¹H NMR (DMSO-d₆) δ: 2.43 (doublet, 3H), 7.46-8.10 (multiplet, 9H), 8.51 (broad quartet, 1H), 10.13 (singlet, 1H).

WO 02/32856

PCT/US01/42632

32

EXAMPLE 3

Preparation of *N*-methyl *S*-[2-(2-thienyl)carbonylamino]-1-naphthalenecarboxamide

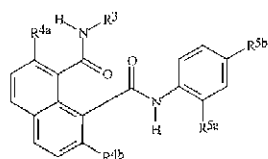
To a stirred solution of *N*-methyl 8-amino-1-naphthalenecarboxamide (0.2 g, 1 mmole) and pyridine (0.24 g, 3 mmole) in dichloromethane (10 mL), 2-thiophenecarboxylic acid chloride (176 mg, 1.2 mmole) in dichloromethane (2 mL) was added in portions. The mixture was stirred for 3 hours. The reaction mixture was washed sequentially with dilute hydrochloric acid, saturated sodium bicarbonate aqueous solution, and water. The solvent was partially removed under reduced pressure. The solid thus formed was collected with suction filtration (36 mg, m. p. 210 °C).

¹H NMR (DMSO-*d*₆) δ: 2.53 (doublet, 3H), 7.26-8.10 (multiplet, 9H), 8.66 (broad quartet, 1H), 10.07 (singlet, 1H).

By the procedures described herein together with methods known in the art, the following compounds of Tables 1 to 10 can be prepared. The following abbreviations are used in the Tables: *t* is tertiary, *s* is secondary, *n* is normal, *i* is iso, *c* is cyclo, Me is methyl,

Et is ethyl, Pr is propyl, *i*-Pr is isopropyl, *t*-Bu is tert butyl, Ph is phenyl, OMe is methoxy, OEt is ethoxy, SMe is methylthio, SEt is ethylthio, CN is cyano, NO₂ is nitro, TMS is trimethylsilyl, S(O)Me is methylsulfinyl, and S(O)₂Me is methylsulfonyl.

Table 1



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

WO 02/32856

PCT/US01/42632

33

R ²	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMc	Me	H	H	Me	SMc
Me	H	Me	Me	OMc	Me	H	H	Me	OMc
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMc	CF ₃	Me	H	H	OMc	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCHF ₃	Me	H	H	H	OCHF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

34

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	Cl	Me	H	H	2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

35

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCT ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₂	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OFt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

36

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCT ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCT ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SClF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	OCT ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCT ₃	Me	H	Cl	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	OCT ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCT ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	Ph	Br
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	2-pyridyl	Cl

WO 02/32856

PCT/US01/42632

37

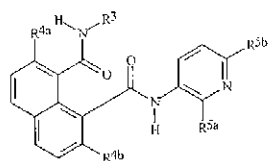
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2,3-F ₂ Ph	CF ₃
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	Me	OMe
Et	Cl	H	H	C ₃ F ₅					

WO 02/32856

PCT/US01/42632

38

Table 2



R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OBt	Me	H	H	Me	OBt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et

WO 02/32856

PCT/US01/42632

39

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	Cl	Me	H	H	2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

40

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCH ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCH ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇

WO 02/32856

PCT/US01/42632

41

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₃ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHEF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHEF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHEF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHEF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

42

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃

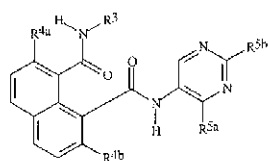
WO 02/32856

PCT/US01/42632

43

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₃ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Ho-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

Table 3



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

44

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMc	Me	H	H	Me	SMc
Me	H	Me	Me	OMc	Me	H	H	Me	OMc
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMc	CF ₃	Me	H	H	OMc	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl

WO 02/32856

PCT/US01/42632

45

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	Cl	Me	H	H	2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	Cl

WO 02/32856

PCT/US01/42632

46

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCHF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCHF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCHF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br

WO 02/32856

PCT/US01/42632

47

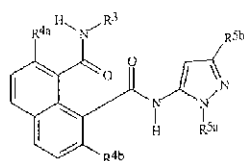
<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	Cl ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	C	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	C	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	C	H	H	SCF ₂ CHF ₂

WO 02/32856

PCT/US01/42632

48

R ²	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	3-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Cl ₂	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCCHF ₂	Me	H	H	Me	OCCHF ₂
<i>n</i> -Pr	H	Me	Me	CF ₃	<i>n</i> -Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	<i>n</i> -Pr	CF ₃	Me	H	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
Me	H	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₃	Me	H	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	H	Me	<i>i</i> -Pr	OCF ₃	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂

WO 02/32856

PCT/US01/42632

50

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CHF ₂	Cl ₃	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	CHF ₂	Me	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	2-pyridyl	Cl	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	Et	Br

WO 02/32856

PCT/US01/42632

5)

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Cl	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Et	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	OSCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OSCHF ₂	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMc
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Me	SMc	Me	H	Cl	Me	OFr
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OFr	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂

WO 02/32856

PCT/US01/42632

52

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-OMe	CF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	Et	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	Me	SMc
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	Me	OMe
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	Me	OEt
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	Et
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	Me	SCF ₃ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	CF ₃	Me

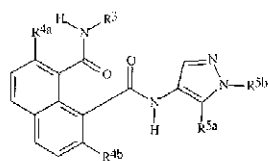
WO 02/32856

PCT/US01/42632

53

R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	OMe	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	Ph	Br
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	2-pyridyl	Cl ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₂ -2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	2-OMe	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	2-ClPh	Br	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃

Table 5



R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	Me	H	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Et	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CBrF ₂	Me	H	H	Me	CBrF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂

WO 02/32856

PCT/US01/42632

54

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Et	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	n-Pr	Me	H	H	Me	n-Pr
Me	H	Me	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
n-Pr	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CHF ₂	Me	H	H	i-Pr	CHF ₂
Me	H	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	F	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	CClF ₂	Me	H	H	Me	CClF ₂
Me	H	Me	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Allyl	Me	H	H	Me	Allyl
Me	H	Me	Et	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	i-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	OMe	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	i-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Ph	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂

WO 02/32856

PCT/US01/42632

55

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CHF ₂	Me	H	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	Et	Me	H	H	2-ClPh	Et
Me	H	Me	2-ClPh	CBrF ₂	Me	H	H	2-ClPh	CBrF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
Me	Me	H	H	CBrF ₂	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Et	CHF ₂
Me	Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

56

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	Me	CBF ₂	Me	H	Cl	Me	CF ₃ CHF ₂
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Et	H	Cl	Me	CHF ₂
Et	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	CBF ₂
Me	Me	H	Me	n-Pr	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	n-Pr	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	n-Pr
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	i-Pr	CHF ₂	Me	H	Cl	Cl	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	F	CHF ₂
Me	Me	H	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CClF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CH ₂ Cl
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CClF ₂
Me	Me	H	Me	Allyl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	Me	H	Me	CF ₃ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	Allyl
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃ CHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	Me
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Et	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CF ₂ CH ₂ F ₂	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

57

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	CHF ₂
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	CHF ₂	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	Et	Me	H	Cl	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	CBrF ₂	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Et
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CBrF ₂
Me	Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-pyridyl	CBrF ₂
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	F	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	CHF ₂
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

58

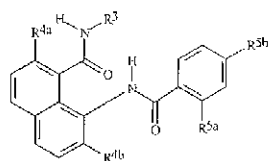
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CH ₂ Cl
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	CClF ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇
Et	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CBF ₂	Me	Cl	H	Me	Allyl
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	i-C ₃ F ₇
n-Pr	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	n-Pr	Me	Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂
Et	Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	Me
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CHF ₂	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂	Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CBF ₂	Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂	Me	Cl	H	Ph	CHF ₂
Me	Cl	H	2-ClPh	CHF ₂	Me	Cl	H	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-ClPh	Et	Me	Cl	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	2-ClPh	CBF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃					

WO 02/32856

PCT/US01/42632

59

Table 6



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et

WO 02/32856

PCT/US01/42632

60

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	Cl	Me	H	H	2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

61

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇

WO 02/32856

PCT/US01/42632

62

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

63

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	2-PPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Cl-3,2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-3,2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃

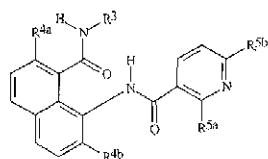
WO 02/32856

PCT/US01/42632

64

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OEt	Me	Cl	H	2-MeC(Ph)	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	H	OC(=O)H ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

Table 7



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

65

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMc	Me	H	H	Me	SMc
Me	H	Me	Me	OMc	Me	H	H	Me	OMc
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCHF ₂	Me	H	H	H	OCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl

WO 02/32856

PCT/US01/42632

66

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	Cl	Me	H	H	2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl ₂ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Cl ₂ -2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	1

WO 02/32856

PCT/US01/42632

67

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₃
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br

WO 02/32856

PCT/US01/42632

68

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂

WO 02/32856

PCT/US01/42632

69

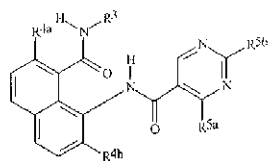
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMc	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMc	Me	Cl	H	2,3-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCt	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃	Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Cl	H	CF ₂	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

WO 02/32856

PCT/US01/42632

70

Table 8



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	Cl	CF ₃
Me	H	Me	F	CF ₃	Me	H	H	F	CF ₃
Me	H	Me	Me	SMe	Me	H	H	Me	SMe
Me	H	Me	Me	OMe	Me	H	H	Me	OMe
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	OEt
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et

WO 02/32856

PCT/US01/42632

71

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CF ₃	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCCHF ₂	Me	H	H	H	OCCHF ₂
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	Br	Me	H	H	H	Br
Me	H	Me	H	Cl	Me	H	H	H	Cl
Me	H	Me	H	SCF ₃	Me	H	H	H	SCF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	Cl	Me	H	H	2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	SCCHF ₂	Me	H	H	2-ClPh	SCCHF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

72

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	Br	Br
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	Cl
Et	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	I
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Et	Cl	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	I	Me	H	Cl	Me	SCH ₂ F
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCH ₂ F	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Et	CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Cl	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	F	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMc
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMc
Me	Me	H	Cl	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OEt
Me	Me	H	F	CF ₃	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	SMc	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇

WO 02/32856

PCT/US01/42632

73

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	OMe	CF ₃	Et	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CF ₃	Me	H	Cl	H	OCF ₂
Me	Me	H	H	OCHF ₂	Me	H	Cl	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	SCF ₂ CHF ₂
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₃	Me	H	Cl	H	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Br
Me	Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	Cl
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	SCF ₃
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	Br	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	H	Cl	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	H	SCF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

