



(19) 대한민국특허청(KR)

(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2017년03월08일

(11) 등록번호 10-1714291

(24) 등록일자 2017년03월02일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
A61K 31/42 (2006.01) **A61K 9/00** (2006.01)
 (52) CPC특허분류
A61K 31/42 (2013.01)
A61K 9/0019 (2013.01)
 (21) 출원번호 10-2015-7020688(분할)
 (22) 출원일자(국제) 2008년06월26일
 심사청구일자 2015년08월28일
 (85) 번역문제출일자 2015년07월29일
 (65) 공개번호 10-2015-0091544
 (43) 공개일자 2015년08월11일
 (62) 원출원 특허 10-2010-7001744
 원출원일자(국제) 2008년06월26일
 심사청구일자 2013년06월25일
 (86) 국제출원번호 PCT/US2008/068268
 (87) 국제공개번호 WO 2009/003075
 국제공개일자 2008년12월31일
 (30) 우선권주장
 60/937,389 2007년06월27일 미국(US)
 (56) 선행기술조사문헌
 KR1020070010145 A*
 *는 심사관에 의하여 인용된 문헌

(73) 특허권자
 이 아이 듀폰 디 네모아 앤드 캄파니
 미국 19805 델라웨어주 윌밍톤 피.오. 박스 2915
 센터 로드 974 체스트넛 런 플라자
 (72) 발명자
 램, 조지, 필립
 미국 19808 델라웨어주 윌밍톤 페어힐 드라이브
 148
 롱, 제프리, 키이스
 미국 19803 델라웨어주 윌밍톤 브루스 로드 1210
 쉘, 밍
 미국 19702 델라웨어주 뉴와크 사우스 퍼치 크릭
 드라이브 25
 (74) 대리인
 양영준, 심미성

전체 청구항 수 : 총 18 항

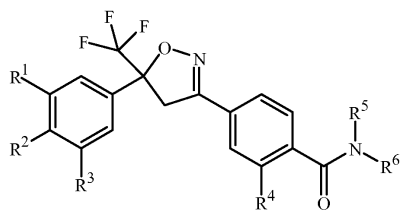
심사관 : 감유립

(54) 발명의 명칭 동물 해충 방제 방법

(57) 요약

살충적 유효량의 하기 화학식 1:

[화학식 1]



(여기서,

R¹은 할로젠, C₁-C₃ 할로알킬 또는 C₁-C₃ 할로알콕시이며;

R²는 H, 할로젠, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 할로알킬 또는 시아노이며;

R³은 H, 할로젠, C₁-C₃ 할로알킬 또는 C₁-C₃ 할로알콕시이며;

R⁴는 할로젠, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 할로알킬 또는 C₁-C₃ 할로알콕시이며;

(뒷면에 계속)

R^5 는 H, CH_3 , C_2-C_4 알킬카르보닐, C_2-C_4 할로알킬카르보닐, C_2-C_5 알콕시카르보닐 또는 $CH_2O(C_1-C_3$ 알킬)이며;

R^6 은 각각의 기가 하나의 R^7 로 치환된 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_3-C_6 사이클로알킬 또는 C_3-C_6 할로사이클로알킬이거나; 또는 R^6 은 $(CH_2)_mQ$ 이며;

Q , R^7 , R^{8a} 및 R^{8b} 는 본 개시 내용에 정의된 바와 같음)의 화합물을 이용하여 경구적으로 또는 주사에 의해 동물을 처리하는 단계를 포함하는, 무척추 기생 해충으로부터 동물을 보호하는 방법이 개시된다.

(52) CPC특허분류

A61K 9/0029 (2013.01)

A61K 9/0053 (2013.01)

명세서

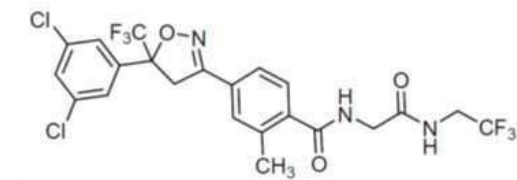
청구범위

청구항 1

벼룩으로부터 사람을 제외한 포유류를 보호하는 방법으로서,

투여 후 24시간 이상 동안 포유류를 보호하기 위한 살충적 유효량의 하기 화학식 1의 화합물 또는 그의 염을 포함하는 의약을 포유류에 피하 주사에 의해 투여하는 것을 포함하는 것인 방법.

[화학식 1]



청구항 2

삭제

청구항 3

제1항에 있어서, 상기 보호되는 포유류가 가축인 것인 방법.

청구항 4

제1항에 있어서, 상기 보호되는 포유류가 개과인 것인 방법.

청구항 5

제1항에 있어서, 상기 보호되는 포유류가 고양이과인 방법.

청구항 6

제1항에 있어서, 상기 의약을 매일 내지 연 1회 비경구 투여하는 방법.

청구항 7

제1항에 있어서, 상기 의약을 1개월 동안 벼룩으로부터 포유류를 보호하기에 유효한 양으로 비경구 투여하는 방법.

청구항 8

제1항에 있어서, 상기 의약을 6개월 동안 벼룩으로부터 포유류를 보호하기에 유효한 양으로 비경구 투여하는 방법.

청구항 9

제1항에 있어서, 상기 의약이 포유류 체중 kg 당 0.01 mg/kg 내지 30 mg/kg의 상기 화학식 1의 화합물 또는 그의 염을 포함하는 것인 방법.

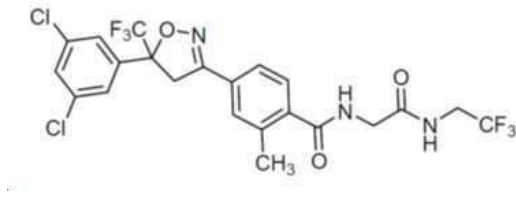
청구항 10

제1항에 있어서, 상기 의약이 포유류 체중 kg 당 30 mg/kg의 상기 화학식 1의 화합물 또는 그의 염을 포함하는 것인 방법.

청구항 11

경구 투여 후 24시간 이상 동안 벼룩으로부터 포유류를 보호하기 위한 살충적 유효량의 하기 화학식 1의 화합물 또는 그의 염을 포함하는, 저작성 식용 제품.

[화학식 1]



청구항 12

제11항에 있어서, 포유류가 선호하는 맛 및/또는 향기를 제공하여 포유류의 경구 투여를 촉진시키는 성분을 추가로 포함하는, 저작성 식용 제품.

청구항 13

제11항에 있어서, 상기 포유류가 개과인, 저작성 식용 제품.

청구항 14

제11항에 있어서, 상기 포유류가 고양이과인, 저작성 식용 제품.

청구항 15

제11항에 있어서, 포유류 체중 kg 당 0.01 mg/kg 내지 30 mg/kg의 상기 화학식 1의 화합물 또는 그의 염을 포함하는 것인, 저작성 식용 제품.

청구항 16

제11항에 있어서, 포유류 체중 kg 당 30 mg/kg의 상기 화학식 1의 화합물 또는 그의 염을 포함하는 것인, 저작성 식용 제품.

청구항 17

제11항에 있어서, 매일 내지 연 1회의 간격으로 벼룩으로부터 포유류를 보호하기 위한 살충적 유효량의 상기 화학식 1의 화합물 또는 그의 염의 용량을 포함하는, 저작성 식용 제품.

청구항 18

제11항에 있어서, 매주 내지 6개월마다 1회의 간격으로 벼룩으로부터 포유류를 보호하기 위한 살충적 유효량의 상기 화학식 1의 화합물 또는 그의 염의 용량을 포함하는, 저작성 식용 제품.

청구항 19

제11항에 있어서, 월 1회의 간격으로 벼룩으로부터 포유류를 보호하기 위한 살충적 유효량의 상기 화학식 1의 화합물 또는 그의 염의 용량을 포함하는, 저작성 식용 제품.

발명의 설명

기술 분야

[0001] 본 발명은 기생 해충 및 기생 해충 만연으로부터 동물을 보호하는 방법에 관한 것이다.

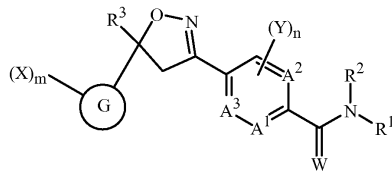
배경 기술

[0002] 동물 건강에서, 특히 식품 생산 및 반려 동물 분야에서 동물 기생충의 방제가 필수적이다. 기존의 치료 및 기생충 방제 방법은 많은 현재의 상업적 구충제에 대한 내성 증대로 인하여 손상되고 있다. 따라서 동물 기생충의 구제를 위한 보다 효과적인 방식의 발견이 필요하다. 또한, 살충제를 동물에게 경구적으로 또는 비경구적으로

로 적용하여 사람 또는 주위 환경의 가능한 오염을 방지하는 방법을 찾아내는 것이 유리하다.

[0003] 국제특허 공개 WO 05/085216호는 살곤충제로서 하기 화학식 i의 이속사줄린 유도체를 개시한다:

[0004] [화학식 i]



[0005]

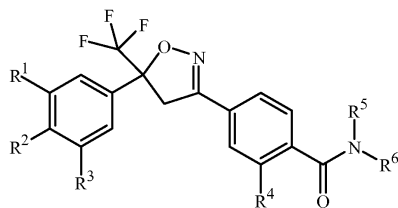
[0006] 여기서, 특히 A^1 , A^2 및 A^3 각각은 독립적으로 C 또는 N이며; G는 벤젠 고리이며; W는 O 또는 S이며; X는 할로젠 또는 C_1-C_6 할로알킬이다.

[0007] 본 발명의 방법은 이 공보에서는 개시되지 않는다.

발명의 내용

[0008] 본 발명은 살충적 유효량의 하기 화학식 1의 화합물 (모든 기하 이성체 및 입체 이성체를 포함함), 그의 N-산화물 또는 염을 동물에게 경구 또는 비경구 투여하는 단계를 포함하는, 무척추 기생 해충으로부터 동물을 보호하는 방법에 관한 것이다:

화학식 1



[0009]

[0010] 여기서,

[0011] R^1 은 할로젠, C_1-C_3 할로알킬 또는 C_1-C_3 할로알콕시이며;

[0012] R^2 는 H, 할로젠, C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬 또는 시아노이며;

[0013] R^3 은 H, 할로젠, C_1-C_3 할로알킬 또는 C_1-C_3 할로알콕시이며;

[0014] R^4 는 할로젠, C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬 또는 C_1-C_3 할로알콕시이며;

[0015] R^5 는 H, CH_3 , C_2-C_4 알킬카르보닐, C_2-C_4 할로알킬카르보닐, C_2-C_5 알콕시카르보닐 또는 $CH_2O(C_1-C_3$ 알킬)이며;

[0016] R^6 은 각각의 기가 하나의 R^7 로 치환된 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_3-C_6 사이클로알킬 또는 C_3-C_6 할로사이클로알킬이거나; 또는 R^6 은 $(CH_2)_mQ$ 이며;

[0017] Q는 탄소 원자들 및 하나의 O 또는 S(O)n를 고리 구성원으로서 포함하며 하나 또는 2개의 R^{8a} 및 하나의 R^{8b} 로 선택적으로 치환된 4- 내지 6-원 포화 고리이며;

[0018] R^7 은 OR^9 , $S(O)nR^{10}$ 또는 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 이거나; 또는 R^7 은 각각이 하나 또는 2개의 R^{15} 로 선택적으로 치환된 피리딘 또는 티아졸이며;

- [0019] 각각의 R^{8a} 는 독립적으로 할로젠, 시아노 또는 C_1-C_2 알킬이며;
- [0020] R^{8b} 는 OR^9 , $S(O)nR^{10}$ 또는 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 이며;
- [0021] R^9 는 H, CHO, C_2-C_4 알킬카르보닐, C_2-C_4 할로알킬카르보닐 또는 C_2-C_5 알콕시카르보닐이거나; 또는 R^9 는 각각 하나의 R^{13} 으로 선택적으로 치환된 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬이거나; 또는 R^9 는 하나 또는 2개의 R^{15} 로 선택적으로 치환된 피리딘 또는 티아졸이며;
- [0022] R^{10} 은 각각이 하나의 R^{13} 으로 선택적으로 치환된 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬이거나; 또는 R^{10} 은 각각이 하나 또는 2개의 R^{15} 로 선택적으로 치환된 피리딘 또는 티아졸이며;
- [0023] R^{11} 은 H, CHO, C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬, $CH_2O(C_1-C_3)$ 알킬, C_2-C_4 알킬카르보닐, C_2-C_4 할로알킬카르보닐 또는 C_2-C_5 알콕시카르보닐이며;
- [0024] R^{12} 는 각각이 하나의 R^{13} 으로 선택적으로 치환된 C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬 또는 C_3-C_6 사이클로알킬이거나; 또는 R^{12} 는 H, C_3-C_6 알켄일, C_3-C_6 할로알켄일, C_3-C_6 알카인일 또는 OR^{14} 이며;
- [0025] R^{13} 은 시아노, C_3-C_6 사이클로알킬, C_3-C_6 할로사이클로알킬, OH, OR^{14} 또는 $S(O)nR^{16}$ 이거나; 또는 R^{13} 은 각각이 하나 또는 2개의 R^{15} 로 선택적으로 치환된 피리딘 또는 티아졸이며;
- [0026] R^{14} 는 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬이며;
- [0027] 각각의 R^{15} 는 독립적으로 할로젠, 시아노, C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬 또는 C_1-C_3 할로알콕시이며;
- [0028] R^{16} 은 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬이며;
- [0029] m은 0 또는 1이며;
- [0030] n은 0, 1 또는 2이다.
- [0031] 본 발명은 또한 무척추 기생 해충 또는 그 환경을, 생물학적 유효량의 화학식 1의 화합물, 그의 N-산화물 또는 염과, 계면활성제, 고체 희석제 및 액체 희석제로 이루어진 군으로부터 선택된 적어도 하나의 추가 성분을 포함하며 선택적으로 생물학적 유효량의 적어도 하나의 추가의 생물학적 활성 화합물 또는 제제를 추가로 포함하는 조성물과 접촉시키는 그러한 방법에 관한 것이다.
- [0032] 본 발명은 추가로 동물에게 및/또는 동물상에 살충적 유효량의 화학식 1의 화합물, 그의 N-산화물 또는 염(예를 들어, 본 명세서에 개시된 조성물로서)을 투여하는 단계를 포함하는, 외부 및/또는 내부 기생충을 처리, 방지, 억제 및/또는 사멸하는 방법을 제공한다. 본 발명은 또한 살충적 유효량의 화학식 1의 화합물, 그의 N-산화물 또는 염(예를 들어, 본 명세서에 개시된 조성물로서)을 동물이 거주하는 환경(예를 들어, 축사 또는 담요)에 투여하는 그러한 방법에 관한 것이다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

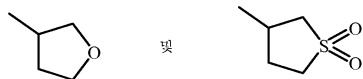
- [0033] 본 명세서에 사용되는 바와 같이, "포함하다", "포함하는", "함유하다", "함유하는", "갖는다", "갖는", "포함되어 있다" 또는 "포함되어 있는"이라는 용어 또는 이들의 임의의 다른 변형은 배타적이지 않은 포함을 커버하고자 한다. 예를 들어, 요소들의 목록을 포함하는 조성물, 혼합물, 공정, 방법, 용품, 또는 장치는 반드시 그러한 요소만으로 제한되지는 않고, 명확하게 열거되지 않거나 그러한 조성물, 혼합물, 공정, 방법, 용품, 또는 장치에 내재적인 다른 요소를 포함할 수도 있다. 더욱이, 명백히 반대로 기술되지 않는다면, "또는"은 포괄적인 '또는'을 말하며 배타적인 '또는'을 말하는 것은 아니다. 예를 들어, 조건 A 또는 B는 하기 중 어느 하나에 의해 만족된다: A는 참 (또는 존재함)이고 B는 거짓 (또는 존재하지 않음), A는 거짓 (또는 존재하지 않음)이

고 B는 참 (또는 존재함), A 및 B 둘 모두가 참 (또는 존재함).