74

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	2-FlPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-MeOPh	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	Cl	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	H	Br
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	H	Cl
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	H	SCF ₃
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Br
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	Et	CF ₃	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Cl	H	2-Ph	CF ₃

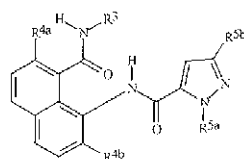
WO 02/32856

PCT/US01/42632

75

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Cl	H	F	CF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SMc	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Cl	H	Me	OMe	Me	Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CH ₂ F ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CH ₂ F ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me	Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	OMe	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Cl	H	H	CF ₃	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Cl	H	H	OCHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅	Et	Cl	H	H	C ₂ F ₅

Table 2



<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	H	Me	H	CF ₃	Me	H	H	H	CF ₃
Me	H	Me	H	OCF ₃	Me	H	H	H	OCF ₃
Et	H	Me	H	OCF ₃	Et	H	H	H	OCF ₃
Me	H	Me	Me	Br	Me	H	H	Me	Br
Me	H	Me	Et	Br	Me	H	H	Et	Br
Me	H	Me	Me	Cl	Me	H	H	Me	Cl
Me	H	Me	Et	Cl	Me	H	H	Et	Cl
Me	H	Me	Me	I	Me	H	H	Me	I
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

76

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	Me	OCF ₃	Me	H	H	Me	OCF ₃
Et	H	Me	Me	CF ₃	Et	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	SCF ₃	Me	H	H	Me	SCF ₃
Me	H	Me	Me	SCHF ₂	Me	H	H	Me	SCHF ₂
Me	H	Me	Me	OCHF ₂	Me	H	H	Me	OCHF ₂
n-Pr	H	Me	Me	CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CF ₃
Me	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	C ₂ F ₅
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CF ₃	Me	H	H	Et	CF ₃
Me	H	Me	n-Pr	CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CF ₃	Me	H	H	i-Pr	CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	OCF ₃	Me	H	H	Me	SMc
Me	H	Me	Me	SMc	Me	H	H	Me	OMc
Me	H	Me	Me	OMc	Me	H	H	Me	OH
Me	H	Me	Me	OEt	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	SO ₂ Me
Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	Me	H	H	Me	SO ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	H	CF ₃	CF ₃
Me	H	Me	CHCl ₂	CF ₃	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	CHF ₂	Me	Me	H	H	Ph	CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₃	Me	H	H	Ph	Cl
Me	H	Me	Ph	Cl	Me	H	H	Ph	Br
Me	H	Me	Ph	Br	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	2-pyridyl	Cl	Me	H	H	2-ClPh	CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	H	2-ClPh	Br
Me	H	Me	2-ClPh	Br	Me	H	H	2-ClPh	Cl
Me	H	Me	2-ClPh	Cl	Me	H	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	H	2-BrPh	CF ₃
Me	H	Me	2-BrPh	CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

77

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	2-FPh	CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	Et	Br
Me	Me	H	Me	Br	Me	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	Et	Br	Me	H	Cl	Et	Cl
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	Cl
Me	Me	H	Et	Cl	Me	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	Cl	Me	H	Cl	Me	OCF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	H	Cl	Me	SCF ₃
Et	Me	H	Me	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCF ₃	Me	H	Cl	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	Me	SCHF ₂	n-Pr	H	Cl	Me	CF ₃
Me	Me	H	Me	OCHF ₂	Me	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
n-Pr	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CF ₃
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	n-Pr	CF ₃
Me	Me	H	Et	CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	SMe
Me	Me	H	i-Pr	CF ₃	Me	H	Cl	Me	OMe
Me	Me	H	Me	SMe	Me	H	Cl	Me	OEt

WO 02/32856

PCT/US01/42632

78

<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>	<u>R³</u>	<u>R^{4a}</u>	<u>R^{4b}</u>	<u>R^{5a}</u>	<u>R^{5b}</u>
Me	Me	H	Me	OMe	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	OEt	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	Br
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ Me
Me	Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ Me	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	Me	H	Cl	CF ₃	Me
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CF ₃
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	Ph	Cl
Me	Me	H	Ph	CF ₃	Me	H	Cl	Ph	Br
Me	Me	H	Ph	Cl	Me	H	Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Ph	Br	Me	H	Cl	2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	2-ClPh	OCF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Br
Me	Me	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Cl
Me	Me	H	2-ClPh	Br	Me	H	Cl	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	Cl	Me	H	Cl	2-BrPh	CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	Me	H	Cl	2-MePh	CF ₃
Me	Me	H	2-BrPh	CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2-FPh	CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	2-OMe	CF ₃
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	H	Cl	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-CF ₂ -2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

79

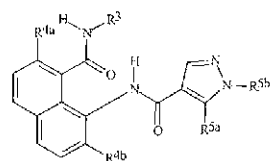
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Br
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	Et	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Me	Br	Me	Cl	H	i-Pr	CF ₃
Me	Cl	H	Et	Br	Me	Cl	H	Me	SMe
Me	Cl	H	Me	Cl	Me	Cl	H	Me	OMe
Me	Cl	H	Et	Cl	Me	Cl	H	Me	UEt
Me	Cl	H	Me	I	Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	Et
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCF ₃	Me	Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	SCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ Me
Me	Cl	H	Me	OCHF ₂	Me	Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
n-Pr	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	CF ₃	CF ₃
Me	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	CF ₃	Me
Et	Cl	H	Me	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	OMe	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃	Me	Cl	H	Ph	Cl
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	Ph	Br
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂	Me	Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Br
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br	Me	Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl	Me	Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CF ₃
Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Me	Cl	H	2-OMe	CF ₃	Me	Cl	H	2-FPh	CF ₃
Me	Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

80

Table 10



R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}	R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{5a}	R^{5b}
Me	H	Me	H	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Et	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂
Me	H	Me	Me	CBrF ₂	Me	H	H	Me	CBrF ₂
Me	H	Me	Me	CHF ₂	Me	H	H	Me	CHF ₂
Et	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	Et	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	Et	Me	H	H	Me	Et
Me	H	Me	Me	n-Pr	Me	H	H	Me	n-Pr
Me	H	Me	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	H	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
n-Pr	H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	n-Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CF ₃	Me	H	H	Me	CF ₃
Et	H	Me	Me	C ₂ F ₅	Et	H	H	Me	C ₂ F ₅
Me	H	Me	Et	CHF ₂	Me	H	H	Et	CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	i-Pr	CHF ₂	Me	H	H	i-Pr	CHF ₂
Me	H	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	F	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Me	CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	CClF ₂	Me	H	H	Me	CClF ₂
Me	H	Me	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	H	Me	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Me	Allyl	Me	H	H	Me	Allyl

WO 02/32856

PCT/US01/42632

81

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	Et	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Et	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	Me	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	i-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	n-Pr	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	H	CF ₃	Me
Me	H	Me	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	OMe	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Et	H	Me	H	C ₂ F ₅	Et	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	C ₂ F ₅	Me	H	H	H	C ₂ F ₅
Me	H	Me	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	i-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	H	Me	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	H	Me	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	H	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	Ph	CHF ₂	Me	H	H	H	CHF ₂
Me	H	Me	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	CHF ₂	Me	H	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	H	Me	2-ClPh	Et	Me	H	H	2-ClPh	Et
Me	H	Me	2-ClPh	CBrF ₂	Me	H	H	2-ClPh	CBF ₂
Me	H	Me	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	2-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	2-MeOPh	CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

82

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
Me	H	Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
Me	H	Me	3-F-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ ClF ₂	Me	H	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	H	Me	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Et	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Et	CHF ₂
Me	Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Et	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CBrF ₂	Me	H	Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Me	CHF ₂	Et	H	Cl	Me	CHF ₂
Et	Me	H	Me	CH ₂ ClF ₂	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	Et	Me	H	Cl	Me	CBrF ₂
Me	Me	H	Me	n-Pr	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	n-Pr	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
n-Pr	Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	Et
Me	Me	H	Me	CF ₃	Et	H	Cl	Me	n-Pr
Et	Me	H	Me	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
Me	Me	H	Et	CHF ₂	Me	H	Cl	n-Pr	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	n-Pr	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	i-Pr	CF ₃
Me	Me	H	i-Pr	CHF ₂	Me	H	Cl	Cl	C ₂ F ₅
Me	Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	F	CHF ₂
Me	Me	H	F	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CHF ₂
Me	Me	H	Me	CClF ₂	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CH ₂ Cl

WO 02/32856

PCT/US01/42632

83

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	CClF ₂
Me	Me	H	Me	Allyl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Me	Me	H	Me	CF ₃ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	Me	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Me	Allyl
Me	Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	CF ₃ CHF ₂
Me	Me	H	CF ₃	CF ₃ CHF ₂	Me	H	Cl	CF ₃	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	H	Cl	OMe	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	Me
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Et	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Et	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	C ₂ F ₅	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	n-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	C ₂ F ₅
Me	Me	H	H	i-C ₃ F ₇	Me	H	Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	H	n-C ₃ F ₇
Me	Me	H	H	CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	i-C ₃ F ₇
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-pyridyl	CHF ₂
Me	Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-pyridyl	CH ₃ CF ₃
Me	Me	H	2-pyridyl	CHF ₂	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	Et	Me	H	Cl	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-ClPh	CFBrF ₂	Me	H	Cl	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	CHF ₂
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-ClPh	Et
Me	Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-BrPh	CH ₂ F ₂
Me	Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-FPh	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	2-MeOPh	CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	ClI ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
Me	Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-4-2-pyridyl	CBrF ₂
Me	Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	H	Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂	Me	H	Cl	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ Cl ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	H	Cl	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃	Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	H	ClI ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	n-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	i-C ₃ F ₇
Me	Cl	H	Et	ClI ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Ph	ClI ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHIF ₂	Me	Cl	H	Ph	CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Et	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2-pyridyl	CH ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CBrF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	ClI ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-ClPh	CHF ₂
n-Pr	Cl	H	Me	Et	Me	Cl	H	2-ClPh	Et
Me	Cl	H	Me	n-Pr	Me	Cl	H	2-ClPh	CBrF ₂
Et	Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	n-Pr	CF ₃	Me	Cl	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	i-Pr	C ₂ F ₅	Me	Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Cl	CHF ₂	Me	Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	F	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CHF ₂	Me	Cl	H	2,5-F ₂ Ph	ClI ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃

WO 02/32856

PCT/US01/42632

85

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ Cl	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	Cl	H	Me	CClF ₂	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
Me	Cl	H	Me	n-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
Me	Cl	H	Me	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-F-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	i-C ₃ F ₇	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ ClF ₂
Me	Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
Me	Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	H	Me	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	H	C ₂ F ₅
Et	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	H	Me	Allyl
Me	Cl	H	H	CH ₂ CF ₃					

Formulation/Utility

- Compounds of this invention will generally be used as a formulation or composition with an agriculturally suitable carrier comprising at least one of a liquid diluent, a solid diluent or a surfactant. The formulation or composition ingredients are selected to be consistent with the physical properties of the active ingredient, mode of application and environmental factors such as soil type, moisture and temperature. Useful formulations include liquids such as solutions (including emulsifiable concentrates), suspensions, emulsions (including microemulsions and/or suspoemulsions) and the like which optionally can be thickened into gels. Useful formulations further include solids such as dusts, powders, granules, pellets, tablets, films, and the like which can be water-dispersible ("wetttable") or water-soluble. Active ingredient can be (micro)encapsulated and further formed into a suspension or solid formulation; alternatively the entire formulation of active ingredient can be encapsulated (or "overcoated"). Encapsulation can control or delay release of the active ingredient. Sprayable formulations can be extended in suitable media and used at spray volumes from about one to several hundred liters per hectare. High-strength compositions are primarily used as intermediates for further formulation.