- [0034] 또한, 본 발명의 요소 또는 성분 앞의 부정 관사("a" 및 "an")는 요소 또는 성분의 경우(즉, 출현)의 수를 고려하면 비제한적인 것으로 의도된다. 따라서, 부정 관사는 하나 또는 적어도 하나를 포함하는 것으로 관독되어야 하며, 요소 또는 성분의 단수형 단어는 그 수가 단수형을 명백하게 의미하는 것이 아니라면 복수형을 또한 포함한다.
- [0035] 본 명세서에서 언급될 때, 용어 "해충", "무척추 해충" 및 "무척추 기생 해충"은 해충으로서 경제적으로 중요한 절지 동물, 복족류 및 선충류를 포함한다. 용어 "절지 동물"은 곤충, 좀진드기, 거미, 전갈, 지네, 노래기, 쥐며느리, 및 결합류를 포함한다. 용어 "복족류"는 달팽이, 민달팽이, 및 기타 병안목(Stylommatophora)을 포함한다. 용어 "선충류"는 모든 연충, 예를 들어, 회충, 심장사상충, 및 식물 기생 선충류(phytophagous nematodes)(선충강(Nematoda)), 흡충류(흡충강(Tematoda)), 구두동물문(Acanthocephala), 및 촌충류(촌충강(Cestoda))를 포함한다.
- [0036] 본 명세서의 문맥에서 "무척추 해충 방제"는 무척추 해충 발생의 억제(사망, 섭식 감소, 및/또는 교배 중단을 포함함)를 의미하며, 관련된 표현들은 이와 유사하게 정의된다. 용어"살충" 및 "살충적"은 해충으로부터 동물을 보호하는, 해충에 대한 관찰가능한 효과를 말한다. 살충 효과는 전형적으로 표적 무척추 기생 해충의 출현 또는 활성을 감소시키는 것에 관련된다. 해충에 대한 그러한 효과는 괴사, 사멸, 성장 지연, 이동성 감소 또는 숙주 동물 상에 또는 숙주 동물 내에 남아 있는 능력의 감소, 섭식 감소 및 번식 억제를 포함한다. 무척추 기생 해충에 대한 이들 효과는 동물의 기생충 만연 또는 감염의 방제(방지, 감소 또는 제거를 포함함)를 제공한다.
- [0037] 기생충 "만연"은 사람 또는 동물을 위협하는 수로 기생충이 존재함을 말한다. 만연은 환경(예를 들어, 사람 또는 동물 주거지, 침구류, 및 주위 재산 또는 구조체)에서, 농작물 또는 다른 유형의 식물 상에서, 또는 동물의 가죽 또는 털에서 있을 수 있다. 만연이 동물 내에(예를 들어, 혈액 또는 다른 내부 조직 내에) 있을 경우, 용어 만연은 또한 달리 기술되지 않으면, 당업계에서 일반적으로 용어 "감염"이 이해되는 바와 같이 용어 "감염"과 동의어인 것으로 의도된다.
- [0038] 상기 설명에서, 단독으로 또는 "할로알킬"과 같은 복합 단어로 사용되는 용어 "알킬"은 직쇄 또는 분지형 알킬, 예를 들어, 메틸, 에틸, n-프로필, i-프로필, 또는 상이한 부틸, 펜틸 또는 헥실 이성체를 포함한다. "알켄일"은 직쇄 또는 분지형 알켄, 예를 들어 에틸렌, 1-프로펜일, 2-프로펜일, 및 상이한 부틸렌, 펜틸렌 및 헥실렌 이성체를 포함한다. "알켄일"은 또한 폴리엔, 예를 들어 1,2-프로파다이엔 및 2,4-헥사다이엔을 포함한다. "알카인일"은 직쇄 또는 분지형 알카인, 예를 들어 에타인일, 1-프로파인일, 2-프로파인일 및 상이한 부타인일, 펜타인일 및 헥사인일 이성체를 포함한다. "알카인일"은 또한 다수의 삼중 결합으로 이루어진 부분, 예를 들어 2,5헥사다이엔일을 포함할 수 있다.
- [0039] "사이클로알킬"은, 예를 들어 사이클로프로필, 사이클로부틸, 사이클로펜틸 및 사이클로헥실을 포함한다. 용어 "사이클로프로필메틸"은 메틸 부분상의 사이클로프로필 치환기를 나타낸다.
- [0040] 단독의 또는 "할로알킬"과 같은 복합 단어에서의, 또는 "할로겐으로 치환된 알킬"과 같은 설명에서 사용될 때의 용어 "할로겐"은 불소, 염소, 브롬 또는 요오드를 포함한다. 또한, "할로알킬"과 같은 복합 단어에서 사용될 때, 또는 "할로겐으로 치환된 알킬"과 같은 설명에서 사용될 때, 상기 알킬은 동일하거나 상이할 수 있는 할로겐 원자로 부분적으로 또는 완전히 치환될 수 있다. "할로알킬" 또는 "할로겐으로 치환된 알킬"의 예에는 CF_3 , CH_2Cl , CH_2CF_3 및 CCl_2CF_3 가 포함된다. 용어 "할로사이클로알킬", "할로알콕시", "할로알켄일" 등은 용어 "할로알킬"과 유사하게 정의된다. "할로알콕시"의 예에는 OCF_3 , OCH_2CCl_3 , $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CHF}_2$ 및 OCH_2CF_3 이 포함된다. "할로알켄일"의 예에는 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{Cl})_2$ 및 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CF}_3$ 이 포함된다.
- [0041] "알킬카르보닐"은 C(O) 부분에 결합된 직쇄 또는 분지형 알킬 부분을 나타낸다. 본 명세서에 사용되는 바와 같이, 화학적 약어 C(O)는 카르보닐 부분을 나타낸다. "알킬카르보닐"의 예에는 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 및 $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 가 포함된다.
- [0042] 치환기 내의 탄소 원자의 총수는 " $\text{C}_i\text{-C}_j$ " 접두어로 나타내며, 여기서 i와 j는 1 내지 6의 수이다. 예를 들어, $\text{C}_1\text{-C}_3$ 알킬은 메틸 내지 프로필을 나타낸다.

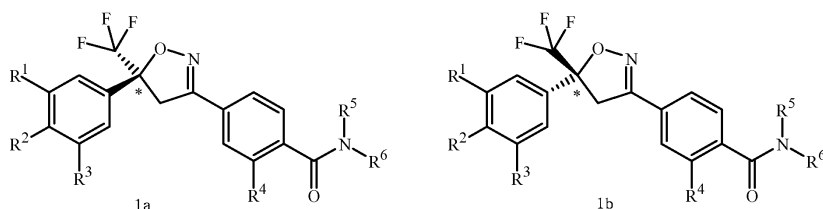
[0043] 기가 수소일 수 있는 치환기, 예를 들어, R^5 또는 R^{11} 을 함유하면, 이 치환기가 수소로서 취해질 때, 이것은 상기 기가 비치환된 것과 동등한 것으로 인식된다.

[0044] 발명의 개요에서 치환기 Q의 정의에서 사용되는 바와 같이, 용어 "고리 구성원"은 고리의 골격을 형성하는 원자 또는 다른 부분 (예를 들어, O 또는 S(O)_n)을 말한다. Q의 예에는 하기가 포함된다:



[0045]

[0046] 화학식 1의 화합물은 하나 이상의 입체 이성체로서 존재할 수 있다. 다양한 입체 이성체는 거울상 이성체, 부분입체 이성체, 및 아트로프 이성체(atropisomer)를 포함한다. 당업자는 하나의 입체 이성체가 다른 이성체(들)에 비하여 풍부할 때 또는 다른 입체 이성체(들)로부터 분리될 때 활성이 더 클 수 있고/있거나 유의한 효과를 나타낼 수 있음을 이해할 것이다. 부가적으로, 당업자는 상기 입체 이성체를 분리, 농축, 및/또는 선택적으로 제조하는 방법을 안다. 화학식 1의 화합물은 입체 이성체들의 혼합물, 개별 입체 이성체로서 또는 광학 활성 형태로서 존재할 수 있다. 예를 들어, 화학식 1의 두 가지 가능한 거울상 이성체는 별표(*)로 식별되는 이속사졸린 키랄 중심을 포함하는 화학식 1a와 화학식 1b로 도시된다. 이와 유사하게, 다른 키랄 중심이 예를 들어 R^1 , R^6 , R^9 및 R^{11} 에서 가능하다.



[0047]

[0048] 본 명세서에 그려진 분자의 도시는 입체화학을 도시하기 위한 표준 협정을 따른다. 입체형태 (stereoconfiguration)를 나타내기 위하여, 도면의 평면으로부터 보는 사람을 향하여 상승하는 결합은 진한 쉼기형으로 나타내어지며, 여기서 쉼기의 넓은 말단은 도면의 평면으로부터 보는 사람을 향하여 상승하는 원자에 부착된다. 도면의 평면 아래로 그리고 보는 사람으로부터 멀어져 가는 결합은 파선형(dashed) 쉼기형으로 나타내어지며, 여기서 쉼기형의 좁은 말단부는 보는 사람으로부터 더 먼 원자에 부착된다. 폭이 일정한 선은 실선 또는 파선형 쉼기형으로 나타낸 결합에 대하여 반대 방향 또는 중립 방향의 결합을 나타내며; 일정한 폭의 선은 또한 특정 입체형태를 특정하고자 하지 않는 분자 내의 결합 또는 분자의 부분을 도시한다.

[0049] 보다 큰 생물학적 활성의 거울상 이성체는 화학식 1a의 화합물인 것으로 여겨진다. 화학식 1a는 키랄 탄소에서 (S) 형태를 가지며 화학식 1b는 키랄 탄소에서 (R) 형태를 갖는다.

[0050] 본 발명의 방법은 라세미 혼합물, 예를 들어, 동일한 양의 화학식 1a 및 화학식 1b의 거울상 이성체를 포함한다. 또한, 본 발명의 방법은 라세미 혼합물과 비교할 때 화학식 1의 거울상 이성체가 풍부한 화합물을 포함한다. 또한 화학식 1, 예를 들어, 화학식 1a 및 화학식 1b의 화합물의 본질적으로 순수한 거울상 이성체가 포함된다.

[0051] 거울상 이성체가 풍부해질 때, 하나의 거울상 이성체는 다른 하나의 거울상 이성체보다 많은 양으로 존재하며, 풍부도는 거울상 이성체 과량("ee")으로 표현함으로써 정의될 수 있으며, 이것은 $(2x-1) \cdot 100\%$ 로 정의되고, 여기서 x는 혼합물 중 우세한 거울상 이성체의 몰분율이다(예를 들어, 20%의 ee는 60:40 비의 거울상 이성체에 해당한다).

[0052] 바람직하게는 화학식 1의 조성물은 적어도 50%의 거울상 이성체 과량; 더욱 바람직하게는 적어도 75%의 거울상 이성체 과량; 더욱 더 바람직하게는 적어도 90%의 거울상 이성체 과량; 그리고 가장 바람직하게는 적어도 94%의 거울상 이성체 과량의 보다 큰 활성의 이성체를 갖는다. 보다 큰 활성의 이성체의 거울상 이성체상 순수한 실시 형태가 특히 주목된다.

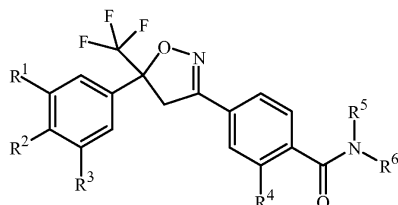
[0053] 화학식 1의 화합물은 추가의 키랄 중심을 포함할 수 있다. 본 발명의 방법은 이들 추가적인 키랄 중심에서 풍부하며 본질적으로 순수한 입체형태뿐만 아니라 라세미 혼합물도 포함한다. 화학식 1의 화합물은 화학식 1에서 아미드 결합 주위에서의 제한된 회전으로 인하여 하나 이상의 형태 이성체로서 존재할 수 있다. 본 발명의 방

법은 형태 이성체들의 혼합물을 포함한다. 또한, 본 발명의 방법은 하나의 형태 이성체가 다른 형태 이성체에 비하여 풍부한 화합물을 포함한다.