The formulations will typically contain effective amounts of active ingredient, diluent and surfactant within the following approximate ranges that add up to 100 percent by weight.

WO 02/32856

PCT/US01/42632

86

	Weight Percent		
	Active Ingredient	Diluent	Surfactant
Water-Dispersible and Water-soluble Granules, Tablets and Powders.	5-90	0-94	1-15
Suspensions, Emulsions, Solutions (including Emulsifiable Concentrates)	5-50	40-95	0-15
Dusts	1-25	70-99	0-5
Granules and Pellets	0.01-99	5-99.99	0-15
High Strength Compositions	90-99	0-10	0-2

Typical solid diluents are described in Watkins, et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Typical liquid diluents are described in Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950. *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual*, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, as well as Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964, list surfactants and recommended uses. All formulations can contain minor amounts of additives to reduce foam, caking, corrosion, microbiological growth and the like, or thickeners to increase viscosity.

Surfactants include, for example, polyethoxylated alcohols, polyethoxylated alkylphenols, polyethoxylated sorbitan fatty acid esters, dialkyl sulfosuccinates, alkyl sulfates, alkylbenzene sulfonates, organosilicones, *N,N*-dialkylaurates, lignin sulfonates, naphthalene sulfonate formaldehyde condensates, polycarboxylates, and polyoxyethylene/polyoxypropylene block copolymers. Solid diluents include, for example, clays such as bentonite, montmorillonite, attapulgite and kaolin, starch, sugar, silica, talc, diatomaceous earth, urea, calcium carbonate, sodium carbonate and bicarbonate, and sodium sulfate. Liquid diluents include, for example, water, *N,N*-dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, *N*-alkylpiperidone, ethylene glycol, polypropylene glycol, paraffins, alkylbenzenes, alkylnaphthalenes, oils of olive, castor, linseed, tung, sesame, corn, peanut, cotton-seed, soybean, rape-seed and coconut, fatty acid esters, ketones such as cyclohexanone, 2-heptanone, isophorone and 4-hydroxy-4-methyl-2-pentanone, and alcohols such as methanol, cyclohexanol, decanol and tetrahydrofurfuryl alcohol.

Solutions, including emulsifiable concentrates, can be prepared by simply mixing the ingredients. Dusts and powders can be prepared by blending and, usually, grinding as in a hammer mill or fluid-energy mill. Suspensions are usually prepared by wet-milling; see, for example, U.S. 3,060,084. Granules and pellets can be prepared by spraying the active material upon preformed granular carriers or by agglomeration techniques. See Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147-48, *Perry's Chemical*

WO 02/32856

PCT/US01/42632

87

Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 and following, and PCT Publication WO 91/13546. Pellets can be prepared as described in U.S. 4,172,714. Water-dispersible and water-soluble granules can be prepared as taught in U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 and DE 3,246,493. Tablets can be prepared as taught in U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 and U.S. 5,208,030. Films can be prepared as taught in GB 2,095,558 and U.S. 3,299,566.

For further information regarding the art of formulation, see T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. See also U.S. 3,235,361, Col. 6, line 16 through Col. 7, line 19 and Examples 10-41; U.S. 3,309,192, Col. 5, line 43 through Col. 7, line 62 and Examples 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162, 164, 166, 167 and 169-182; U.S. 2,891,855, Col. 3, line 66 through Col. 5, line 17 and Examples 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; and Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989.

In the following Examples, all percentages are by weight and all formulations are prepared in conventional ways. Compound numbers refer to compounds in Index Table A.

Example A20 Wettable Powder

Compound 1	65.0%
dodecylphenol polyethylene glycol ether	2.0%
sodium ligninsulfonate	4.0%
sodium silicoaluminate	6.0%
montmorillonite (calcined)	23.0%

Example BGranule

Compound 7	10.0%
attapulgite granules (low volatile matter, 0.71/0.30 mm, U.S.S. No. 25-50 sieves)	90.0%

Example CExtruded Pellet

Compound 1	25.0%
anhydrous sodium sulfate	10.0%
crude calcium ligninsulfonate	5.0%
sodium alkylnaphthalenesulfonate	1.0%
calcium/magnesium bentonite	59.0%

WO 02/32856

PCT/US01/42632

88

Example DEmulsifiable Concentrate

	Compound 7	20.0%
	blend of oil soluble sulfonates	
5	and polyoxyethylene ethers	10.0%
	isophorone	70.0%

Example EGranule

	Compound 1	0.5%
10	cellulose	2.5%
	lactose	4.0%
	cornmeal	93.0%

Compounds of this invention are characterized by favorable metabolic and/or soil residual patterns and exhibit activity controlling a spectrum of agronomic and non-agronomic invertebrate pests. (In the context of this disclosure "invertebrate pest control" means inhibition of invertebrate pest development (including mortality) that causes significant reduction in feeding or other injury or damage caused by the pest; related expressions are defined analogously.) As referred to in this disclosure, the term "invertebrate pest" includes arthropods, gastropods and nematodes of economic importance as pests. The term "arthropod" includes insects, mites, spiders, scorpions, centipedes, millipedes, pill bugs and symphylans. The term "gastropod" includes snails, slugs and other Stylommatophora. The term "nematode" includes all of the helminths, such as: roundworms, heartworms, and phytophagous nematodes (Nematoda), flukes (Trematoda), Acanthocephala, and tapeworms (Cestoda). Those skilled in the art will recognize that not all compounds are equally effective against all pests. Compounds of this invention display activity against economically important agronomic, forest, greenhouse, nursery, ornamentals, food and fiber, public and animal health, domestic and commercial structure, household, and stored product pests. These include larvae of the order Lepidoptera, such as armyworms, cutworms, loopers, and heliothines in the family Noctuidae (e.g., fall armyworm (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), beet armyworm (*Spodoptera exigua* Hübner), black cutworm (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), cabbage looper (*Trichoplusia ni* Hübner), tobacco budworm (*Heliothis virescens* Fabricius)); borers, casebearers, webworms, coneworms, cabbageworms and skeletonizers from the family Pyralidae (e.g., European corn borer (*Ostrinia nubilalis* Hübner), navel orangeworm (*Amorbia transitella* Walker), corn root webworm (*Crambus caliginosellus* Clemens), sod webworm (*Herpetogramma licarsialis* Walker)); leafrollers, budworms, seed worms, and fruit worms in the family Tortricidae (e.g., codling moth (*Cydia pomonella* Linnaeus), grape berry moth (*Endopiza*

WO 02/32856

PCT/US01/42632

89

- viteana* Clemens), oriental fruit moth (*Grapholitha molesta* Busek)); and many other economically important lepidoptera (e.g., diamondback moth (*Plutella xylostella* Linnaeus), pink bollworm (*Pectinophora gossypiella* Saunders), gypsy moth (*Lymantria dispar* Linnaeus)); nymphs and adults of the order Blattodea including cockroaches from the
- 5 families Blattellidae and Blattidae (e.g., oriental cockroach (*Blatta orientalis* Linnaeus), Asian cockroach (*Blattella ussuriensis* Mizukubo), German cockroach (*Blattella germanica* Linnaeus), brownbanded cockroach (*Supella longipalpa* Fabricius), American cockroach (*Periplaneta americana* Linnaeus), brown cockroach (*Periplaneta brunnea* Burmeister), Madeira cockroach (*Leucophaea maderae* Fabricius)); foliar feeding larvae and adults of the
- 10 order Coleoptera including weevils from the families Anthribidae, Bruchidae, and Curculionidae (e.g., boll weevil (*Anthonomus grandis* Boheman), rice water weevil (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), granary weevil (*Sitophilus granarius* Linnaeus), rice weevil (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)); flea beetles, cucumber beetles, rootworms, leaf beetles, potato beetles, and leafminers in the family Chrysomelidae (e.g., Colorado potato
- 15 beetle (*Leptinotarsa decemlineata* Say), western corn rootworm (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); chafers and other beetles from the family Scarabaeidae (e.g., Japanese beetle (*Popillia japonica* Newman) and European chafer (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); carpet beetles from the family Dermestidae; wireworms from the family Elateridae; bark beetles from the family Scolytidae and flour beetles from the family
- 20 Tenebrionidae. In addition it includes: adults and larvae of the order Dermaptera including earwigs from the family Forficulidae (e.g., European earwig (*Forficula auricularia* Linnaeus), black earwig (*Chelisoches morio* Fabricius)); adults and nymphs of the orders Hemiptera and Homoptera such as, plant bugs from the family Miridae, cicadas from the family Cicadidae, leafhoppers (e.g., *Empoasca* spp.) from the family Cicadellidae,
- 25 planthoppers from the families Fulgoridae and Delphacidae, treehoppers from the family Membracidae, psyllids from the family Psyllidae, whiteflies from the family Aleyrodidae, aphids from the family Aphididae, phylloxera from the family Phylloxeridae, mealybugs from the family Pseudococcidae, scales from the families Coccidae, Diaspididae and Margarodidae, lace bugs from the family Tingidae, stink bugs from the family Pentatomidae,
- 30 cinch bugs (e.g., *Blissus* spp.) and other seed bugs from the family Lygaeidae, spittlebugs from the family Cercopidae squash bugs from the family Coreidae, and red bugs and cotton stainers from the family Pyrrhocoridae. Also included are adults and larvae of the order Acari (mites) such as spider mites and red mites in the family Tetranychidae (e.g., European red mite (*Panonychus ulmi* Koch), two spotted spider mite (*Tetranychus urticae* Koch),
- 35 McDaniel mite (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)), flat mites in the family Tenuipalpidae (e.g., citrus flat mite (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), rust and bud mites in the family Eriophyidae and other foliar feeding mites and mites important in human and animal health, i.e. dust mites in the family Epidemnoptidae, follicle mites in the family Demodicidae, grain