[0054] 발명의 개요에 개시된 본 발명의 실시 형태는 후술하는 것들을 포함한다. 하기 실시 형태에서, "화학식 1의 화합물"이라는 언급은 실시 형태에서 추가로 정의되지 않으면 발명의 개요에서 특정된 치환기의 정의를 포함한다.

[0055] 실시 형태 1. 살충적 유효 화합물이 하기 화학식 1의 이속사줄린 (모든 기하 이성체 및 입체 이성체를 포함함), 그의 N-산화물 또는 염으로부터 선택되는, 발명의 개요에 개시된 방법:

[0056] [화학식 1]



[0057]

[0058] 여기서,

[0059] R^1 은 할로젠, C_1-C_3 할로알킬 또는 C_1-C_3 할로알콕시이며;

[0060] R^2 는 H, 할로젠, C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬 또는 시아노이며;

[0061] R^3 은 H, 할로젠, C_1-C_3 할로알킬 또는 C_1-C_3 할로알콕시이며;

[0062] R^4 는 할로젠, C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬 또는 C_1-C_3 할로알콕시이며;

[0063] R^5 는 H, CH_3 , C_2-C_4 알킬카르보닐, C_2-C_4 할로알킬카르보닐, C_2-C_5 알콕시카르보닐 또는 $CH_2O(C_1-C_3$ 알킬)이며;

[0064] R^6 은 각각의 기가 하나의 R^7 로 치환된 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_3-C_6 사이클로알킬 또는 C_3-C_6 할로사이클로알킬이거나; 또는 R^6 은 $(CH_2)_mQ$ 이며;

[0065] Q는 탄소 원자들 및 하나의 O 또는 S(O) n 를 고리 구성원으로서 포함하며 하나 또는 2개의 R^{8a} 및 하나의 R^{8b} 로 선택적으로 치환된 4- 내지 6-원 포화 고리이며;

[0066] R^7 은 OR^9 , S(O) nR^{10} 또는 C(O) $NR^{11}R^{12}$ 이거나; 또는 R^7 은 각각이 하나 또는 2개의 R^{15} 로 선택적으로 치환된 피리딘 또는 티아졸이며;

[0067] 각각의 R^{8a} 는 독립적으로 할로젠, 시아노 또는 C_1-C_2 알킬이며;

[0068] R^{8b} 는 OR^9 , S(O) nR^{10} 또는 C(O) $NR^{11}R^{12}$ 이며;

[0069] R^9 는 H, CHO, C_2-C_4 알킬카르보닐, C_2-C_4 할로알킬카르보닐 또는 C_2-C_5 알콕시카르보닐이거나; 또는 R^9 는 각각이 하나의 R^{13} 로 선택적으로 치환된 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬이거나; 또는 R^9 는 하나 또는 2개의 R^{15} 로 선택적으로 치환된 피리딘 또는 티아졸이며;

[0070] R^{10} 은 각각이 하나의 R^{13} 로 선택적으로 치환된 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬이거나; 또는 R^{10} 은 각각이 하나 또는 2개의 R^{15} 로 선택적으로 치환된 피리딘 또는 티아졸이며;

[0071] R^{11} 은 H, CHO, C_1-C_4 알킬, C_1-C_4 할로알킬, $CH_2O(C_1-C_3$ 알킬), C_2-C_4 알킬카르보닐, C_2-C_4 할로알킬카르보닐 또는

C₂-C₅ 알콕시카르보닐이며;

[0072] R¹²는 각각이 하나의 R¹³으로 선택적으로 치환된 C₁-C₄ 알킬, C₁-C₄ 할로알킬 또는 C₃-C₆ 사이클로알킬이거나; 또는 R¹²는 H, C₃-C₆ 알켄일, C₃-C₆ 할로알켄일, C₃-C₆ 알카인일 또는 OR¹⁴이며;

[0073] R¹³은 시아노, C₃-C₆ 사이클로알킬, C₃-C₆ 할로사이클로알킬, OH, OR¹⁴ 또는 S(O)_nR¹⁶이거나; 또는 R¹³은 각각이 하나 또는 2개의 R¹⁵로 선택적으로 치환된 피리딘 또는 티아졸이며;

[0074] R¹⁴는 C₁-C₄ 알킬 또는 C₁-C₄ 할로알킬이며;

[0075] 각각의 R¹⁵는 독립적으로 할로겐, 시아노, C₁-C₃ 알킬, C₁-C₃ 할로알킬 또는 C₁-C₃ 할로알콕시이며;

[0076] R¹⁶은 C₁-C₄ 알킬 또는 C₁-C₄ 할로알킬이며;

[0077] m은 0 또는 1이며;

[0078] n은 0, 1 또는 2이다.

[0079] 실시 형태 2. R¹이 Cl, Br, CF₃, OCF₃ 또는 OCH₂CF₃인 실시 형태 1의 방법.

[0080] 실시 형태 3. R¹이 Cl, Br 또는 CF₃인 실시 형태 2의 방법.

[0081] 실시 형태 4. R¹이 Cl인 실시 형태 3의 방법.

[0082] 실시 형태 5. R¹이 Br인 실시 형태 3의 방법.

[0083] 실시 형태 6. R¹이 CF₃인 실시 형태 3의 방법.

[0084] 실시 형태 7. R²가 H, F 또는 Cl인 실시 형태 1의 방법.

[0085] 실시 형태 8. R²가 H인 실시 형태 7의 방법.

[0086] 실시 형태 9. R²가 F인 실시 형태 7의 방법.

[0087] 실시 형태 10. R²가 Cl인 실시 형태 7의 방법.

[0088] 실시 형태 11. R³이 H, F, Cl, Br 또는 CF₃인 실시 형태 1의 방법.

[0089] 실시 형태 12. R³이 H, Cl, Br 또는 CF₃인 실시 형태 11의 방법.

[0090] 실시 형태 13. R³이 Cl, Br 또는 CF₃인 실시 형태 12의 방법.

[0091] 실시 형태 14. R³이 H인 실시 형태 11의 방법.

[0092] 실시 형태 15. R³이 Cl인 실시 형태 11의 방법.

[0093] 실시 형태 16. R³이 Br인 실시 형태 11의 방법.

[0094] 실시 형태 17. R³이 CF₃인 실시 형태 11의 방법.

[0095] 실시 형태 18. R⁴가 할로겐 또는 C₁-C₃ 알킬인 실시 형태 1의 방법.

- [0096] 실시 형태 19. R^4 가 할로젠 또는 메틸인 실시 형태 18의 방법.
- [0097] 실시 형태 20. R^4 가 할로젠인 실시 형태 19의 방법.
- [0098] 실시 형태 21. R^4 가 C1인 실시 형태 20의 방법.
- [0099] 실시 형태 22. R^4 가 메틸인 실시 형태 19의 방법.
- [0100] 실시 형태 23. R^5 가 H인 실시 형태 1의 방법.
- [0101] 실시 형태 24. R^6 이 할로젠 또는 C_1-C_6 알킬인 실시 형태 1의 방법.
- [0102] 실시 형태 25. R^6 이 하나의 R^7 로 치환된 C_1-C_6 알킬인 실시 형태 1의 방법.
- [0103] 실시 형태 26. R^7 이 OR^9 , $S(O)nR^{10}$ 또는 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 인 실시 형태 1의 방법.
- [0104] 실시 형태 27. R^7 이 OR^9 인 실시 형태 26의 방법.
- [0105] 실시 형태 28. R^7 이 $S(O)nR^{10}$ 인 실시 형태 26의 방법.
- [0106] 실시 형태 29. R^7 이 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 인 실시 형태 26의 방법.
- [0107] 실시 형태 30. R^9 가 H 또는 C_1-C_4 알킬인 실시 형태 1의 방법.
- [0108] 실시 형태 31. R^9 가 H 또는 메틸인 실시 형태 30의 방법.
- [0109] 실시 형태 32. R^9 가 H인 실시 형태 31의 방법.
- [0110] 실시 형태 33. R^9 가 메틸인 실시 형태 31의 방법.
- [0111] 실시 형태 34. R^{10} 이 C_1-C_4 알킬인 실시 형태 1의 방법.
- [0112] 실시 형태 35. R^{11} 이 H인 실시 형태 1의 방법.
- [0113] 실시 형태 36. R^{12} 는 각각이 하나의 R^{13} 으로 선택적으로 치환된 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬인 실시 형태 1의 방법.
- [0114] 실시 형태 37. R^{12} 가 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬인 실시 형태 1의 방법.
- [0115] 실시 형태 38. R^{12} 가 C_1-C_4 할로알킬인 실시 형태 37의 방법.
- [0116] 실시 형태 38a. R^{12} 가 사이클로프로필 또는 사이클로프로필메틸인 실시 형태 1의 방법.
- [0117] 실시 형태 39. R^{13} 이 시아노, OH, OR^{14} 또는 $S(O)nR^{16}$ 인 실시 형태 1의 방법.
- [0118] 실시 형태 40. R^{13} 이 시아노인 실시 형태 39의 방법.
- [0119] 실시 형태 41. R^{13} 이 OH인 실시 형태 39의 방법.
- [0120] 실시 형태 42. R^{13} 이 OR^{14} 인 실시 형태 39의 방법.
- [0121] 실시 형태 43. R^{13} 이 $S(O)nR^{16}$ 인 실시 형태 39의 방법.
- [0122] 실시 형태 44. 살충적 유효량의 화학식 1의 화합물을 경구 투여하는 실시 형태 1의 방법.

- [0123] 실시 형태 45. 살충적 유효량의 화학식 1의 화합물을 비경구 투여하는 실시 형태 1의 방법.
- [0124] 실시 형태 46. 살충적 유효량의 화학식 1의 화합물을 주사에 의해 투여하는 실시 형태 45의 방법.
- [0125] 실시 형태 47. 보호될 동물이 척추 동물인 실시 형태 1의 방법.
- [0126] 실시 형태 48. 보호될 척추 동물이 포유류, 조류 또는 어류인 실시 형태 47의 방법.
- [0127] 실시 형태 49. 보호될 척추 동물이 포유류인 실시 형태 48의 방법.
- [0128] 실시 형태 50. 보호될 척추 동물이 조류인 실시 형태 48의 방법.
- [0129] 실시 형태 51. 보호될 척추 동물이 어류인 실시 형태 48의 방법.
- [0130] 실시 형태 52. 보호될 포유류가 사람인 실시 형태 49의 방법.
- [0131] 실시 형태 53. 보호될 포유류가 가축인 실시 형태 49의 방법.
- [0132] 실시 형태 54. 보호될 포유류가 개과인 실시 형태 49의 방법.
- [0133] 실시 형태 55. 보호될 포유류가 고양이과인 실시 형태 49의 방법.
- [0134] 실시 형태 56. 무척추 기생 해충이 외부기생충인 실시 형태 1의 방법.
- [0135] 실시 형태 57. 무척추 기생 해충이 내부기생충인 실시 형태 1의 방법.
- [0136] 실시 형태 58. 무척추 기생 해충이 연충인 실시 형태 1의 방법.
- [0137] 실시 형태 59. 무척추 기생 해충이 절지 동물인 실시 형태 1의 방법.
- [0138] 실시 형태 60. 무척추 기생 해충이 파리, 모기, 좀진드기, 진드기, 이, 벼룩, 홍줄노린재(true bugs) 또는 구더기인 실시 형태 1의 방법.
- [0139] 실시 형태 61. 무척추 기생 해충이 파리, 모기, 좀진드기, 진드기, 이, 벼룩, 빈대, 흡혈 곤충(kissing bug) 또는 구더기인 실시 형태 1의 방법.
- [0140] 실시 형태 62. 무척추 기생 해충이 파리 또는 구더기인 실시 형태 61의 방법.
- [0141] 실시 형태 63. 무척추 기생 해충이 모기인 실시 형태 61의 방법.
- [0142] 실시 형태 64. 무척추 기생 해충이 진드기 또는 좀진드기인 실시 형태 61의 방법.
- [0143] 실시 형태 65. 무척추 기생 해충이 이인 실시 형태 61의 방법.
- [0144] 실시 형태 66. 무척추 기생 해충이 벼룩인 실시 형태 61의 방법.
- [0145] 실시 형태 67. 무척추 기생 해충이 홍줄노린재인 실시 형태 61의 방법.
- [0146] 실시 형태 68. 무척추 기생 해충이 빈대, 또는 흡혈 곤충인 실시 형태 61의 방법.
- [0147] 실시 형태 69. 보호될 동물이 고양이 또는 개이며, 무척추 기생 해충이 벼룩, 진드기 또는 좀진드기인 실시 형태 61의 방법.
- [0148] 실시 형태 70. 구충적 유효량의 화학식 1의 화합물을 1년에 2회 경구 투여하는 실시 형태 44의 방법.
- [0149] 실시 형태 71. 구충적 유효량의 화학식 1의 화합물을 1개월에 1회 경구 투여하는 실시 형태 44의 방법.
- [0150] 실시 형태 72. 구충적 유효량의 화학식 1의 화합물을 1개월에 2회 경구 투여하는 실시 형태 44의 방법.
- [0151] 상기 실시 형태 1 내지 실시 형태 72를 비롯한 본 발명의 실시 형태뿐만 아니라 본 명세서에 개시된 임의의 다른 실시 형태들이 임의의 방식으로 조합될 수 있다.
- [0152] 실시 형태 1 내지 실시 형태 43의 조합들이 하기에 의해 예시된다:
- [0153] 실시 형태 A.
- [0154] R¹이 Cl, Br 또는 CF₃이며;

- [0155] R^2 가 H, F 또는 Cl이며;
- [0156] R^3 이 H, Cl, Br 또는 CF_3 인 실시 형태 1의 방법.
- [0157] 실시 형태 B.
- [0158] R^1 및 R^3 이 Cl이며;
- [0159] R^2 가 H인 실시 형태 A의 방법.
- [0160] 실시 형태 C.
- [0161] R^1 및 R^3 이 Br이며;
- [0162] R^2 가 H인 실시 형태 A의 방법.
- [0163] 실시 형태 D.
- [0164] R^1 및 R^3 이 CF_3 이며;
- [0165] R^2 가 H인 실시 형태 A의 방법.
- [0166] 실시 형태 E.
- [0167] R^1 , R^2 및 R^3 이 Cl인 실시 형태 A의 방법.
- [0168] 실시 형태 F.
- [0169] R^1 및 R^3 이 Cl이며;
- [0170] R^2 가 F인 실시 형태 A의 방법.
- [0171] 실시 형태 G.
- [0172] R^1 이 CF_3 이며;
- [0173] R^2 및 R^3 이 H인 실시 형태 A의 방법.
- [0174] 실시 형태 H.
- [0175] R^4 가 메틸이며;
- [0176] R^5 가 H인 실시 형태 A의 방법.
- [0177] 실시 형태 I.
- [0178] R^5 가 H이며;
- [0179] R^6 이 하나의 R^7 로 치환된 C_1-C_6 알킬이며;
- [0180] R^7 이 OR^9 , $S(O)nR^{10}$ 또는 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 인 실시 형태 A의 방법.
- [0181] 실시 형태 J.
- [0182] R^7 이 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 이며;
- [0183] R^{12} 는 각각이 하나의 R^{13} 으로 선택적으로 치환된 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬인 실시 형태 A의 방법.

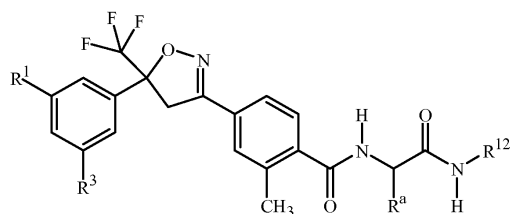
- [0184] 실시 형태 K.
- [0185] R^4 가 Cl 또는 CH_3 이며;
- [0186] R^5 가 H이며;
- [0187] R^6 이 하나의 R^7 로 치환된 C_1-C_6 알킬이며;
- [0188] R^7 이 OR^9 , $S(O)nR^{10}$ 또는 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 인 실시 형태 A의 방법.
- [0189] 실시 형태 L.
- [0190] R^1 이 Cl, Br, CF_3 , OCF_3 또는 OCH_2CF_3 이며;
- [0191] R^2 가 H이며;
- [0192] R^3 이 H, F, Cl, Br 또는 CF_3 인 실시 형태 K의 방법.
- [0193] 실시 형태 M.
- [0194] R^4 가 CH_3 이며;
- [0195] R^7 이 $C(O)NR^{11}R^{12}$ 인 실시 형태 L의 방법.
- [0196] 실시 형태 N.
- [0197] R^1 이 CF_3 이며;
- [0198] R^3 이 Cl, Br 또는 CF_3 인 실시 형태 M의 방법.
- [0199] 실시 형태 O.
- [0200] R^{11} 이 H이며;
- [0201] R^{12} 가 C_1-C_4 알킬 또는 C_1-C_4 할로알킬인 실시 형태 M의 방법.
- [0202] 실시 형태 P.
- [0203] R^{11} 이 H이며;
- [0204] R^{12} 가 사이클로프로필 또는 사이클로프로필메틸인 실시 형태 M의 방법.
- [0205] 특정한 실시 형태는 화학식 1의 화합물이 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 실시 형태 1의 방법을 포함한다:
- [0206] 4-[5-(3,5-다이클로로페닐)-4,5-다이하이드로-5-(트라이플루오로메틸)-3-이속사졸릴]-2-메틸-N-(2-피리디닐메틸)벤즈아미드,
- [0207] 4-[5-(3,5-다이클로로페닐)-4,5-다이하이드로-5-(트라이플루오로메틸)-3-이속사졸릴]-2-메틸-N-[2-옥소-2-[(2,2,2-트라이플루오로에틸)아미노]에틸]벤즈아미드,
- [0208] 4-[5-(3,5-다이클로로페닐)-4,5-다이하이드로-5-(트라이플루오로메틸)-3-이속사졸릴]-2-메틸-N-[2-(메틸티오)에틸]벤즈아미드,
- [0209] 4-[5-(3,5-다이클로로페닐)-4,5-다이하이드로-5-(트라이플루오로메틸)-3-이속사졸릴]-2-메틸-N-[2-(메틸설포닐)에틸]벤즈아미드,
- [0210] 4-[5-(3,5-다이클로로페닐)-4,5-다이하이드로-5-(트라이플루오로메틸)-3-이속사졸릴]-2-메틸-N-[2-(메틸설포

닐)에틸]벤즈아미드, 및

[0211] 4-[5-(3,5-다이클로로페닐)-4,5-다이하이드로-5-(트라이플루오로메틸)-3-이속사줄릴]-2-메틸-N-[1-메틸-3-(메틸티오)프로필]벤즈아미드.

[0212] 추가의 특정 실시 형태는 화학식 1의 화합물이 표 A 및 표 B로부터 선택되는 실시 형태 1의 방법을 포함한다. 하기 약어가 표 A에서 사용된다: *c*-Pr은 사이클로프로필을 의미한다.

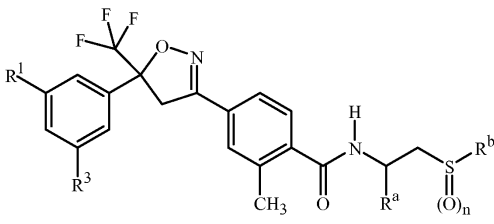
[0213] 표 A



R_1 는 H임			R_1 는 CH_3 임		
R^1	R^3	R^{12}	R^1	R^3	R^{12}
Cl	Cl	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃
Cl	Cl	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	CH ₂ CH ₃
Cl	Cl	CH(CH ₃) ₂	Cl	Cl	CH(CH ₃) ₂
Cl	Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	Cl	CH ₂ CF ₃
Cl	Cl	<i>c</i> -Pr	Cl	Cl	<i>c</i> -Pr
Cl	Cl	CH ₂ - <i>c</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂ - <i>c</i> -Pr
Cl	CF ₃	CH ₃	Cl	CF ₃	CH ₃
Cl	CF ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃	CH ₂ CH ₃
Cl	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
Cl	CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	CF ₃	CH ₂ CF ₃
Cl	CF ₃	<i>c</i> -Pr	Cl	CF ₃	<i>c</i> -Pr
Cl	CF ₃	CH ₂ - <i>c</i> -Pr	Cl	CF ₃	CH ₂ - <i>c</i> -Pr
Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
Cl	OCH ₂ CF ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH(CH ₃) ₂
Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
Cl	OCH ₂ CF ₃	<i>c</i> -Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	<i>c</i> -Pr
Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ - <i>c</i> -Pr	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ - <i>c</i> -Pr
Br	CF ₃	CH ₃	Br	CF ₃	CH ₃
Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃
Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	Br	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
Br	CF ₃	CH ₂ CF ₃	Br	CF ₃	CH ₂ CF ₃
Br	CF ₃	<i>c</i> -Pr	Br	CF ₃	<i>c</i> -Pr
Br	CF ₃	CH ₂ - <i>c</i> -Pr	Br	CF ₃	CH ₂ - <i>c</i> -Pr
CF ₃	CF ₃	CH ₃	CF ₃	CF ₃	CH ₃
CF ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃
CF ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	CF ₃	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃
CF ₃	CF ₃	<i>c</i> -Pr	CF ₃	CF ₃	<i>c</i> -Pr
CF ₃	CF ₃	CH ₂ - <i>c</i> -Pr	CF ₃	CF ₃	CH ₂ - <i>c</i> -Pr

[0214]

[0215] 표 B



R_a 는 H임

R_a 는 CH₂n임

R ¹	R ³	n	R ^b
Cl	Cl	0	CH ₃
Cl	Cl	1	CH ₃
Cl	Cl	2	CH ₃
Cl	Cl	0	CH ₂ CH ₃
Cl	Cl	1	CH ₂ CH ₃
Cl	Cl	2	CH ₂ CH ₃
Cl	CF ₃	0	CH ₃
Cl	CF ₃	1	CH ₃
Cl	CF ₃	2	CH ₃
Cl	CF ₃	0	CH ₂ CH ₃
Cl	CF ₃	1	CH ₂ CH ₃
Cl	CF ₃	2	CH ₂ CH ₃
Cl	OCH ₂ CF ₃	0	CH ₃
Cl	OCH ₂ CF ₃	1	CH ₃
Cl	OCH ₂ CF ₃	2	CH ₃
Cl	OCH ₂ CF ₃	0	CH ₂ CH ₃
Cl	OCH ₂ CF ₃	1	CH ₂ CH ₃
Cl	OCH ₂ CF ₃	2	CH ₂ CH ₃
Br	CF ₃	0	CH ₃
Br	CF ₃	1	CH ₃
Br	CF ₃	2	CH ₃
Br	CF ₃	0	CH ₂ CH ₃
Br	CF ₃	1	CH ₂ CH ₃
Br	CF ₃	2	CH ₂ CH ₃
CF ₃	CF ₃	0	CH ₃
CF ₃	CF ₃	1	CH ₃
CF ₃	CF ₃	2	CH ₃
CF ₃	CF ₃	0	CH ₂ CH ₃
CF ₃	CF ₃	1	CH ₂ CH ₃
CF ₃	CF ₃	2	CH ₂ CH ₃

[0216]

[0217] 화학식 1의 화합물 또는 실시 형태 1 내지 실시 형태 43 또는 실시 형태 A 내지 실시 형태 P 중 임의의 것의 화합물은 화합물의 경구 또는 비경구 투여에 의해 무척추 기생 해충으로부터 동물을 보호하기 위해 사용될 수 있다.

[0218]

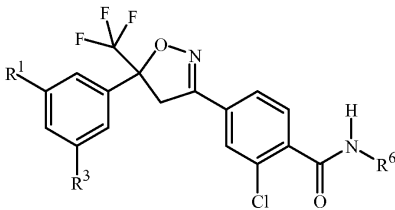
따라서, 본 발명은 동물 의약으로서 또는 보다 구체적으로는 동물 구충 의약으로서 사용하기 위한 화학식 1의 화합물 또는 실시 형태 1 내지 실시 형태 43 또는 실시 형태 A 내지 실시 형태 P 중 임의의 것의 화합물(및 그를 함유한 조성물)을 포함하는 것으로 이해된다. 보호될 동물은 실시 형태 47 내지 실시 형태 55 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 무척추 기생 해충은 실시 형태 56 내지 실시 형태 68 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 의약은 경구 또는 비경구 투여 형태일 수 있다.

[0219]

본 발명은 또한 무척추 기생 해충으로부터 동물을 보호하기 위한 의약의 제조에 있어서의 화학식 1의 화합물 또는 실시 형태 1 내지 실시 형태 43 또는 실시 형태 A 내지 실시 형태 P 중 임의의 것의 화합물의 용도를 포함하는 것으로 이해된다. 보호될 동물은 실시 형태 47 내지 실시 형태 55 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 무척추 기생 해충은 실시 형태 56 내지 실시 형태 68 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 의약은 경구 또는 비경구 투여 형태일 수 있다.

- [0220] 본 발명은 또한 무척추 기생 해충으로부터 동물을 보호하기 위한 의약의 제조에 사용하기 위한 화학식 1의 화합물 또는 실시 형태 1 내지 실시 형태 43 또는 실시 형태 A 내지 실시 형태 P 중 임의의 것의 화합물을 포함하는 것으로 이해된다. 보호될 동물은 실시 형태 47 내지 실시 형태 55 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 무척추 기생 해충은 실시 형태 56 내지 실시 형태 68 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 의약은 경구 또는 비경구 투여 형태일 수 있다.
- [0221] 본 발명은 또한 무척추 기생 해충으로부터 동물을 보호하기 위해 포장되고 제공되는 화학식 1의 화합물 또는 실시 형태 1 내지 실시 형태 43 또는 실시 형태 A 내지 실시 형태 P 중 임의의 것의 화합물을 포함하는 것으로 이해된다. 보호될 동물은 실시 형태 47 내지 실시 형태 55 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 무척추 기생 해충은 실시 형태 56 내지 실시 형태 68 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 본 발명의 화합물은 경구 또는 비경구 투여 형태로서 포장되고 제공될 수 있다.
- [0222] 본 발명은 또한 청구항 1의 화합물을 적어도 하나의 약학적 또는 수의학적으로 허용가능한 담체와 혼합하는 것을 특징으로 하는 무척추 기생 해충으로부터 동물을 보호하기 위한 조성물의 제조 방법을 포함하는 것으로 이해된다. 보호될 동물은 실시 형태 47 내지 실시 형태 55 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 무척추 기생 해충은 실시 형태 56 내지 실시 형태 68 중 임의의 것에서 정의된 바와 같다. 본 발명의 조성물은 경구 또는 비경구 투여 형태로서 포장되고 제공될 수 있다.
- [0223] 화학식 1의 이속사줄린은 국제특허 공개 WO 2005/085216호에 개시된 바와 같이 제조될 수 있다.
- [0224] 당업자는 모든 피리딘 복소환이 N-산화물을 형성할 수 있는 것은 아님을 이해할 것이며; 당업자는 N-산화물을 형성할 수 있는 피리딘 복소환을 인지할 것이다. 피리딘 복소환의 N-산화물의 제조를 위한 합성 방법은 당업자에 의해 매우 잘 알려져 있으며, 이는 과산화산, 예를 들어 과아세트산, *m*-클로로과벤조산(MCPBA), 과산화수소, 알킬 하이드로퍼옥사이드, 예를 들어 *t*-부틸 하이드로퍼옥사이드, 과붕산나트륨, 및 다이옥시란, 예를 들어 다이메틸다이옥시란을 이용한 복소환의 산화를 포함한다. N-산화물의 제조를 위한 이들 방법은 문헌에 광범하게 기재되고 개관되었으며, 예를 들어 문헌[T. L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press]; 문헌[M. Tisler and B. Stanovnik, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press]; 문헌[M. R. Grimmett and B. R. T. Keene, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press]; 문헌[M. Tisler and B. Stanovnik, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press]; 및 문헌[G. W. H. Cheeseman and E. G. Werstiuk, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press]을 참조한다.
- [0225] 당업자는, 당해 환경에서 그리고 생리학적 조건 하에서 화학적 화합물의 염이 그의 상응하는 비염(nonsalt) 형태와 평형 상태로 있기 때문에 염이 비염 형태의 생물학적 유용성을 공유함을 인지한다. 따라서 화학식 1의 화합물의 매우 다양한 염이 무척추 해충 및 동물 기생충의 방제에 유용하다. 화학식 1의 화합물의 염은 무기 또는 유기 산, 예를 들어 브롬화수소산, 염산, 질산, 인산, 황산, 아세트산, 부티르산, 푸마르산, 락트산, 말레산, 말론산, 옥살산, 프로피온산, 살리실산, 타르타르산, 4-톨루엔설폰산 또는 발레르산과의 산-부가염을 포함한다. 따라서, 본 발명의 방법은 화학식 1의 화합물, 그의 N-산화물 및 염으로부터 선택되는 화합물을 포함한다.
- [0226] 국제특허 공개 WO 2005/085216호에 개시된 절차를 당업계에 공지된 방법과 함께 이용하여, 표 1 내지 표 4의 하기 화합물을 제조할 수 있다. 이들 표는 본 발명의 방법에 유용한 예시적인 화학식 1의 화합물의 특정 화합물을 개시한다. 하기 약어가 이하의 표에 사용된다: Me는 메틸을 의미하며, Et는 에틸을 의미하며, n-Pr은 CH₂CH₂CH₃을 의미하며, *i*-Pr은 CH(CH₃)₂를 의미하며, *c*-Pr은 사이클로프로필을 의미하며, *i*-Bu는 CH₂CH(CH₃)₂를 의미하며, *s*-Bu는 CH(CH₃)CH₂CH₃을 의미하며, *t*-Bu는 C(CH₃)₃을 의미하며, S(O)는 설피닐을 의미하며, S(O)₂는 설퍼닐을 의미하며, C(O)는 카르보닐을 의미한다.