WO 02/32856

PCT/US01/42632

96

- mites in the family Glycyphagidae; ticks in the order Ixodidae (e.g., deer tick (*Ixodes scapularis* Say), Australian paralysis tick (*Ixodes holocyclus* Neumann), American dog tick (*Dermacentor variabilis* Say), lone star tick (*Amblyomma americanum* Linnaeus) and scab and itch mites in the families Psoroptidae, Pyemotidae, and Sarcoptidae; adults and
- 5 immatures of the order Orthoptera including grasshoppers, locusts and crickets (e.g., migratory grasshoppers (e.g., *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), American grasshoppers (e.g., *Schistocerca americana* Drury), desert locust (*Schistocerca gregaria* Forskal), migratory locust (*Locusta migratoria* Linnaeus), house cricket (*Acheta domestica* Linnaeus), mole crickets (*Gryllotalpa* spp.)); adults and immatures of the order
- 10 Diptera including leafminers, midges, fruit flies (Tephritidae), frit flies (e.g., *Oscinella frit* Linnaeus), soil maggots, house flies (e.g., *Musca domestica* Linnaeus), lesser house flies (e.g., *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), stable flies (e.g., *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), face flies, horn flies, blow flies (e.g., *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), and other muscoid fly pests, horse flies (e.g., *Tabanus* spp.), bot flies (e.g., *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), cattle grubs (e.g., *Hypoderma* spp.), deer flies (e.g., *Chrysops* spp.), keds (e.g.,
- 15 *Malophagus ovinus* Linnaeus) and other Brachycera, mosquitoes (e.g., *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), black flies (e.g., *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), biting midges, sand flies, sciarids, and other Nematocera; adults and immatures of the order Thysanoptera including onion thrips (*Thrips tabaci* Lindeman) and other foliar feeding
- 20 thrips; insect pests of the order Hymenoptera including ants (e.g., red carpenter ant (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), black carpenter ant (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), Pharaoh ant (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), little fire ant (*Wasmannia auropunctata* Roger), fire ant (*Solenopsis geminata* Fabricius), red imported fire ant (*Solenopsis invicta* Buren), Argentine ant (*Iridomyrmex humilis* Mayr), crazy ant
- 25 (*Paratrechina longicornis* Latreille), pavement ant (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), cornfield ant (*Lasius alienus* Förster), odorous house ant (*Tapinoma sessile* Say)), bees (including carpenter bees), hornets, yellow jackets and wasps; insect pests of the order Isoptera including the eastern subterranean termite (*Reticulitermes flavipes* Kollar), western subterranean termite (*Reticulitermes hesperus* Banks), Formosan subterranean termite
- 30 (*Coptotermes formosanus* Shiraki), West Indian drywood termite (*Incisitermes immigrans* Snyder) and other termites of economic importance; insect pests of the order Thysanura such as silverfish (*Lepisma saccharinum* Linnaeus) and firebrat (*Therobia domestica* Packard); insect pests of the order Mallophaga and including the head louse (*Pediculus humanus capitis* De Geer), body louse (*Pediculus humanus humanus* Linnaeus), chicken body louse
- 35 (*Menacanthus stramineus* Nitsch), dog biting louse (*Trichodectes canis* De Geer), fluff louse (*Goniocotes gallinae* De Geer), sheep body louse (*Bovicola ovis* Schrank), short-nosed cattle louse (*Haematopinus eurysternus* Nitsch), long-nosed cattle louse (*Linognathus setosus* Linnaeus) and other sucking and chewing parasitic lice that attack man and animals; insect

WO 02/32856

PCT/US01/42632

91

pests of the order Siphonoptera including the oriental rat flea (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), cat flea (*Ctenocephalides felis* Bouche), dog flea (*Ctenocephalides canis* Curtis), hen flea (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), sticktight flea (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), human flea (*Pulex irritans* Linnaeus) and other fleas afflicting mammals and birds. Additional arthropod pests covered include: spiders in the order Araneae such as the brown recluse spider (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) and the black widow spider (*Latrodectus mactans* Fabricius), and centipedes in the order Scoligeromorpha such as the house centipede (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). Activity also includes members of the Classes Nematoda, Cestoda, Trematoda, and Acanthocephala including economically important members of the orders Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabdida, Spirurida, and Enoptida such as but not limited to economically important agricultural pests (i.e. root knot nematodes in the genus *Meloidogyne*, lesion nematodes in the genus *Pratylenchus*, stubby root nematodes in the genus *Trichodorus*, etc.) and animal and human health pests (i.e. all economically important flukes, tapeworms, and roundworms, such as *Strongylus vulgaris* in horses, *Toxocara canis* in dogs, *Haemonchus contortus* in sheep, *Diriofilaria immitis* Leidy in dogs, *Anoplocephala perfoliata* in horses, *Fasciola hepatica* Linnaeus in ruminants, etc.).

Compounds of the invention show particularly high activity against pests in the order Lepidoptera (e.g., *Alabama argillacea* Hübner (cotton leaf worm), *Archips argyrospila* Walker (fruit tree leaf roller), *A. rosana* Linnaeus (European leaf roller) and other *Archips* species, *Chilo suppressalis* Walker (rice stem borer), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (rice leaf roller), *Crambus caliginosellus* Clemens (corn root webworm), *Crambus laterellus* Zincken (bluegrass webworm), *Cydia pomonella* Linnaeus (codling moth), *Earias insulana* Boisduval (spiny bollworm), *Earias vittella* Fabricius (spotted bollworm), *Helicoverpa armigera* Hübner (American bollworm), *Helicoverpa zea* Boddie (corn earworm), *Heliothis virescens* Fabricius (tobacco budworm), *Herpetogramma licarsalis* Walker (sod webworm), *Lobesia botrana* Denis & Schiffmüller (grape berry moth), *Pactinophora gossypiella* Saunders (pink bollworm), *Phyllocnistis citrella* Stainton (citrus leafminer), *Pieris brassicae* Linnaeus (large white butterfly), *Pieris rapae* Linnaeus (small white butterfly), *Plutella xylostella* Linnaeus (diamondback moth), *Spodoptera exigua* Hübner (beet armyworm), *Spodoptera litura* Fabricius (tobacco cutworm, cluster caterpillar), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (fall armyworm), *Trichoplusia ni* Hübner (cabbage looper) and *Tuta absoluta* Meyrick (tomato leafminer)). Compounds of the invention also have commercially significant activity on members from the order Homoptera including: *Acyrtosiphon pisum* Harris (pea aphid), *Aphis crucivora* Koch (cowpea aphid), *Aphis fabae* Scopoli (black bean aphid), *Aphis gossypii* Glover (cotton aphid, melon aphid), *Aphis pomi* De Geer (apple aphid), *Aphis spiraeola* Patch (spiraea aphid), *Adactynothum solani* Kaltentbach (foxglove aphid), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockereil (strawberry aphid),

- Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (Russian wheat aphid), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (rosy apple aphid), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (woolly apple aphid), *Hyalopteris pruni* Geoffroy (mealy plum aphid), *Lipaphis erysimi* Kaltenebach (turnip aphid), *Metopolophium dirrhodum* Walker (cereal aphid), *Macrosipum euphorbiae* Thomas (potato aphid), *Myzus persicae* Sulzer (peach-potato aphid, green peach aphid), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (lettuce aphid), *Pemphigus* spp. (root aphids and gall aphids), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (corn leaf aphid), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (bird cherry-oat aphid), *Schizaphis graminum* Rondani (greenbug), *Sitobion avenae* Fabricius (English grain aphid), *Therioaphis maculata* Buckton (spotted alfalfa aphid), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (black citrus aphid), and *Toxoptera citricida* Kirkaldy (brown citrus aphid); *Adelges* spp. (adelgids); *Phylloxera devastatrix* Pergande (pecan phylloxera); *Bemisia tabaci* Gennadius (tobacco whitefly, sweetpotato whitefly), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (silverleaf whitefly), *Dialeurodes citri* Ashmead (citrus whitefly) and *Dialeurodes vaporariorum* Westwood (greenhouse whitefly); *Empoasca fabae* Harris (potato leafhopper), *Laodelphax striatellus* Fallen (smaller brown planthopper), *Macrostelus quadrilineatus* Forbes (aster leafhopper), *Nephotettix cincticeps* Uhler (green leafhopper), *Nephotettix nigropictus* Stål (rice leafhopper), *Nilaparvata lugens* Stål (brown planthopper), *Peregrinus maidis* Ashmead (corn planthopper), *Sogatella furcifera* Horvath (white-backed planthopper), *Sogatodes orizicola* Muir (rice delphacid), *Typhlocyba pomaria* McAtee white apple leafhopper, *Erythroneura* spp. (grape leafhoppers); *Magidada septendecim* Linnaeus (periodical cicada); *Icerya purchasi* Maskell (cottony cushion scale), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (San Jose scale); *Planococcus citri* Risso (citrus mealybug); *Pseudococcus* spp. (other mealybug complex); *Cacopsylla pyricola* Foerster (pear psylla), *Trioza diospyri* Ashmead (persimmon psylla). These compounds also have activity on members from the order Hemiptera including: *Acrosternum hilare* Say (green stink bug), *Anasa tristis* De Geer (squash bug), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (chinch bug), *Corythucha gossypii* Fabricius (cotton lace bug), *Cyrtopeltis modesta* Dislant (tomato bug), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (cotton slainer), *Euchistus servus* Say (brown stink bug), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (one-spotted stink bug), *Graptostethus* spp. (complex of seed bugs), *Leptoglossus corculis* Say (leaf-footed pine seed bug), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (tarnished plant bug), *Nezara viridula* Linnaeus (southern green stink bug), *Oebalus pugnax* Fabricius (rice stink bug), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (large milkweed bug), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (cotton fleahopper). Other insect orders controlled by compounds of the invention include Thysanoptera (e.g., *Frankliniella occidentalis* Pergande (western flower thrip), *Scirtothrips citri* Moulton (citrus thrip), *Sericothrips variabilis* Beach (soybean thrip), and *Thrips tabaci* Lindeman (onion thrip); and the order Coleoptera (e.g., *Leptinotarsa decemlineata* Say (Colorado potato beetle),

WO 02/32856

PCT/US01/42632

93

Epilachna varivestis Mulsant (Mexican bean beetle) and wireworms of the genera *Agriotes*, *Athous* or *Linomatus*).