표 1



R¹은 C1이고 R³은

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 Br이고 R³은

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R^1 은 CF₃이고 R³은 H임

R^6	R^6	R^6
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R^1 은 CF₃이고 R³은 F임

R^6	R^6	R^6
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

[0228]

CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 CF₃이고 R³는 C1원

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 CF₃이고 R³는 Br원

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

[0229]

CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 CF₃이고 R³은 CF₃임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 OCF₃이고 R³은 C1임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

[0230]

CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 OCH₂CF₃이고 R³은 F임

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 OCH₂CF₃이고 R³은 Cl임

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

[0231]

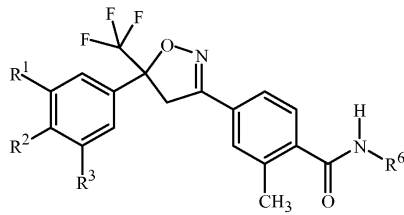
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 OCH_2CF_3 이고 R³은 Br임

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[0232]

표 2



R¹은 C1이고 R²는 C1이고 R³는 C1임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 C1이고 R²는 F이고 R³는 C1임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

[0233]

CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 C1이고 R²는 CN이고 R³는 C1임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 Br이고 R²는 H이고 R³는 H임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

[0234]

CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 Br이고 R²는 H이고 R³는 Cl임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 Br이고 R²는 F이고 R³는 Br임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

[0235]

CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 Br이고 R²는 C1이고 R³는 C1임

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 Br이고 R²는 C1이고 R³는 Br임

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

[0236]

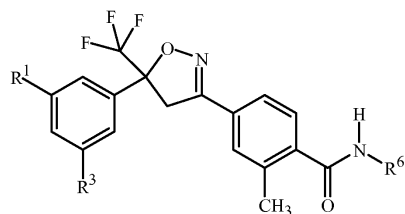
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 OCF₃이고 R²는 H이고 R³은 Br임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[0237]

표 3



R¹은 C1 이고 R³는 C1임

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEi	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEi	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)

[0238]

CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃

[0239]

CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr) CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃

[0240]

CH(Et)CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMc	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMc	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMc	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMc	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMc	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMc	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMc	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

R¹은 CF₃ 이고 R³는 H임

R⁶
CH₂CH₂OH
CH₂CH₂OMe

R⁶
CH₂CH₂SO₂Me
CH₂CH₂SO₂Et

R⁶
CH₂C(O)NH(Me)
CH₂C(O)NH(Et)

[0241]

CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂

[0242]

CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

R¹은 CF₃이고 R³은 F임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)

[0243]

C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃

[0244]

CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

R¹은 CF₃이고 R³은 C1원

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)

[0245]

CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃

[0246]

CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

R¹은 CF₃ 이고 R³은 Br 일

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)

[0247]

CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[0248]

CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

R¹은 CF₃이고 R³은 CF₃인

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEi	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEi	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂

[0249]

CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

[0250]

R¹은 OCF₃ 이고 R³는 C1원

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃

[0251]

CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

$R^1 \text{ or } OCH_2CF_3, R^{3,4,5} \text{ or } F \text{ or } Cl$

R^6	R^6	R^6
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)

[0252]

CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F

[0253]

CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCH ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCH ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

R¹은 OCH₂CF₃, R³은 C1임

<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>	<u>R⁶</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)

[0254]

CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl

[0255]

CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

R¹은 OCH₂CF₃, R³은 Br을

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Me)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(Et)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)

[0256]

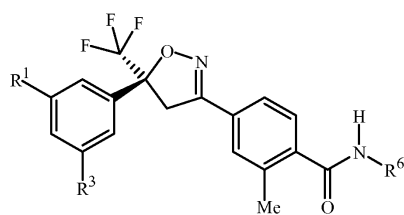
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂

[0257]

CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
		CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)

[0258]

표 4



R¹은 C1이고 R³는 C1임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[0259]

R¹은 Br이고 R³는 Br임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 CF₃이고 R³는 H임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[0260]

R¹은 CF₃이고 R³은 F임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 CF₃이고 R³은 Cl임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[0261]

R¹은 CF₃이고 R³은 Br임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 CF₃이고 R³은 CF₃임

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[0262]

R¹은 OCF₃ 이고 R³는 C1원

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 OCH₂CF₃ 이고 R³는 F 원

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[0263]

R¹은 OCH₂CF₃이고 R³는 C1원

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹은 OCH₂CF₃이고 R³는 Br원

R ⁶	R ⁶	R ⁶
CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH ₂	CH ₂ C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMc	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NH(<i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ (4-thiazolyl)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ (2-pyridinyl)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[0264]

[0265]

화학식 1의 화합물의 조성물은 또한 제형 조제로서 당업자에게 알려진 제형 보조제 및 첨가제를 함유할 수 있다 (이들 중 일부는 또한 고체 회석제, 액체 회석제 또는 계면활성제로 기능하는 것으로 간주될 수 있음). 그러한 제형 보조제 및 첨가제는 pH (완충제), 가공 동안 발포(소포제, 예를 들어, 폴리오르가노실록산), 활성 성분의 침강(현탁제), 점도(요변성 증점제), 용기내 미생물 생장(항미생물제), 제품 동결(동결 방지제), 색상(염료/안료 분산액), 워시-오프(필름 형성제 또는 스티커), 증발(증발 지연제), 및 다른 제형 특질을 제어할 수 있다. 필름 형성제는 예를 들어, 폴리비닐 아세테이트, 폴리비닐 아세테이트 공중합체, 폴리비닐피롤리돈-비닐 아세테이트 공중합체, 폴리비닐 알코올, 폴리비닐 알코올 공중합체 및 왁스를 포함한다. 제형 보조제 및 첨가제의 예에는 문헌[McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.]; 및 국제특허 공개 WO 03/024222호에 열거된 것들이 포함된다.

[0266]

화학식 1의 화합물과, 적어도 하나의 다른 무척추 기생 해충 방제 활성 성분의 조합을 사용하는 본 발명의 방법이 주목된다. 상기 다른 무척추 기생 해충 방제 활성 성분이 화학식 1의 화합물과 상이한 작용 부위를 갖는 그러한 방법이 특히 주목된다. 소정의 경우에, 유사한 방제 범위를 갖지만 작용 부위가 상이한 적어도 하나의 다른 무척추 기생 해충 방제 활성 성분과의 조합이 내성 관리에 특히 유리할 것이다. 따라서, 본 발명의 방법에 유용한 화학식 1의 화합물을 포함하는 조성물은 유사한 방제 범위를 갖지만 작용 부위가 상이한 생물학적 유효량의 적어도 하나의 추가의 무척추 기생 해충 방제 활성 성분을 추가로 포함할 수 있다.

- [0267] 화학식 1의 화합물은 기타 보조제 없이 적용될 수 있지만, 가장 흔히는 적용은 하나 이상의 활성 성분을 적합한 담체, 희석제 및 계면활성제와 함께 포함하고, 가능하게는 생각되는 최종 용도에 따라 음식물과 조합된 제형의 적용일 것이다. 한 가지 적용 방법은 화학식 1의 화합물의 수 분산액 또는 정제유 용액을 분무하는 것을 포함한다. 분무 오일, 분무 오일 농축액, 적용기 스티커, 보조제, 기타 용매, 및 상승제, 예를 들어, 피페로닐 부톡사이드와의 조합은 흔히 화합물 효능을 향상시킨다. 그러한 스프레이는 캔, 병, 또는 기타 용기와 같은 분무 용기로부터, 펌프에 의하거나 또는 가압 용기, 예를 들어, 가압 에어로졸 분무 캔으로부터 이를 방출함으로써 적용될 수 있다. 그러한 분무 조성물은 다양한 형태, 예를 들어, 스프레이, 연막, 폼, 혼연 또는 연무의 형태를 취할 수 있다. 따라서 그러한 분무 조성물은 경우에 따라 추가로 추진제, 발포제 등을 포함할 수 있다. 생물학적 유효량의 화학식 1의 화합물 또는 조성물 및 담체를 포함하는 분무 조성물이 주목된다. 그러한 분무 조성물의 일 실시 형태는 생물학적 유효량의 화학식 1의 화합물 또는 조성물 및 추진제를 포함한다. 대표적인 추진제는 메탄, 에탄, 프로판, 부탄, 아이소부탄, 부텐, 펜탄, 아이소펜탄, 네오펜탄, 펜텐, 하이드로플루오로카본, 클로로플루오로카본, 다이메틸 에테르, 및 이들의 혼합물을 포함하지만 이로 한정되지 않는다. 모기, 딱파리, 침파리, 사슴파리, 쇠등에, 말벌, 땅벌, 호박벌, 진드기, 거미, 개미, 각다귀 등 - 개별적인 또는 조합된 것을 포함함 - 으로 이루어진 군으로부터 선택된 적어도 하나의 무척추 기생 해충을 방제하기 위해 사용되는 분무 조성물(및 분무 용기로부터 분배되는 그러한 분무 조성물의 사용 방법)이 주목된다.
- [0268] 동물 기생충의 방제는 숙주 동물의 신체의 표면(예를 들어, 어깨, 겨드랑이, 복부, 허벅지의 안쪽 부분)에 기생하는 외부 기생충 및 숙주 동물의 신체의 내부(예를 들어, 위, 장, 폐, 혈관, 피부 아래, 림프 조직)에 기생하는 내부 기생충의 방제를 포함한다. 외부 기생성 또는 질환-전파 해충에는 예를 들어, 털진드기, 진드기, 이, 모기, 파리, 좀진드기 및 벼룩이 포함된다. 내부 기생충에는 심장사상충, 십이지장충 및 연충이 포함된다. 화학식 1의 화합물 및 조성물이 외부 기생충 해충의 퇴치에 특히 적합하다. 화학식 1의 화합물 및 조성물은 동물에서의 기생충에 의한 만연 또는 감염의 전신성 및/또는 비전신성 방제에 적합하다.
- [0269] 본 발명의 화합물 및 조성물은 야생 동물, 가축 및 농업용 노동 동물 내의 것들을 비롯한 동물 대상에 만연하는 무척추 기생 해충의 퇴치에 적합하다. 가축은 음식 또는 섬유와 같은 생성물을 제조하기 위해, 또는 그 노동을 위해 농업적 배경에서 의도적으로 사육된 길들여진 동물들(단수로 또는 복수로) 지칭하기 위해 사용되는 용어이며; 가축의 예는 소, 양, 염소, 말, 돼지, 당나귀, 낙타, 물소, 토끼, 닭, 칠면조, 오리 및 거위(예를 들어, 고기, 밀크, 버터, 난(egg), 털, 가죽, 깃털 및/또는 울(wool)을 위해 사육됨)을 포함한다. 기생충의 퇴치에 의해, 치사성 및 성능 감소(고기, 밀크, 울, 가죽, 난 등의 견지에서)가 감소되어, 화학식 1의 화합물을 포함하는 조성물의 적용은 동물의 보다 경제적이고 간단한 축산을 허용하게 된다. 1
- [0270] 화학식 1의 화합물과 조성물은 반려 동물과 애완 동물(예를 들어, 개, 고양이, 애완용 새 및 수족관 어류), 연구 및 실험 동물(예를 들어, 햄스터, 기니피그, 쥐 및 생쥐), 및 동물원, 야생 서식지 및/또는 서커스를 위하여/동물원, 야생 서식지 및/또는 서커스에서 사육되는 동물에 만연하는 무척추 기생 해충 퇴치에 특히 적합하다.
- [0271] 본 발명의 일 실시 형태에서, 동물은 바람직하게는 척추동물이며, 더욱 바람직하게는 포유류, 조류 또는 어류이다. 특정 실시 형태에서, 동물 대상은 (사람과 같이 대형 유인원을 비롯한) 포유류이다. 다른 포유류 대상은 영장류(예를 들어, 원숭이), 소과(예를 들어, 축우 또는 젓소), 돼지과(예를 들어, 성장한 돼지 또는 새끼 돼지), 양과(예를 들어, 염소 또는 양), 말류(예를 들어, 말), 개과(예를 들어, 개), 고양이과(예를 들어, 집 고양이), 낙타, 사슴, 당나귀, 물소, 영양, 토끼, 및 설치류(예를 들어, 기니피그, 다람쥐, 쥐, 생쥐, 게르빌루스쥐, 및 햄스터)를 포함한다. 조류는 오리과(백조, 오리 및 거위), 비둘기과(예를 들어, 비둘기), 꿩과(예를 들어, 자고, 너조 및 칠면조), 태시에니다에(Thesienidae) (예를 들어, 길들여진 닭), 앵무새과(예를 들어, 잉꼬, 마코앵무새, 및 앵무새), 엽조, 및 주금류(예를 들어, 타조)를 포함한다.
- [0272] 화학식 1의 화합물로 처리되거나 보호된 새는 상업적 또는 비상업적 조류 사육과 결부될 수 있다. 이들은 특히 애완 동물 또는 수집가 시장을 위해 사육된, 오리과, 예를 들어, 백조, 거위 및 오리, 비둘기과, 예를 들어, 비둘기 및 길들여진 비둘기, 꿩과, 예를 들어, 자고, 너조 및 칠면조, 태시에니다에, 예를 들어, 길들여진 닭, 및 앵무새과, 예를 들어, 잉꼬, 마코앵무새, 및 앵무새를 포함한다.
- [0273] 본 발명의 목적상, 용어 "어류"는 어류의 진골어하강(Teleosti) 그룹, 즉, 경골어류를 제한없이 포함하는 것으로 이해될 것이다. 연어목(연어과를 포함함) 및 농어목(검정우럭과를 포함함) 둘 모두가 진골어하강 그룹 내에 포함된다. 잠재적인 어류 수용자(fish recipient)의 예에는 특히 연어과, 바리과, 도미과, 시클리드과 및 검정우럭과가 포함된다.
- [0274] 유대류(예를 들어, 캥거루), 파충류(예를 들어, 양식 거북이), 및 기생충 감염 또는 만연을 치료하거나 예방하