Compounds of this invention can also be mixed with one or more other biologically active compounds or agents including insecticides, fungicides, nematocides, bactericides, acaricides, growth regulators such as rooting stimulants, chemosterilants, semiochemicals, repellents, attractants, pheromones, feeding stimulants, other biologically active compounds or entomopathogenic bacteria, virus or fungi to form a multi-component pesticide giving an even broader spectrum of agricultural utility. Thus compositions of the present invention can further comprise a biologically effective amount of at least one additional biologically active compound or agent. Examples of such biologically active compounds or agents with which compounds of this invention can be formulated are: insecticides such as abamectin, acephate, acetamiprid, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, bifenthrin, bifenazate, buprofezin, carbofuran, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chromafenozide, clothianidin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, diflubenzuron, dimethoate, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, fenothicarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenproximate, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flucythrinate, tau-fluvalinate, flufenoxuron, fonophos, halo fenozide, hexaflumuron, imidacloprid, indoxacarb, isofenphos, lufenuron, malathion, metaldelhyde, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, monocrotophos, methoxyfenozide, nithiazin, novaluron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, pymetrozine, pyridalyl, pyriproxyfen, rotenone, spinosad, sulprofos, tebufenozide, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosulfap-sodium, tralomeethrin, trichlorfon and triflumuron; fungicides such as acibenzolar, azoxystrobin, benomyl, blastocidin-S, Bordeaux mixture (tribasic copper sulfate), bromuconazole, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, chloroneb, chlorothalonil, copper oxychloride, copper salts, cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, (S)-3,5-dichloro-N-(3-chloro-1-ethyl-1-methyl-2-oxopropyl)-4-methylbenzamide (RH 7281), diclocymet (S-2900), diclomezine, dicloran, difenoconazole, (S)-3,5-dihydro-5-methyl-2-(methylthio)-5-phenyl-3-(phenylamino)-4H-imidazol-4-one (RP 407213), dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazole, diniconazole-M, dodine, edifenphos, epoxiconazole, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fenbuconazole, fenicaramid (SZX0722), fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin acetate, fentin hydroxide, fluzazinam, fludioxonil, flumetover (RPA 403397), fluquinconazole, flusilazole, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetyl-aluminum, furalaxyl, furametapyr (S-82658), hexaconazole, ipconazole, iprobenfos, iprodione, isoprothiolane, kasugamycin, kresoxim-methyl, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepronil, metalaxyl, metconazole, metominostrobil/fenominostrobil (SSF-126), myclobutanil, neo-asozin (ferrie methanearsonate),

WO 02/32856

PCT/US01/42632

94

oxarilxyl, penconazole, penicucuron, probenazole, prochloraz, propamocarb, propiconazole, pyrifenoxy, pyraclostrobin, pyrimethanil, pyroquilon, quinoxifen, spiroxamine, sulfur, tebuconazole, tetraconazole, thiabendazole, thiuram, thifluzamide, thiophanate-methyl, thiram, tiadinil, triadimefon, triadimenol, tricyclazole, trifloxystrobin, triticonazole, validamycin and vinclozolin; nematocides such as aldicarb, oxamyl and fenamiphos; bactericides such as streptomycin; acaricides such as amitraz, chlorobenzilate, cyhexatin, dicofol, dinoclor, etoxazole, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben and tebufenpyrad; and biological agents such as *Bacillus thuringiensis* including ssp. *aizawai* and *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin, baculovirus, and entomopathogenic bacteria, virus and fungi.

A general reference for these agricultural protectants is *The Pesticide Manual, 12th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2000.

Preferred insecticides and acaricides for mixing with compounds of this invention include pyrethroids such as cypermethrin, cyhalothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, esfenvalerate, fenvalerate and tralomethrin; carbamates such as fenothicarb, methomyl, oxamyl and thiocarb; neonicotinoids such as clothianidin, imidacloprid and thiacloprid; neuronal sodium channel blockers such as indoxacarb; insecticidal macrocyclic lactones such as spinosad, abamectin, avermectin and emamectin; γ -aminobutyric acid (GABA) antagonists such as endosulfan, ethiprole and fipronil; insecticidal ureas such as flufenoxuron and triflumuron; juvenile hormone mimics such as diofenolan and pyriproxyfen; pymetrozine; and amitraz. Preferred biological agents for mixing with compounds of this invention include *Bacillus thuringiensis* and *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin as well as naturally occurring and genetically modified viral insecticides including members of the family Baculoviridae as well as entomophagous fungi.

Most preferred mixtures include a mixture of a compound of this invention with cyhalothrin; a mixture of a compound of this invention with cyfluthrin; a mixture of a compound of this invention with beta-cyfluthrin; a mixture of a compound of this invention with esfenvalerate; a mixture of a compound of this invention with methomyl; a mixture of a compound of this invention with imidacloprid; a mixture of a compound of this invention with thiacloprid; a mixture of a compound of this invention with indoxacarb; a mixture of a compound of this invention with abamectin; a mixture of a compound of this invention with endosulfan; a mixture of a compound of this invention with ethiprole; a mixture of a compound of this invention with fipronil; a mixture of a compound of this invention with flufenoxuron; a mixture of a compound of this invention with pyriproxyfen; a mixture of a compound of this invention with pymetrozine; a mixture of a compound of this invention with amitraz; a mixture of a compound of this invention with *Bacillus thuringiensis* and a mixture of a compound of this invention with *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin.

WO 02/32856

PCT/US01/42632

95

In certain instances, combinations with other invertebrate pest control compounds or agents having a similar spectrum of control but a different mode of action will be particularly advantageous for resistance management. Thus, compositions of the present invention can further comprise an biologically effective amount of at least one additional invertebrate pest control compounds or agents having a similar spectrum of control but a different mode of action. Contacting a plant genetically modified to express a plant protection compound (e.g., protein) or the locus of the plant with a biologically effective amount of a compound of invention can also provide a broader spectrum of plant protection and be advantageous for resistance management.

Invertebrate pests are controlled and protection of agronomic, horticultural and specialty crops, animal and human health is achieved by applying one or more of the compounds of this invention, in an effective amount, to the environment of the pests including the agronomic and/or nonagronomic locus of infestation, to the area to be protected, or directly on the pests to be controlled. Thus, the present invention further comprises a method for the control of foliar- and soil-inhabiting invertebrates and protection of agronomic and/or nonagronomic crops, comprising contacting the invertebrates or their environment with a biologically effective amount of one or more of the compounds of the invention, or with a composition comprising at least one such compound or a composition comprising at least one such compound and an effective amount of at least one additional biologically active compound or agent. A preferred method of contact is by spraying. Alternatively, a granular composition comprising a compound of the invention can be applied to the plant foliage or the soil. Compounds of this invention are effective in delivery through plant uptake by contacting the plant with a composition comprising a compound of this invention applied as a soil drench of a liquid formulation, a granular formulation to the soil, a nursery box treatment or a dip of transplants. Other methods of contact include application of a compound or a composition of the invention by direct and residual sprays, aerial sprays, seed coats, microencapsulations, systemic uptake, baits, ear tags, boluses, foggers, fumigants, aerosols, dusts and many others.

The compounds of this invention can be incorporated into baits that are consumed by the invertebrates or within devices such as traps and the like. Granules or baits comprising between 0.01–5% active ingredient, 0.05–10% moisture retaining agent(s) and 40–99% vegetable flour are effective in controlling soil insects at very low application rates, particularly at doses of active ingredient that are lethal by ingestion rather than by direct contact.

The compounds of this invention can be applied in their pure state, but most often application will be of a formulation comprising one or more compounds with suitable carriers, diluents, and surfactants and possibly in combination with a food depending on the contemplated end use. A preferred method of application involves spraying a water

WO 02/32856

PCT/US01/42632

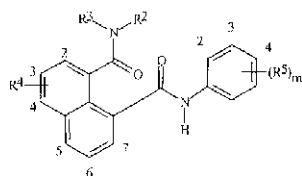
96

dispersion or refined oil solution of the compounds. Combinations with spray oils, spray oil concentrations, spreader stickers, adjuvants, other solvents, and synergists such as piperonyl butoxide often enhance compound efficacy.

The rate of application required for effective control (i.e. "biologically effective amount") will depend on such factors as the species of invertebrate to be controlled, the pest's life cycle, life stage, its size, location, time of year, host crop or animal, feeding behavior, mating behavior, ambient moisture, temperature, and the like. Under normal circumstances, application rates of about 0.01 to 2 kg of active ingredient per hectare are sufficient to control pests in agronomic ecosystems, but as little as 0.0001 kg/hectare may be sufficient or as much as 8 kg/hectare may be required. For nonagronomic applications, effective use rates will range from about 1.0 to 50 mg/square meter but as little as 0.1 mg/square meter may be sufficient or as much as 150 mg/square meter may be required. One skilled in the art can easily determine the biologically effective amount necessary for the desired level of invertebrate pest control.

The following Tests in the Biological Examples of the Invention demonstrate the control efficacy of compounds of this invention on specific pests. "Control efficacy" represents inhibition of arthropod development (including mortality) that causes significantly reduced feeding. The pest control protection afforded by the compounds is not limited, however, to these species. See Index Tables A-E for compound descriptions. The following abbreviations are used in the Index Tables that follow: *t* is tertiary, *n* is normal, *i* is iso, *s* is secondary, Me is methyl, Et is ethyl, Pr is propyl and Bu is butyl; accordingly *i*-Pr is isopropyl, *s*-Bu is secondary butyl, etc. Ac is COCH₃. The abbreviation "Ex." stands for "Example" and is followed by a number indicating in which example the compound is prepared.

INDEX TABLE A



25

Compound	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	m.p. °C
1 (Ex. 1)	Me	H	H	2	2-Me-4-F	249
2	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-Cl	>250
3	<i>n</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-Cl	212

WO 02/32856

PCT/US01/42632

97

4	i-Bu	H	H	2	2-Me-4-Cl	***
5	Me	Me	H	2	2-Me-4-Cl	***
6	Et	H	H	2	2-Me-4-Cl	***
7	Me	H	H	2	2-Me-4-Cl	244
8	allyl	H	H	2	2,4-di-Me	243
9	cyclo-Pr	H	H	2	2-Me-4-Cl	246
10	H	H	H	2	2-Me-4-Cl	***
11	Me	H	H	2	2-Me-4-OCF ₃	>250
12	Me	H	H	1	4-OCF ₃	>250
13	Me	H	H	2	2,4-di-Cl	>250
14	Me	H	H	2	2-Me-5-Cl	241
15	Me	H	H	2	2-Me-3-Cl	>250
16	Me	H	H	1	2-Me	236
17	Me	H	H	2	2-Me-4-Br	234
18	Me	H	H	1	4- <i>i</i> -Pr	>250
19	Me	H	H	1	4-NHAc	224
20	Me	H	H	1	2-Br	210
21	Me	H	H	1	2-OPh	193
22	Me	H	H	1	4-OMe	188
23	Me	H	H	1	4-(morpholin-4-yl)	246
24	Me	H	H	1	2-F	177
25	Me	H	H	1	4-I	235
26	Me	H	H	2	2-Me-4-NO ₂	242
27	Me	H	H	1	3-CF ₃	235
28	Me	H	H	1	3-I	216
29	Me	H	H	2	2-Me-4-OMe	205
30	Me	H	H	1	3-Br	230
31	Me	H	H	1	4-Ac	226
32	Me	H	H	1	4-Br	220
33	Me	H	H	1	4-CN	216
34	Me	H	H	1	3-NO ₂	242
35	Me	H	H	1	4-Cl	197
36	Me	H	H	1	3-CH ₃	220
37	Me	H	H	1	3-Cl	209
38	Me	H	H	2	2,5-di-Me	204
39	Me	H	H	2	2-Me-6-OMe	223
40	Me	H	H	2	2,3-di-Me	187
41	Me	H	H	1	2-OMe	192

WO 02/32856

PCT/US01/42632

98

42	Me	H	H	1	4-CO ₂ Et	202
43	Me	H	H	1	4-NMeAc	210
44	Me	H	H	2	2,6-di-Me	~250
45	Me	H	H	1	2 (pyrrol-1-yl)	208
46	Me	H	H	1	4-NO ₂	224
47	Me	H	H	1	3-OCCH ₂ Ph	214
48	Me	H	H	2	2,4-di-Me	213
49	Me	H	H	1	3-CN	200
50	Me	H	H	1	3-OCF ₃	>250
51	Me	H	H	2	2-Me-3-NO ₂	233
52	Me	H	H	1	2-OEt	224
53	Me	H	H	1	4-(4-ClPhO)	224
54	Me	H	H	1	4-CH ₃	248
55	Me	H	H	1	4-O- <i>i</i> -Pr	183
56	Me	H	H	1	4-F	247
57	Me	H	H	1	2-SMe	204
58	Me	H	H	1	2- <i>i</i> -Bu	248
59	Me	H	H	1	3-SMe	213
60	Me	H	H	1	4-OEt	195
61	Me	H	H	1	2-CH ₂ CN	191
62	Me	H	H	1	2-Et	200
63	<i>i</i> -Pr	H	4-NO ₂ / 5-NO ₂	2	2-Me-4-Cl	***
(1/1 mixture)						
64	Me	H	4-Br/ 5-Br	2	2-Me-4-Cl	***
(1/1 mixture)						
65	Me	H	H	1	2-CONH(<i>i</i> -Pr)-6-Me	248
66*	Me	H	H	2	2-Me-4-Cl	***
67*	Me	H	H	2	2-Me-4-OCF ₃	***
68	Me	H	H	2	2-Me-5-NO ₂	242
69	Me	H	H	2	2-Me-4-CF ₃	250
70	Me	H	H	1	4-CF ₃	246
71	Me	H	H	1	2-Ph	163
72	Me	H	H	2	2-(1-Me-4-chazol-5-yl)-6-Me	202
73	Me	H	H	1	3-CONHMe	235
74	Me	H	H	2	2-Me-6-Cl	231
75	Me	H	H	2	3-NO ₂ -4-Me	233

WO 02/32856

PCT/US01/42632

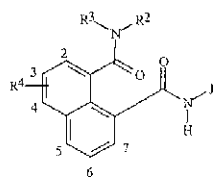
99

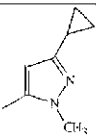
76	Me	H	H	3	2-F-4-Cl-5-NO ₂	250
77	Me	H	H	2	2-Br-4-Me	198
78	Me	H	H	3	2-Br-4,6-di-F	197
79	Me	H	H	2	2,5-di-NO ₂	223
80	Me	H	H	2	2-F-4-Cl	250
81	Me	H	H	2	2-Me-3-F	242
82	Me	H	H	2	2-Br-4-F	126.5
83	Me	H	H	1	2-(morpholin-4-yl)	193
84	Me	H	H	2	3-NO ₂ -4-F	248
85	Me	H	H	2	3,4-di-F	110
86	Me	H	H	2	2-Cl-4-F	250
87	Me	H	H	1	2-CF ₃	217
88	Me	H	H	2	2-CN-4-Cl	250
89	Me	H	H	1	2-Ac	237
90	Me	H	H	1	2-OCF ₃	209
91	Me	H	H	1	2-SCF ₃	211
92	Me	H	H	2	2-CF ₃ -4-Br	250

* This sample contained 25% by weight of 1,8-naphthalene-anhydride.

*** See Index Table E for NMR data.

INDEX TABLE B

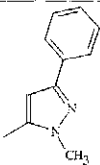
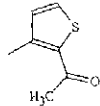
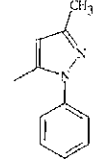
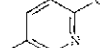


Compound	R ²	R ³	R ⁴	J	m.p., °C
93	Me	H	H		199

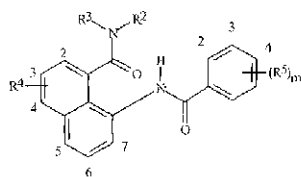
WO 02/32856

PCT/US01/42632

100

Compound	R ²	R ³	R ⁴	J	m.p., °C
94	Me	H	H		175
95	Me	H	H		126.5
96	Me	H	H		217
97	Me	H	H		171

INDEX TABLE C



Compound	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	m.p., °C
98 (Ex. 2)	<i>i</i> -Pr	H	H	2	3,4-di-F	227
99	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2,3-di-Me	242
100	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2,6-di-F	204
101	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-OCF ₃	186
102	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-Cl	218
103	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-Br	206

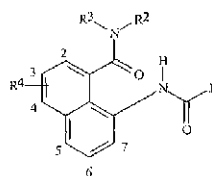
WO 02/32856

PCT/US01/42632

101

104	<i>i</i> -Pr	H	H	1	4-CF ₃	165
105	Me	H	H	2	3,4-di-F	250
106	Me	H	H	2	2,3-di-Me	184.5
107	Me	H	H	2	2,4 di-F	207
108	Me	H	H	1	4-Cl	250
109	Me	H	H	1	4-Et	250
110	Me	H	H	1	4-CF ₃	208
111	Me	H	H	1	4-OCF ₃	144
112	Me	H	H	1	2-Me	173.5
113	<i>i</i> -Pr	H	H	1	2-Me	176.5
114	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-O-CF ₃	173.5
115	<i>i</i> -Pr	H	H	2	2-Me-4-CF ₃	191.5
116	Me	H	H	2	2-Me-4-OCF ₃	173.5
117	Me	H	H	2	2-Me-4-CF ₃	204.5

Index Table D.

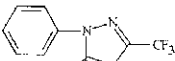
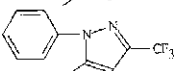


Compound	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	J	m.p. °C
118	<i>i</i> -Pr	H	H	H	1-naphthyl	210
119	<i>i</i> -Pr	H	H	H	2-thienyl	208
120 (Ex. 3)	Me	H	H	H	2-thienyl	215
121	Me	H	H	H	1-naphthyl	214
121	<i>i</i> -Pr	H	H	H		210
123	Me	H	H	H		210

WO 02/32856

PCT/US01/42632

102

124	Me	H	H		215.5
125	i-Pr	H	H		186

INDEX TABLE

Compd No.	¹ H NMR Data (CDCl ₃ solution unless indicated otherwise) ^a
4	(DMSO-d ₆) δ: 0.9 (m, 6H), 2.37 (s, 3H), 3.01 (m, 1H), 3.96 (d, 2H), 7.27-8.48 (m, 10H), 9.84 (br s, 1H).
5	(DMSO-d ₆) δ: 2.36 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.94 (s, 3H), 7.28-8.08 (m, 10H), 9.99 (s, 1H).
6	(DMSO-d ₆) δ: 1.07 (t, 3H), 2.37 (s, 3H), 3.22 (m, 2H), 7.30-8.06 (m, 9H), 8.40 (t, 1H), 9.86 (s, 1H).
10	(DMSO-d ₆) δ: 2.36 (s, 3H), 7.25-8.03 (m, 11H), 9.88 (s, 1H).
63	(DMSO-d ₆) δ: 1.09 (d, 6H), 2.36 (s, 3H), 4.03 (m, 1H), 7.27-8.52 (m, 9H), 10.04 (s, 1H).
64	(DMSO-d ₆) δ: 2.36 (s, 3H), 2.69 (d, 3H), 7.33-8.84 (m, 8H), 8.45 (br q, 1H), 9.98 (s, 1H).
66	(DMSO-d ₆) δ: 2.37 (s, 3H), 2.71 (d, 3H), 7.27-8.10 (m, 9H), 8.34 (br q, 1H), 9.88 (s, 1H).
67	(DMSO-d ₆) δ: 2.41 (s, 3H), 2.72 (d, 3H), 7.26-8.08 (m, 9H), 8.36 (br q, 1H), 9.95 (s, 1H).

^a ¹H NMR data are in ppm downfield from tetramethylsilane. Couplings are designated by (s)-singlet, (d)-doublet, (t)-triplet, (q)-quartet, (m)-multiplet, (dd)-doublet of doublets, (dt)-doublet of triplets, (br s)-broad singlet, (br q)-broad quartet.

BIOLOGICAL EXAMPLES OF THE INVENTION

TEST A

For evaluating control of fall armyworm (*Spodoptera frugiperda*) the test unit consisted of a small open container with a 4-5-day-old corn (maize) plant inside. This was pre-infested with 10-15 1-day-old larvae on a piece of insect diet by use of a core sampler to remove a plug from a sheet of hardened insect diet having many larvae growing on it and transfer the plug containing larvae and diet to the test unit. The larvae moved onto the test plant as the diet plug dried out.