는 데 있어서 본 발명의 방법이 안전하고 효과적인 기타 경제적으로 중요한 가치를 비롯한 다른 동물들이 또한 본 발명의 방법으로부터 도움을 받을 것으로 생각된다.

- [0275] 보호될 동물에게 살충적 유효량의 화학식 1의 화합물을 투여함으로써 방제되는 무척추 기생 해충의 예에는 외부 기생충(절지 동물, 진드기류 등) 및 내부 기생충(연충, 예를 들어, 선충류, 흡충류, 촌충류, 구두충류 등)을 포함한다.
- [0276] 연충증으로 일반적으로 설명되는 질환 또는 질환 군은 연충으로 알려진 기생충 벌레에 의한 동물 숙주의 감염으로 인한 것이다. 용어 "연충"은 선충류, 흡충류, 촌충류 및 구두충류를 포함하고자 한다. 연충증은 돼지, 양, 말, 소, 염소, 개, 고양이 및 가금류와 같은 길들여진 동물에서 널리 퍼진 그리고 심각한 경제적 문제이다.
- [0277] 연충 중에서, 선충류로 설명되는 벌레 군은 광범위하고 때로는 심각한 감염을 다양한 동물 중에서 일으킨다. 본 발명의 화합물에 의해 그리고 본 발명의 방법에 의해 치료될 것으로 생각되는 선충류는 제한없이 하기 속을 포함한다: 아칸토케일로네마(*Acanthocheilonema*), 아에루로스트롱기루스(*Aelurostrongylus*), 안실로스토마(*Ancylostoma*), 안지오스트롱기루스(*Angiostrongylus*), 아스카리디아(*Ascaridia*), 아스카리스(*Ascaris*), 브루기아(*Brugia*), 부노스토뎀(*Bunostomum*), 카필라리아(*Capillaria*), 차베르티아(*Chabertia*), 쿠페리아(*Cooperia*), 크레노소마(*Crenosoma*), 디티오키우루스(*Dictyocaulus*), 디옥토피름(*Diectophyme*), 디페탈로네마(*Dipetalonema*), 디필로보트리움(*Dipyllobothrium*), 디로필라리아(*Dirofilaria*), 드라쿤쿨루스(*Dracunculus*), 엔테로비우스(*Enterobius*), 필라로이데스(*Filaroides*), 해모추스(*Haemonchus*), 헤테라키스(*Heterakis*), 라고칠라스카리스(*Lagochilascaris*), 로아(*Loa*), 만소넬라(*Mansonella*), 무엘레리우스(*Muellerius*), 네카토르(*Necator*), 네마토디루스(*Nematodirus*), 오에소파고스토뎀(*Oesophagostomum*), 오스테르타기아(*Ostertagia*), 옥시우리스(*Oxyuris*), 파라필라리아(*Parafilaria*), 파라스카리스(*Parascaris*), 피살롭테라(*Physaloptera*), 프로토스트롱기루스(*Protostrongylus*), 세타리아(*Setaria*), 스피로세르카(*Spirocerca*), 스테파노필라리아(*Stephanofilaria*), 스트롱기로이데스(*Strongyloides*), 스트롱기루스(*Strongylus*), 테라지아(*Thelazia*), 톡사스카리스(*Toxascaris*), 톡소카라(*Toxocara*), 트리치넬라(*Trichinella*), 트리코네마(*Trichonema*), 트리초스트롱기루스(*Trichostrongylus*), 트리추리스(*Trichuris*), 운시나리아(*Uncinaria*) 및 우체레리아(*Wuchereria*).
- [0278] 상기 중에서, 상기에 언급된 동물에 감염하는 선충류의 가장 일반적인 속은 해모추스, 트리코스트롱기루스, 오스테르타기아, 네마토디루스, 쿠페리아, 아스카리스, 부노스토뎀, 오에소파고스토뎀, 차베르티아, 트리추리스, 스트롱기루스, 트리초네마, 디티오키우루스, 카필라리아, 헤테라키스, 톡소카라, 아스카리디아, 옥시우리스, 안실로스토마, 운시나리아, 톡사스카리스 및 파라스카리스이다. 이들 중 소정의 것, 예를 들어, 네마토디루스, 쿠페리아 및 오에소파고스토뎀은 주로 장관을 공격하는 반면, 다른 것들, 예를 들어, 해모추스 및 오스테르타기아는 위에 더 퍼져 있고, 한편, 디티오키우루스와 같은 다른 것들은 폐에서 발견된다. 또 다른 기생충들은 심장과 혈관, 피하 및 림프 조직 등과 같은 다른 조직에 위치할 수 있다.
- [0279] 본 발명의 화합물에 의해 그리고 본 발명의 방법에 의해 치료될 것으로 생각되는 흡충류는 제한없이 하기 속을 포함한다: 알라리아(*Alaria*), 파스시올라(*Fasciola*), 나노피에투스(*Nanophyetus*), 오피스토르치스(*Opisthorchis*), 파라고니무스(*Paragonimus*) 및 스킴스토소마(*Schistosoma*).
- [0280] 본 발명의 화합물에 의해 그리고 본 발명의 방법에 의해 치료될 것으로 생각되는 촌충류는 제한없이 하기 속을 포함한다: 디필로보트리움, 디플리디움(*Diplydium*), 스피로메트라(*Spirometra*) 및 타에니아(*Taenia*).
- [0281] 사람의 위장관의 기생충의 가장 일반적인 속은 안실로스토마, 네카토르, 아스카리스, 스트롱기로이데스, 트리치넬라(*Trichinella*), 카필라리아, 트리추리스 및 엔테로비우스이다. 위장관 바깥의 다른 조직 및 기관 또는 혈액에서 발견되는 의학적으로 중요한 다른 기생충 속으로는 사상충, 예를 들어 우체레리아, 브루기아, 온코세르카(*Onchocerca*) 및 로아와, 드라쿤쿨루스 및 장외 단계의 장내 기생충 스트롱기로이데스 및 트리치넬라가 있다.
- [0282] 많은 다른 연충 속 및 종이 당업계에 알려져 있으며, 또한 화학식 1의 화합물에 의해 치료될 것으로 생각된다. 이들은 문헌[Textbook of Veterinary Clinical Parasitology, Volume 1, Helminths, E. J. L. Soulsby, F. A. Davis Co., Philadelphia, Pa.]; 문헌[Helminths, Arthropods and Protozoa, (6th Edition of Monnig's Veterinary Helminthology and Entomology), E. J. L. Soulsby, The Williams and Wilkins Co., Baltimore, Md]에 매우 상세히 열거된다.
- [0283] 화학식 1의 화합물은 많은 동물 외부 기생충(예를 들어, 포유류와 조류의 절지 동물 외부기생충)에 대해 효과적이다.

- [0284] 곤충 및 진드기 해충은 예를 들어, 무는 곤충, 예를 들어, 파리 및 모기, 좀진드기, 진드기, 이, 벼룩, 홍줄노린재(true bugs), 기생 구더기 등을 포함한다.
- [0285] 성체 파리는 예를 들어, 뿔파리 또는 헤마토비아 이리탄스(Haematobia irritans), 쇠등에 또는 타바누스(Tabanus) 종, 침파리 또는 스톱목시스 칼시트란스(Stomoxys calcitrans), 먹파리 또는 시물리움(Simulium) 종, 사슴 파리 또는 크리옵스(Chrysops) 종, 이파리 또는 멜로파구스 오비누스(Melophagus ovinus), 및 체체 파리 또는 글로시나(Glossina) 종을 포함한다. 기생 파리 구더기는 예를 들어, 말파리(오에스트루스 오비스(Oestrus ovis) 및 쿠테레브라(Cuterebra) 종), 검정파리 또는 파에니시아(Phaenicia) 종, 나사벌레 또는 코칠리오미아 호미니보락스(Cochliomyia hominivorax), 쇠파리 또는 하이포데르마(Hypoderma) 종, 양털벌레(fleeceworm) 및 말의 가스트로필루스(Gastrophilus)를 포함한다. 모기는 예를 들어, 쿠렉스(Culex) 종, 아노켈레스(Anopheles) 종 및 아에데스(Aedes) 종을 포함한다.
- [0286] 좀진드기는 메소스티그마타(Mesostigmata) 종, 예를 들어, 닭 좀진드기, 데르마니수스 갈리네(Dermanyssus gallinae)와 같은 메소스티그마티드(mesostigmatid); 움벌레(itch mite) 또는 개선충(scab mite), 예를 들어, 사르콥티데(Sarcoptidae) 종, 예를 들어, 사르콥테스 스카비에이(Sarcoptes scabiei); 움진드기, 예를 들어, 코리옵테스 보비스(Chorioptes bovis) 및 프소롭테스 오비스(Psoroptes ovis)를 비롯한 프소롭티데(Psoroptidae) 종; 털진드기, 예를 들어, 트롬비쿨리데(Trombiculidae) 종, 예를 들어, 북아메리카 털진드기(North American chigger), 트롬비쿨라 알프레드두게시(Trombicula alfreddugesi)를 포함한다.
- [0287] 진드기는 예를 들어, 아르가시데(Argasidae) 종, 예를 들어, 아르가스(Argas) 종 및 오르니토도로스(Ornithodoros) 종을 비롯한 연진드기(soft-bodied tick); 익소디데(Ixodidae) 종, 예를 들어, 리피세팔루스 산귀네우스(Rhipicephalus sanguineus), 데르마센토르 바리아빌리스(Dermacentor variabilis), 데르마센토르 안테르소니(Dermacentor andersoni), 암블리움마 아메리카눔(Amblyomma americanum), 익소데스 스카폴라리스(Ixodes scapularis) 및 기타 리피세팔루스 종 (이전의 부필루스(Boophilus) 속 포함)을 비롯한 참진드기(hard-bodied tick)를 포함한다.
- [0288] 이는 예를 들어, 흡혈 이(sucking lice), 예를 들어, 메노폰(Menopon) 종 및 보비콜라(Bovicola) 종; 무는 이, 예를 들어, 헤마토피누스(Haematopinus) 종, 리노그나투스(Linognathus) 종 및 솔레노포테스(Solenopotes) 종을 포함한다.
- [0289] 벼룩은 예를 들어, 스테노세팔리데스(Ctenocephalides) 종, 예를 들어, 개 벼룩(스테노세팔리데스 카니스(Ctenocephalides canis)) 및 고양이 벼룩(스테노세팔리데스 펠리스(Ctenocephalides felis)); 제놉실라(Xenopsylla) 종, 예를 들어, 열대 쥐 벼룩(oriental rat)(제놉실라 체오피스(Xenopsylla cheopis)); 및 풀렉스(Pulex) 종, 예를 들어, 사람 벼룩(풀렉스 이리탄스(lex irritans))를 포함한다.
- [0290] 홍줄노린재는 예를 들어, 빈대과, 또는 예를 들어, 일반적인 빈대류(bed bug)(시멕스 렉투라리우스(Cimex lectularius)); 흡혈 곤충으로도 알려진 트리아토미드 버그(triatomid bug)를 비롯한 트리아토미네(Triatominae) 종; 예를 들어, 로드니우스 프롤릭서스(Rhodnius prolixus) 및 트리아토마(Triatoma) 종을 포함한다.
- [0291] 일반적으로, 파리, 벼룩, 이, 모기, 각다귀, 진드기, 좀진드기 및 연충은 가축 및 반려 동물 분야에 엄청난 손실을 야기한다. 절지 동물 기생충은 또한 사람에게 폐가 되며 사람과 동물에서 질환-야기 유기체의 매개체가 될 수 있다.
- [0292] 많은 다른 무척추 기생 해충이 당업계에서 알려져 있으며, 또한 화학식 1의 화합물에 의해 치료될 것으로 생각된다. 이들은 문헌[Medical and Veterinary Entomology, D. S. Kettle, John Wiley & Sons, New York and Toronto; Control of Arthropod Pests of Livestock: A Review of Technology, R. O. Drummand, J. E. George, and S. E. Kunz, CRC Press, Boca Raton, Fla]에 매우 상세하게 열거된다.
- [0293] 특히, 화학식 1의 화합물은 스톱목시스 칼시트란스(침파리)를 비롯한 외부기생충; 진드기, 예를 들어 익소데스 종, 부필루스 종, 리피세팔루스 종, 암블리움마 종, 데르마센토르 종, 히알로마(Hyalomma) 종 및 헤마토피알리스(Haemaphysalis) 종; 및 벼룩, 예를 들어, 크테노세팔리데스 펠리스(Ctenocephalides felis) (고양이 벼룩) 및 크테노세팔리데스 카니스(Ctenocephalides canis) (개 벼룩)에 대해 특히 효과적이다.
- [0294] 또한, 화학식 1의 화합물은 하기를 비롯한 외부기생충에 대해 효과적이다: 파리, 예를 들어, 헤마토비아(Haematobia) (립페로시아(Lyperosia)) 이리탄스(뿔파리), 시물리움 종 (먹파리), 글로시나 종 (체체파리), 히