- Test compounds were formulated using a solution containing 10% acetone, 90% water and 300 ppm X-77® Spreader Lo-Foam Formula non-ionic surfactant containing alkylarylpolyoxyethylene, free fatty acids, glycols and isopropanol (Loveland Industries, Inc.), unless otherwise indicated. The formulated compounds were applied in 1 mL of liquid through a SUJ2 atomizer nozzle with 1/8 JJ custom body (Spraying Systems Co.) positioned 1.27 cm (0.5 inches) above the top of each test unit. All experimental compounds in this screen were sprayed at 250 ppm and replicated three times. After spraying of the formulated test compound, each test unit was allowed to dry for 1 hour and then a black, screened cap

WO 02/32856

PCT/US01/42632

103

was placed on top. The test units were held for 6 days in a growth chamber at 25 °C and 70% relative humidity. Plant feeding damage was then visually assessed.

Of the compounds tested, the following provided excellent levels of plant protection (10% or less feeding damage): 1, 7, 11, 16, 48, 66 and 67.

5

TEST B

For evaluating control of tobacco budworm (*Heliothis virescens*) the test unit consisted of a small open container with a 6–7 day old cotton plant inside. This was pre-infested with 8 2-day-old larvae on a piece of insect diet by use of a core sampler as described for Test A.

10

Test compounds were formulated and sprayed at 250 ppm as described for Test A. The applications were replicated three times. After spraying, the test units were maintained in a growth chamber and then visually rated as described for Test A.

Of the compounds tested, the following provided excellent levels of plant protection (10% or less feeding damage): 1, 7 and 16.

15

TEST C

For evaluating control of diamondback moth (*Plutella xylostella*) the test unit consisted of a small open container with a 12–14-day-old radish plant inside. This was pre-infested with 10–15 neonate larvae on a piece of insect diet by use of a core sampler as described for Test A.

20

Test compounds were formulated and sprayed at 250 ppm as described for Test A. The applications were replicated three times. After spraying, the test units were maintained in a growth chamber and then visually rated as described for Test A.

Of the compounds tested, the following provided excellent levels of plant protection (10% or less feeding damage): 1, 7, 11, 12, 14, 16, 20, 24, 37, 48, 51, 54, 55, 56, 61, 66, 67, 69, 70, 72, 75, 81, 85, 86, 89, 90, 91, 93 and 97.

25

TEST D

For evaluating control of beet armyworm (*Spodoptera exigua*) the test unit consisted of a small open container with a 4–5-day-old corn plant inside. This was pre-infested with 10–15 1-day-old larvae on a piece of insect diet by use of a core sampler as described for

30

Test A.

Test compounds were formulated and sprayed at 250 ppm as described for Test A. The applications were replicated three times. After spraying, the test units were maintained in a growth chamber and then visually rated as described for Test A.

Of the compounds tested, the following provided excellent levels of plant protection (10% or less feeding damage): 1, 40 and 54.

35

WO 02/32856

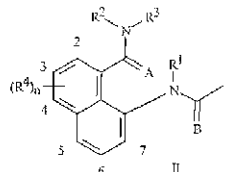
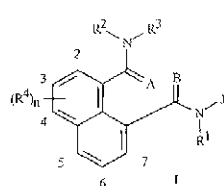
104

PCT/US01/42632

CLAIMS

What is claimed is:

I. A compound selected from Formula I or Formula II, and *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof.



wherein

each J is independently a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is optionally substituted with 1 to 5 R^5 ;

A and B are independently O or S;

n is 0 to 4;

R^1 is H; or C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl or C_3 - C_6 cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO_2 , hydroxy, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, C_1 - C_4 alkylsulfinyl, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, C_2 - C_4 alkoxy carbonyl, C_1 - C_4 alkylamino, C_2 - C_6 dialkylamino and C_3 - C_6 cycloalkylamino; or

R^1 is C_2 - C_6 alkyl carbonyl, C_2 - C_6 alkoxy carbonyl, C_2 - C_6 alkylaminocarbonyl or C_3 - C_6 dialkylaminocarbonyl;

R^2 is H, C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 alkylamino, C_2 - C_6 dialkylamino, C_3 - C_6 cycloalkylamino, C_2 - C_6 alkoxy carbonyl or C_2 - C_6 alkyl carbonyl;

R^3 is H; or C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl or C_3 - C_6 cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO_2 , hydroxy, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, C_1 - C_4 alkylsulfinyl and C_1 - C_4 alkylsulfonyl; or

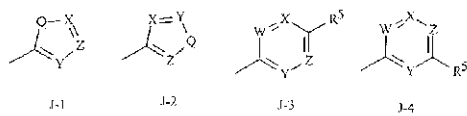
R^2 and R^3 can be taken together with the nitrogen to which they are attached to form a ring containing 2 to 6 atoms of carbon and optionally one additional atom of nitrogen, sulfur or oxygen, said ring may be optionally substituted with 1 to 4 substituents selected from the group consisting of C_1 - C_2 alkyl, halogen, CN, NO_2 and C_1 - C_2 alkoxy; and

- each R^4 and each R^5 is independently H, C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 alkynyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_2 - C_6 haloalkenyl, C_2 - C_6 haloalkynyl, C_3 - C_6 halocycloalkyl, halogen, CN, CO_2H , $CONH_2$, NO_2 , hydroxy, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, C_1 - C_4 alkylsulfinyl, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, C_1 - C_4 haloalkylthio, C_1 - C_4 haloalkylsulfinyl, C_1 - C_4 haloalkylsulfonyl, C_2 - C_4 alkoxy-carbonyl, C_1 - C_4 alkylamino, C_2 - C_8 dialkylamino, C_3 - C_6 cycloalkylamino, C_2 - C_6 alkylcarbonyl, C_2 - C_6 alkoxy-carbonyl, C_2 - C_6 alkylaminocarbonyl, C_3 - C_8 dialkylaminocarbonyl, or C_3 - C_6 trialkylsilyl; or
- each R^4 and each R^5 is independently a phenyl, benzyl, phenoxy, 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system, each ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from the group consisting of C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_2 - C_4 haloalkenyl, C_2 - C_4 haloalkynyl, C_3 - C_6 halocycloalkyl, halogen, CN, NO_2 , C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, C_1 - C_4 alkylsulfinyl, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, C_1 - C_4 alkylamino, C_2 - C_8 dialkylamino, C_3 - C_6 cycloalkylamino, C_3 - C_6 (alkyl)cycloalkylamino, C_2 - C_4 alkylcarbonyl, C_2 - C_6 alkoxy-carbonyl, C_2 - C_6 alkylaminocarbonyl, C_3 - C_8 dialkylaminocarbonyl or C_3 - C_6 trialkylsilyl; or
- (R^5)₂ when attached to adjacent carbon atoms can be taken together as $-OCF_2O-$, $-CF_2CF_2O-$ or $-OCF_2CF_2O-$.
2. The compound of Formula I of Claim 1 wherein
A and B are both O;
 R^1 is H, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, C_2 - C_6 alkylcarbonyl or C_2 - C_6 alkoxy-carbonyl; and
n is 0 to 2.
3. The compound of Formula II of Claim 1 wherein
A and B are both O;
 R^1 is H, C_1 - C_4 alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, C_2 - C_6 alkylcarbonyl or C_2 - C_6 alkoxy-carbonyl; and
n is 0 to 2.
4. The compound of Claim 2 or Claim 3 wherein
J is a phenyl ring or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring selected from the group consisting of J-1, J-2, J-3 and J-4, each J ring optionally substituted with 1 to 3 R^5

WO 02/32856

PCT/US01/42632

106

Q is O, S or NR⁵;W, X, Y and Z are independently N or CR⁵, provided that in J-3 and J-4 at least one of W, X, Y or Z is N;

- 5 R² is H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl or C₂-C₆ alkoxy carbonyl;
- R³ is C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₂ alkylthio, C₁-C₂ alkylsulfinyl and C₁-C₂ alkylsulfonyl;
- 10 one R⁴ group is attached to the naphthyl ring system at the 2-position or 7-position, and said R⁴ is C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl or C₁-C₄ haloalkylsulfonyl;
- 15 each R⁵ is independently H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl or C₂-C₄ alkoxy carbonyl, C₃-C₆ dialkylaminocarbonyl; or
- 20 each R⁵ is independently a phenyl, benzyl or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C₂-C₄ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₆ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₁-C₆ (alkyl)cycloalkylamino, C₂-C₄ alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₆ dialkylaminocarbonyl or C₃-C₆ trialkylsilyl; or
- 25 (R⁵)₂ when attached to adjacent carbon atoms can be taken together as -OCF₂O-, -CF₂CF₂O- or -OCF₂CF₂O-; and
- n is 1 to 2.
- 30 5. The compound of Formula I of Claim 4 wherein R² is H; R³ is C₁-C₄ alkyl; and at least one of the R⁵ substituents is *ortho* to the NR³C(=B) moiety.
6. The compound of Claim 5 wherein R³ is methyl.
7. The compound of Formula II of Claim 4 wherein R¹ is H or C₁-C₄ alkyl;

WO 02/32856

PCT/US01/42632

107

R² is H or C₁-C₄ alkyl;

R³ is C₁-C₄ alkyl optionally substituted with halogen, CN, OCH₃, or S(O)₂CF₃;

one R⁵ group is attached to the J at the position *ortho* to the C(=B)NR¹ moiety, and

5 said R⁵ is C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl or C₂-C₄ alkoxy carbonyl; C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl or a phenyl, benzyl, or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ haloalkoxy;

10 and a second optional R⁵ group is independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl or C₂-C₄ alkoxy carbonyl; C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl or a phenyl, benzyl, or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ haloalkoxy.

7. The compound of Claim 6 wherein J is phenyl, pyrazole, pyrrole, pyridine or pyrimidine, each substituted with one R⁵ attached to the J at the position *ortho* to the C(=B)NR¹ moiety and a second optional R⁵.

8. The compound of Claim 7 wherein

R¹ and R³ are each H;

25 one R⁴ is attached at the 7-position *ortho* to the NR¹C(=X)J moiety and is selected from the group consisting of C₁-C₃ alkyl, CF₃, OCF₃, OCHF₂, S(O)₂CF₃, S(O)₂CHF₂ and halogen and an optional second R⁴ is attached at the 5-position *para* to the NR¹C(=X)J moiety and is selected from the group consisting of halogen, C₁-C₃ alkyl and C₁-C₃ haloalkyl.

9. The compound of Claim 8 wherein

30 J is J-1;

Q is NR^{5a};

X is N or CH;

Y is CH;

Z is CR^{5b};

35 R^{5a} is a phenyl or 2-pyridyl ring substituted with one or two substituents selected from the group consisting of halogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl or C₁-C₄ haloalkoxy; and

R^{5b} is halogen or CF₃.

WO 02/32856

PCT/US01/42632

108

10. The compound of Claim 1 selected from the group consisting of
N-methyl -*N'*-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,8-naphthalene-dicarboxamide,
N-methyl 8-[(3,4-difluorophenyl)carbonylamino]-1-naphthalenecarboxamide and
N-methyl 8-[(2-thienyl)carbonylamino]-1-naphthalenecarboxamide.
- 5 11. A composition for controlling an invertebrate pest comprising a biologically effective amount of a compound of Claim 1 and at least one of a surfactant, a solid diluent or a liquid diluent.
12. The composition of Claim 11 further comprising an effective amount of at least one additional biologically active compound or agent.
- 10 13. The composition of Claim 12 wherein at least one additional biologically active compound or agent is selected from arthropodocides of the group consisting of pyrethroids, carbamates, neonicotinoids, neuronal sodium channel blockers, insecticidal macrocyclic lactones, γ -aminobutyric acid (GABA) antagonists, insecticidal ureas and juvenile hormone mimics.
- 15 14. The composition of Claim 12 wherein at least one additional biologically active compound or agent is selected from insecticide, nematocide, acaricide or biological agents in the group consisting of abamectin, acephate, acetamiprid, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, bifenthrin, binfenazate, buprofezin, carbofuran, chlorfenapyr, chlorflazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chromafenozide, clothianidin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, diflubenzuron, dimethoate, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, fenothicarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenproximate, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flucythrinate, tau-fluvalinate, flufenoxuron, fonophos, halofenozide, hexaflumuron, imidacloprid, indoxacarb, isofenphos, lufenuron, malathion, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, monocrotophos, 25 methoxyfenozide, nithiazin, novaluron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, pymetrozine, pyridalyl, pyriproxyfen, rotenone, spinosad, sulprofos, tebufenozide, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosulap-sodium, tralomeethrin, trichlorfon and triflumuron, aldicarb, oxamyl, fenamiphos, amitraz, chinomethionat, chlorobenzilate, cyhexatin, dicofol, dinoclor, etoxazole, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenpropathrin, fenpyroximate, hexylthiazox, propargite, pyridaben, rebufenpyrad, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin, baculovirus, and entomopathogenic bacteria, virus and fungi.
- 30 15. The composition of Claim 14 wherein at least one additional biologically active compound or agent is selected from the group consisting of cypermethrin, cyhalothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, esfenvalerate, fenvalerate, tralomeethrin, fenothicarb, methomyl, oxamyl, thiodicarb, clothianidin, imidacloprid, thiacloprid, indoxacarb, spinosad, abamectin.

WO 02/32856

PCT/US01/42632

109

avermectin, emamectin, endosulfan, ethiprole, fipronil, flufenoxuron, triflumuron, difenolan, pyriproxyfen, pymetrozine, amitraz, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin and entomophagous fungi.

16. A method for controlling an invertebrate pest comprising contacting the
5 invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a compound of Claim 1 or a composition of Claim 11.

【国際公開パンフレット（コレクトバージョン）】

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
25 April 2002 (25.04.2002)

PCT

(10) International Publication Number
WO 02/032856 A3(51) International Patent Classification: C07C 235/84,
237/58, C07D 333/38, 231/10, 231/14, 233/90, 213/75,
A01N 57/18, 43/00

(21) International Application Number: PCT/US01/42632

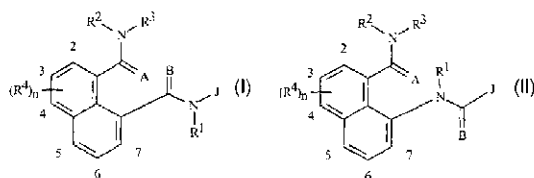
(22) International Filing Date: 11 October 2001 (11.10.2001)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/240,890 17 October 2000 (17.10.2000) US
Not furnished 21 September 2001 (21.09.2001) US(71) Applicant (for all designated States except US): E. I. DU
PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US/US); 1007
Market Street, Wilmington, DE 19898 (US).(72) Inventors; and
(75) Inventors/Applicants (for US only): SEIBY, Thomas,
Paul (US/US); 116 Hunter Court, Wilmington, DE 19808
(US), SUN, King Mo (US/US); 22 Pine Grove Lane,
Hockessin, DE 19707 (US).(74) Agent: BIRCH, Linda, D.; E. I. Du Pont De Nemours
and Company, Legal Patent Records Center, 1007 Market
Street, Wilmington, DE 19898 (US).(81) Designated States (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GR, GU,
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,
MX, ME, NO, NZ, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI,
SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU,
ZA, ZW.(83) Designated States (regional): ARIPO patent (GH, GM,
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian
patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European
patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE,
IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF,
CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, NG, SN, TD,
TG).Published:
with international search report
— before the expiration of the time limit for amending the
claims and to be republished in the event of receipt of
amendments(88) Date of publication of the international search report:
4 July 2002For pre-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guide-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette

(54) Title: INSECTICIDAL 1,8-NAPHTHALENEDICARBOXAMIDES

(57) Abstract: Compounds of Formula I and Formula II, and their N-oxides and agriculturally suitable salts, are disclosed that are useful for controlling invertebrate pests. Formula (I), Formula (II) wherein A, B, J, R¹, R², R³, R⁴, and n are as defined in the disclosure. Also disclosed are compositions comprising the compounds of Formula I or Formula II and methods for controlling invertebrate pests that involve contacting the invertebrate pests or their environment with an effective amount of a compound of Formula (I) or Formula (II).

WO 02/032856 A3

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International Application No. PCT/US 01/42632
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 C07C235/84 C07C237/48 C07D333/38 C07D231/40 C07D231/14 C07D233/90 C07D213/75 A01N37/18 A01N43/00		
A. according to International Patent Classification (IPC) and, where appropriate, national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 C07C C07D A01N		
Documentation searched on or after the minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) CHEM ABS Data, EPO-Internal		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Origin of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	E. V. GANIN ET AL.: "N-substituted isonaphthalimides" J. ORG. CHEM. USSR (ENGL. TRANSL.), vol. 21, no. 11, 1985, pages 2209-2215, XP001073615 page 2215; table 3	1-3
A	EP 0 919 542 A (NIHON NOHYAKU CO LTD) 2 June 1999 (1999-06-02) cited in the application abstract; claims 4,5,9-11	1,16
A	EP 0 346 841 A (CIBA GEIGY AG) 20 December 1989 (1989-12-20) claims 1,13-18	1,16
☐ Further documents are listed in the continuation of box C. ☒ Patent family members are listed in annex		
Special categories of cited documents *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *L* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claims or which is cited to establish the publication date of another invention or other special feature (as specified) *O* document relevant to oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the practice or theory underlying the invention *X* document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is considered with one or more other such documents, such determination being obvious to a person skilled in the art *Z* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
30 April 2002		10/05/2002
Name and mailing address of the ISA: European Patent Office, P.O. Box 5161 Paternoster 2 NL - 2500 HV Rijswijk Tel (+31) 70 340 2040, Tx 31 601 epo nl Fax (+31) 70 340 2016		Authorized officer Rufet, J

Form PCT/ISA/210 - second annex (July 1992)

International Application No. PCT/US 01 A2632

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/AS/ 210

Continuation of Box 1.2

Claims Nos.: 1-16 all partially

Present claims 1-16 relate to an extremely large number of possible compounds, compositions and uses thereof. Support within the meaning of Article 6 PCT and/or disclosure within the meaning of Article 5 PCT is to be found, however, for only a very small proportion of the compounds claimed. In the present case, the claims so lack support, and the application so lacks disclosure, that a meaningful search over the whole of the claimed scope is impossible. Consequently, the search has been carried out for those parts of the claims which appear to be supported and disclosed, namely those parts relating to the compounds according to formulae (I) and (II) of claim 1, wherein:

- one of the substituent R2 or R3 is always hydrogen
- R1 is hydrogen
- J is independently a phenyl or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring selected from the group consisting of J-1, J-2, J-3 or J-4 as defined in claim 4

It is stressed that the "two claim 7" (wrong numbering) have been searched according to the abovementioned limitation.

The applicant's attention is drawn to the fact that claims, or parts of claims, relating to inventions in respect of which no international search report has been established need not be the subject of an international preliminary examination (Rule 66.1(e) PCT). The applicant is advised that the EPO policy when acting as an International Preliminary Examining Authority is normally not to carry out a preliminary examination on matter which has not been searched. This is the case irrespective of whether or not the claims are amended following receipt of the search report or during any Chapter II procedure.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.

PCT/US 01/42632

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0919542 A	02-06-1999	AU 712421 B2	04-11-1999
		AU 9329298 A	24-06-1999
		BR 9805060 A	21-03-2000
		CN 1222506 A ,B	14-07-1999
		CZ 9803799 A3	16-06-1999
		EP 0919542 A2	02-06-1999
		HU 9802725 A2	30-08-1999
		JP 11243857 A	07-09-1999
		PL 329898 A1	07-06-1999
		TR 9802377 A2	21-07-1999
		US 2001041814 A1	15-11-2001
		ZA 9810677 A	26-05-1999
EP 0346841 A	20-12-1989	AU 3642589 A	21-12-1989
		BR 8902915 A	01-02-1990
		DE 3919348 A1	21-12-1989
		DK 296589 A	17-12-1989
		EP 0346841 A2	20-12-1989
		JP 2042046 A	13-02-1990
		PT 90854 A	29-12-1989
		US 4968677 A	06-11-1990
		ZA 8904555 A	28-02-1990
		ZW 7689 A1	24-01-1990

Form PCT/ISA/220 (patent family sheet) (July 1999)

(51)Int.Cl. ⁷	F I	テーマコード (参考)
A 0 1 N 63/02	C 0 7 D 333/40	
C 0 7 D 333/40	A 0 1 N 53/00	5 0 8 C

(72)発明者 サン、 キングーモ
アメリカ合衆国デラウェア州1 9 7 0 7 ホツケシン・パイングローブレーン 2 2
F ターム(参考) 4C023 HA02
4H006 AA01 AA03 AB02 BJ50 BM30 BM71 BM73 BV22 BV25 BV72
BV74
4H011 AC01 BA01 BA06 BB06 BB07 BB09 BB15 BB21 BC03 BC05
BC08 BC18 BC19 BC20 BC22 DA02 DA03 DA15 DA16 DH03
DH10