드로타에아 이리탄스(*Hydrotaea irritans*) (머리 파리(head fly)), 무스카 아우툼날리스(*Musca autumnalis*) (얼굴 파리(face fly)), 무스카 도메스티카(*Musca domestica*) (집파리), 모렐리아 심플렉스(*Morellia simplex*) (스웨트 플라이(sweat fly)), 타바누스(*Tabanus*) 종 (쇠등에), 히포데르마 보비스(*Hypoderma bovis*), 히포데르마 리네아툼(*Hypoderma lineatum*), 루실리아 세리카타(*Lucilia sericata*), 루실리아 쿠프리나(*Lucilia cuprina*) (구리금파리(green blowfly)), 칼리포라(*Calliphora*) 종 (금파리), 프로토포르미아(*Protophormia*) 종, 오에스트루스 오비스(*Oestrus ovis*) (코 안 말파리(nasal botfly)), 쿨리코이데스(*Culicoides*) 종 (등에), 히포보스카 에퀴(*Hippobosca equine*), 가스트로필루스 인테스티날리스(*Gastrophilus instestinalis*), 가스트로필루스 해모로이달리스(*Gastrophilus haemorrhoidalis*) 및 가스트로필루스 나스리스(*Gastrophilus naslis*); 이, 예를 들어, 보비콜라(*Bovicola*) (다마리니아(*Damalinea*)) 보비스(*bovis*), 보비콜라 에퀴(*Bovicola equi*), 헤마토피누스 아시니(*Haematopinus asini*), 펠리콜라 서브로스트라투스(*Felicola subrostratus*), 헤테로독서스 스피니저(*Heterodoxus spiniger*), 리그노나투스 세토수스(*Lignonathus setosus*) 및 트리코덱테스 카니스(*Trichodectes canis*); 케드, 예를 들어, 멜로파구스 오비누스; 및 좀진드기, 예를 들어, 프소롭테스(*Psoroptes*) 종, 사르콕테스 스카베이(*Sarcoptes scabiei*), 코리옵테스 보비스(*Chorioptes bovis*), 데모덱스 에퀴(*Demodex equi*), 체일레티엘라(*Cheyletiella*) 종, 노토에드레스 카티(*Notoedres cati*), 트롬비쿨라(*Trombicula*) 종 및 오토덱테스 시아노티스(*Otodectes cyanotis*) (귀 진드기).

[0295] 다른 생물학적 활성 화합물 또는 제제가 화학식 1의 화합물과 동일한 또는 상이한 시점에 투여될 수 있다. 예를 들어, 그러한 화합물은 본 발명의 방법을 위한 화학식 1의 화합물의 조성물에서 유용한 조제일 수 있다. 하기에 나타낸 바와 같이, 그러한 생물학적 활성 화합물은 화학식 1의 화합물의 조성물에 포함될 수 있다. 본 발명에서 사용하기 위한 그러한 생물학적 활성 화합물은 유기인산염 살충제를 포함한다. 이 부류의 살충제는 살곤충제로서 매우 넓은 활성을 가지며, 소정의 경우에는 구충 활성을 갖는다. 유기인산염 살충제는 예를 들어, 디크로토포스, 터부포스, 디메토에이트, 디아지논, 디설펜트, 트리클로르폰, 아진포스-메틸, 클로르피리포스, 말라티온, 옥시데메톤-메틸, 메타미도포스, 아세페이트, 에틸 파라티온, 메틸 파라티온, 메빈포스, 포레이트, 카르보펜티온 및 포살론을 포함한다. 또한, 본 발명의 방법을 위한 화학식 1의 화합물의 조성물은 예를 들어, 카르바릴, 카르보푸란, 알다카르브, 몰리네이트, 메토밀, 카르보푸란 등을 비롯한 카르바메이트계 살충제뿐만 아니라 유기염소계 살충제와의 조합도 포함하는 것으로 생각된다. 화학식 1의 화합물의 조성물은 또한 방충제, 피레트린(및 그 합성 변이체, 예를 들어, 알레트린, 레스메트린, 페메트린, 트랄로메트린), 및 살비제로 흔히 이용되는 니코틴을 비롯한 생물학적 살충제와의 조합을 포함하는 것으로 생각된다. 기타 생각되는 조합은 바실러스 투린지엔시스, 클로로벤질레이트, 포름아미딘(예를 들어, 아미트라즈), 구리 화합물(예를 들어, 수산화구리 및 제2구리 옥시클로라이드 설페이트), 사이플루트린, 사이페메트린, 디코폴, 엔도설판, 에스펜발레레이트, 펜발레레이트, 람다-사이할로트린, 메톡시클로르 및 황을 비롯한 여러가지 종류의 살충제와의 조합이다.

[0296] 예를 들어, 아베르멕틴(예를 들어, 이베르멕틴, 목시덱틴, 밀베마이신), 벤즈이미다졸(예를 들어, 알벤다졸, 트리클라벤다졸), 살리실아닐리드(예를 들어, 클로산텔, 옥시클로자니드), 치환된 페놀(예를 들어, 니트록시닐), 피리미딘(예를 들어, 피란텔), 이미다조디아졸(예를 들어, 레바미솔) 및 프라지퀀텔과 같은 공지의 구충제로부터 선택된 추가의 생물학적 활성 화합물 또는 제제가 주목된다.

[0297] 본 발명의 방법을 위한 화학식 1의 화합물의 조성물에 유용한 다른 생물학적 활성 화합물 또는 제제는 곤충 성장 조절제(Insect Growth Regulator, IGR) 및 유충 호르몬 유사체(Juvenile Hormone Analogue, JHA), 예를 들어, 디플루벤주론, 트리플루무론, 플루아주론, 사이로마진, 메토프렌 등으로부터 선택되고 그럼으로써 동물 대상 및 동물 대상의 환경 내에서 (알을 비롯한 곤충 발생의 모든 단계에서) 기생충의 초기 방제 및 지속적인 방제를 제공할 수 있다.

[0298] 아베르멕틴 부류의 항기생충 화합물로부터 선택된 본 발명의 방법을 위한 화학식 1의 화합물의 조성물에 유용한 생물학적 활성 화합물 또는 제제가 주목된다. 상기한 바와 같이, 아베르멕틴 부류의 화합물은 포유류에서 넓은 범위의 내부기생충과 외부기생충에 대해 유용한 것으로 알려진 매우 강력한 항기생충제를 포함한다.

[0299] 본 발명의 범주 내에서 사용하기에 바람직한 화합물은 이베르멕틴이다. 이베르멕틴은 아베르멕틴의 반합성 유도체이며 일반적으로 적어도 80%의 22,23-다이하이드로아베르멕틴 B_{1a}와 20% 미만의 22,23-다이하이드로아베르멕틴 B_{1b}의 혼합물로서 생성된다. 이베르멕틴은 미국 특허 제4,199,569호에 개시된다.

[0300] 아바멕틴은 미국 특허 제4,310,519호에서 아베르멕틴 B_{1a}/B_{1b}로 개시되는 아베르멕틴이다. 아바멕틴은 적어도 80%의 아베르멕틴 B_{1a}와 20% 이하의 아베르멕틴 B_{1b}를 함유한다.

- [0301] 다른 바람직한 아베르펙틴은 25-사이클로헥실-아베르펙틴 B₁로도 알려진 도라펙틴이다. 도라펙틴의 구조와 제조는 미국 특허 제5,089,480호에 개시된다.
- [0302] 다른 바람직한 아베르펙틴은 목시펙틴이다. LL-F28249 알파로도 알려진 목시펙틴은 미국 특허 제4,916,154호로부터 공지되어 있다.
- [0303] 다른 바람직한 아베르펙틴은 셀라펙틴이다. 셀라펙틴은 25-사이클로헥실-25-데(1-메틸프로필)-5-데옥시-22,23-다이하이드로-5-(하이드록시이미노)-아베르펙틴 B₁ 단당류이다.
- [0304] 밀베마이신, 또는 B41은 스트렙토마이세스(*Streptomyces*)의 밀베마이신-생산 주의 발효액으로부터 분리된 물질이다. 미생물, 발효 조건 및 분리 절차는 미국 특허 제3,950,360호 및 제3,984,564호에 개시된다.
- [0305] 미국 특허 제5,288,710호와 제5,399,717호에 개시된 바와 같이 제조될 수 있는 에마펙틴 (4"-데옥시-4"-에피-메틸아미노아베르펙틴 B₁)은 두 가지 동족체인 4"-데옥시-4"-에피-메틸아미노아베르펙틴 B_{1a}와 4"-데옥시-4"-에피-메틸아미노아베르펙틴 B_{1b}의 혼합물이다. 바람직하게는, 에마펙틴의 염이 이용된다. 본 발명에 사용될 수 있는 에마펙틴의 염의 비제한적인 예는 미국 특허 제5,288,710호에 개시된 염, 예를 들어, 벤조산, 치환된 벤조산, 벤젠설폰산, 시트르산, 인산, 타르타르산, 말레산 등으로부터 유도된 염을 포함한다. 가장 바람직하게는, 본 발명에 사용된 에마펙틴 염은 에마펙틴 벤조산염이다.
- [0306] 에프리노펙틴은 4"-에피-아세틸아미노-4"-데옥시-아베르펙틴 B₁로서 화학적으로 알려져 있다. 에프리노펙틴은 모든 소의 부류 및 연령 군에서 사용되도록 특별히 개발되었다. 이것은 내부 및 외부 기생충 둘 모두에 대해 넓은 범위의 활성을 나타내면서 또한 고기와 밀크에서 최소의 잔류물을 남기는 최초의 아베르펙틴이었다. 이것은 국소적으로 전달될 때 매우 강력한 추가적인 이점을 갖는다.
- [0307] 본 발명의 방법을 위한 화학식 1의 화합물의 조성물은 선택적으로 하기 향기생충 화합물 중 하나 이상의 조합을 포함한다: 미국 특허 출원 공개 제2005/0182059 A1호에 개시된 이미다조[1,2-b]피리다진 화합물; 미국 특허 제7,361,689호에 개시된 1-(4-모노 및 다이-할로메틸설폰페닐)-2-아실아미노-3-플루오로프로판올 화합물; 미국 특허 제7,312,248호에 개시된 트라이플루오로메탄설폰아닐리드 옥심 에테르 유도체; 및 국제특허 공개 WO 2006/135648호에 개시된 n-[(페닐옥시)페닐]-1,1,1-트라이플루오로메탄설폰아미드 및 n-[(페닐설파닐)페닐]-1,1,1-트라이플루오로메탄설폰아미드 유도체.
- [0308] 화학식 1의 화합물의 조성물은 또한 디스토마 구충제(flukicide)를 추가로 포함할 수 있다. 적합한 디스토마 구충제는 예를 들어, 트라이클라벤다졸, 펜벤다졸, 알벤다졸, 클로르수론 및 옥시벤다졸을 포함한다. 상기 조합은 추가로 항생제, 향기생충제 및 디스토마 구충제 활성 화합물의 조합을 포함할 수 있음이 이해될 것이다.
- [0309] 상기 조합 외에, 본 발명의 방법을 위한, 본 명세서에 개시된 화학식 1의 화합물의 조성물을, 다른 동물 건강용 의약품, 예를 들어, 미량 원소, 항염증제, 항감염제, 호르몬, 방부제 및 소독제를 비롯한 피부과학적 제제, 및 질환 예방을 위한 백신 및 항혈청과 같은 면역생물학적 물질과 함께 제공하는 것이 또한 고려된다.
- [0310] 예를 들어, 그러한 항감염제는 예를 들어, 조합된 조성물로 및/또는 별도의 투여 형태로, 본 발명의 방법을 이용한 치료 동안 선택적으로 공동 투여되는 하나 이상의 항생제를 포함한다. 이 목적에 적합한 공지의 항생제는 예를 들어, 하기에 열거된 것들을 포함한다.
- [0311] 한 가지 유용한 항생제는 플로르페니콜이며 이는 D-(트레오)-1-(4-메틸설폰페닐)-2-다이클로로아세트아미도-3-플루오로-1-프로판올로도 알려져 있다. 다른 바람직한 항생제 화합물은 D-(트레오)-1-(4-메틸설폰페닐)-2-다이플루오로아세트아미도-3-플루오로-1-프로판올이다. 다른 유용한 항생제는 티암페니콜이다. 이들 항생제 화합물의 제조를 위한 방법, 및 그러한 방법에 유용한 중간체는 미국 특허 제4,31,857호; 제4,582,918호; 제4,973,750호; 제4,876,352호; 제5,227,494호; 제4,743,700호; 제5,567,844호; 제5,105,009호; 제5,382,673호; 제5,352,832호; 및 제5,663,361호에 개시된다. 다른 플로르페니콜 유사체 및/또는 전구약이 개시되었으며 그러한 유사체는 또한 본 발명의 조성물과 방법에 사용될 수 있다(예를 들어, 미국 특허 제7,041,670호 및 제7,153,842호 참조).
- [0312] 다른 유용한 항생제 화합물은 티미코신이다. 티미코신은 20-다이하이드로-20-데옥시-20-(시스-3,5-다이메틸피페리딘-1-일)-테스미코신으로 화학적으로 정의되는 마크로라이드 항생제이며 미국 특허 제4,820,695호에 개시된다.

- [0313] 본 발명에 사용하기에 유용한 다른 항생제는 투라트로마이신이다. 투라트로마이신은 미국 특허 제6,825,327호에 개시된 절차에 따라 제조될 수 있다.
- [0314] 본 발명에 사용하기 위한 추가의 항생제는 세팔로스포린, 예를 들어, 세프티오프르, 세프퀴논 등을 포함한다. 본 발명의 제형 중 세팔로스포린의 농도는 선택적으로 약 1 mg/ml 내지 500 mg/ml 사이에서 변한다.
- [0315] 다른 유용한 항생제는 플루오로퀴놀론, 예를 들어, 엔로플록사신, 다노플록사신, 디플록사신, 오르비플록사신 및 마르보플록사신을 포함한다. 엔로플록사신의 경우에, 이것은 약 100 mg/ml의 농도로 투여될 수 있다. 다노플록사신은 약 180 mg/ml의 농도로 존재할 수 있다.
- [0316] 다른 유용한 마크로라이드 항생제는 케토라이드 부류, 또는 더욱 구체적으로는 아자리드로부터의 화합물을 포함한다. 그러한 화합물은 예를 들어, 미국 특허 제6,514,945호; 제6,472,371호; 제6,270,768호; 제6,437,151호; 제6,271,255호; 제6,239,12호; 제5,958,888호; 제6,339,063호; 및 제6,054,434호에 개시된다.
- [0317] 다른 유용한 항생제는 테트라사이클린, 구체적으로는 클로르테트라사이클린 및 옥시테트라사이클린을 포함한다. 다른 항생제는 β -락탐, 예를 들어, 페니실린계, 예를 들어, 페니실린, 암피실린, 아목시실린, 또는 아목시실린과 클라불란산의 조합 또는 다른 베타 락타마아제 억제제를 포함할 수 있다.
- [0318] 본 발명의 처리법은 예를 들어, 정제, 캡슐, 드링크, 관주 제제, 과립, 페이스트, 볼루스, 관통 처치제(feed-through procedure) 또는 좌약 형태로 소화관내 투여에 의해; 또는 비경구 투여, 예를 들어, 주사(근육내, 피하, 정맥내, 복강내 포함), 또는 이식에 의해; 또는 비강 투여에 의해서와 같은 통상적인 수단에 의한 것이다.
- [0319] 화학식 1의 화합물은 조절 방출형으로, 예를 들어 피하 또는 경구 투여되는 서방성 제형으로 투여될 수 있다.
- [0320] 전형적으로, 본 발명에 따른 구충 조성물은 화학식 1의 화합물, 그의 N-산화물 또는 염과, 의도된 투여 경로(예를 들어, 경구, 또는 주사와 같은 비경구 투여)와 관련하여 그리고 표준 실무에 따라 선택된 부형제와 보조제를 포함하는 하나 이상의 약학적 또는 수의학적으로 허용가능한 담체의 혼합물을 포함한다. 또한, 적합한 담체는 pH 및 수분 함량에 대한 안정성과 같은 고려사항을 비롯하여, 조성물 중의 하나 이상의 활성 성분과의 상용성을 기준으로 선택된다. 따라서 구충적 유효량의 화학식 1의 화합물과 적어도 하나의 담체를 포함하는, 무척추 기생 해충으로부터 동물을 보호하기 위한 조성물이 주목된다.
- [0321] 정맥내, 근육내 및 피하 주사를 비롯한 비경구 투여의 경우, 화학식 1의 화합물은 유성 또는 수성 비히클 중의 현탁액, 용액 또는 에멀전으로 제형화될 수 있으며, 현탁제, 안정제 및/또는 분산제와 같은 조제를 함유할 수 있다. 화학식 1의 화합물은 또한 볼루스 주사 또는 연속 주입용으로 제형화될 수 있다. 주사용 약학 조성물은 바람직하게는 약학적 제형 분야에 알려진 다른 부형제 또는 보조제를 함유한 생리학적 상용성 완충액 중의 수용성 활성 성분 형태 (예를 들어, 활성 성분의 염)의 수성 용액을 포함한다. 부가적으로, 활성 화합물의 현탁액은 친유성 비히클에서 제조될 수 있다. 적합한 친유성 비히클은 지방 오일, 예를 들어, 참기름, 합성 지방산 에스테르, 예를 들어, 에틸 올레에이트 및 트라이글리세라이드, 또는 리포솜과 같은 물질을 포함한다. 수성 주사 현탁액은 소듐 카르복시메틸 셀룰로오스, 소르비톨, 또는 텍스트란과 같은 현탁액의 점도를 증가시키는 물질을 함유할 수 있다. 주사용 제형은 단위 투여 형태로, 예를 들어, 앰플 또는 다중-용량 용기로 제공될 수 있다. 대안적으로, 활성 성분은 적합한 비히클, 예를 들어, 살균된 발열성 물질 제거수로 사용전에 구성하기 위한 분말 형태일 수 있다.
- [0322] 상기에 개시된 제형 외에, 화학식 1의 화합물은 또한 저장(depot) 제제로서 제형화될 수 있다. 그러한 장기 작용성 제형은 (예를 들어, 피하로 또는 근육 내로) 이식에 의해 또는 근육내 또는 피하 주사에 의해 투여될 수 있다. 화학식 1의 화합물은 적합한 중합체성 또는 소수성 물질(예를 들어, 약리학적으로 허용가능한 오일과의 에멀전으로)을 이용하여, 이온 교환 수지를 이용하여, 또는 난용성 유도체로서, 예를 들어 제한없이, 난용성 염으로서 이 투여 경로용으로 제형화될 수 있다.
- [0323] 흡입에 의한 투여를 위해, 화학식 1의 화합물은 가압 팩 또는 연무기와 적합한 추진제, 예를 들어, 제한없이, 다이클로로다이플루오로메탄, 트라이클로로플루오로메탄, 다이클로로테트라플루오로에탄 또는 이산화탄소를 이용하여 에어로졸 스프레이의 형태로 전달될 수 있다. 가압된 에어로졸의 경우, 투여 단위는 계량된 양을 전달하기 위하여 밸브를 제공함으로써 제어될 수 있다. 흡입기 또는 취입기에서 사용하기 위한, 예를 들어, 젤라틴의 캡슐 및 카트리지가 제형화될 수 있으며, 이는 본 화합물과 락토스 또는 전분과 같은 적합한 분말 베이스의 분말 믹스를 함유한다.

- [0324] 놀랍게도, 화학식 1의 화합물은 경구 투여와 섭취로부터 전신적으로 이용가능한 유리한 약물동태학적 및 약물동력학적 특성을 갖는 것으로 밝혀졌다. 따라서 보호될 동물에 의해 섭취된 후, 혈류 내의 구충적 유효 농도의 화학식 1의 화합물은 벼룩, 진드기 및 이와 같은 흡혈성 해충으로부터 처리된 동물을 보호한다. 따라서, 경구 투여를 위한 형태(즉, 구충적 유효량의 화학식 1의 화합물 외에, 경구 투여에 적합한 결합제와 충전제 및 사료 농축물 담체로부터 선택된 하나 이상의 담체를 포함함)의 무척추 기생 해충으로부터 동물을 보호하기 위한 조성물이 주목된다.
- [0325] 용액(흡수용으로 가장 쉽게 이용가능한 형태), 에멀전, 현탁액, 페이스트, 젤, 캡슐, 정제, 불루스, 분말, 과립, 반추-유지 및 사료/물/리크 블록(lick block) 형태의 경구 투여의 경우, 화학식 1의 화합물은 경구 투여 조성물에 적합한 것으로 당업계에 공지된 결합제/충전제, 예를 들어, 당 및 당 유도체(예를 들어, 락토스, 수크로스, 만니톨, 소르비톨), 전분(예를 들어, 옥수수 전분, 밀 전분, 쌀 전분, 감자 전분), 셀룰로오스 및 유도체(예를 들어, 메틸셀룰로오스, 카르복시메틸셀룰로오스, 에틸하이드록시셀룰로오스), 단백질 유도체(예를 들어, 제인, 젤라틴), 및 합성 중합체(예를 들어, 폴리비닐 알코올, 폴리비닐피롤리돈)와 함께 제형화될 수 있다. 원할 경우, 윤활제(예를 들어, 스테아르산마그네슘), 붕해제(예를 들어, 가교결합된 폴리비닐피롤리돈, 한천, 알긴산) 및 염료 또는 안료가 첨가될 수 있다. 페이스트 및 젤은 흔히 또한 유착제(예를 들어, 아카시아, 알긴산, 벤토나이트, 셀룰로오스, 잔탄 고무, 콜로이드성 규산알루미늄 마그네슘)를 함유하여 조성물이 구강과 계속 접촉되게 하고 쉽게 배출되지 않게 하는 것을 돕는다.
- [0326] 바람직한 실시 형태는 저작성 및/또는 식용 제품(예를 들어, 저작성 트리트(treat) 또는 식용 정제)로 제형화된 본 발명의 방법의 조성물이다. 그러한 제품은 이상적으로는 보호될 동물이 선호하는 맛, 질감 및/또는 향기를 가져 화학식 1의 화합물의 경구 투여를 촉진할 것이다.
- [0327] 구충 조성물이 사료 농축물 형태이면, 담체는 전형적으로 고성능 사료, 사료 곡류 또는 단백질 농축물로부터 선택된다. 그러한 사료 농축물-함유 조성물은 구충 활성 성분 외에 동물 건강 또는 성장을 촉진하고, 도살용 동물로부터의 고기의 품질을 개선하거나, 또는 다르게는 축산업에 유용한 첨가제를 포함할 수 있다. 이들 첨가제는 예를 들어, 비타민, 항생제, 화학요법제, 정균제, 정진균제, 콕시듐 예방제(coccidiostat) 및 호르몬을 포함할 수 있다.
- [0328] 화학식 1의 화합물은 또한 예를 들어, 코코아 버터 또는 기타 글리세라이드와 같은 통상적인 좌약 베이스를 이용하여, 좌약 또는 정제관장제와 같은 직장 조성물로 제형화될 수 있다.
- [0329] 본 발명의 방법을 위한 제형은 산화방지제, 예를 들어, BHT (부틸화된 하이드록시톨루엔)를 포함할 수 있다. 산화방지제는 일반적으로 0.1-5% (wt/vol)의 양으로 존재한다. 제형의 일부는 특히 만일 스피노사드가 포함된다면 활성제를 용해시키기 위하여 가용화제, 예를 들어, 올레산을 필요로 한다. 이들 푸어-온(pour-on) 제형에서 사용되는 일반적인 전착제는 아이소프로필 미리스테이트, 아이소프로필 팔미테이트, 포화 C₁₂-C₁₈ 지방 알코올의 카프릴릭/카프릭산 에스테르, 올레산, 올레일 에스테르, 에틸 올레에이트, 트라이글리세라이드, 실리콘 오일 및 다이프로필렌 글리콜 메틸 에테르를 포함한다. 본 발명의 방법을 위한 푸어-온 제형은 공지된 기술에 따라 제조된다. 푸어-온 제형이 용액일 경우, 구충제/살곤충제는 필요하면 열과 교반을 이용하여, 담체 또는 비히클과 혼합된다. 보조 또는 추가 성분은 활성제와 담체의 혼합물에 첨가될 수 있거나, 또는 그들은 담체 첨가 전에 활성제와 혼합될 수 있다. 에멀전 또는 현탁액 형태의 푸어-온 제형은 공지된 기술을 사용하여 유사하게 제조된다.
- [0330] 상대적으로 소수성인 약학적 화합물을 위한 다른 전달 시스템이 이용될 수 있다. 리포솜과 에멀전은 소수성 약물을 위한 전달 비히클 또는 담체의 잘 알려진 예이다. 또한, 다이메틸설폭사이드와 같은 유기 용매가 필요하면 사용될 수 있다.
- [0331] 효과적인 무척추 기생 해충 방제에 필요한 적용률(즉, "살충적 유효량")은 방제될 무척추 기생 해충의 종, 해충의 생활 주기, 생활 단계, 그 크기, 위치, 1년 중 시기, 숙주 작물 또는 동물, 섭식 거동, 교미 거동, 주위 수분, 온도 등과 같은 인자에 의존할 것이다. 당업자는 원하는 무척추 기생 해충 방제 수준에 필요한 살충적 유효량을 쉽게 결정할 수 있다.
- [0332] 일반적으로 수의학적 용도의 경우, 화학식 1의 화합물 또는 조성물은 무척추 기생 해충으로부터 보호될 동물, 특히 온혈 동물에게 살충적 유효량으로 투여된다. 살충적 유효량은 표적 무척추 기생 해충의 출현 또는 활성을 감소시키는 관찰가능한 효과를 달성하는 데 필요한 활성 성분의 양이다. 당업자는 살충적 유효 용량이 본 발명의 방법에 유용한 다양한 화합물 및 조성물, 원하는 살충 효과 및 지속기간, 표적 무척추 기생 해충 종, 보호될

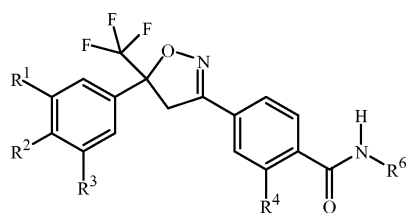
동물, 적용 양식 등에 따라 달라질 수 있으며, 특정 결과를 달성하기에 필요한 양은 간단한 실험을 통해 결정될 수 있음을 이해할 것이다.

[0333] 동물에의 경구 또는 비경구 투여의 경우, 적합한 간격으로 투여되는 본 발명의 화합물의 용량은 전형적으로 동물 체중 kg 당 약 0.01 mg 내지 약 100 mg 범위이며, 바람직하게는 약 0.01 mg 내지 약 30 mg 범위이다.

[0334] 동물에의 본 발명의 화합물의 투여를 위한 적합한 간격은 대략 매일 내지 대략 연 1회의 범위이다. 대략 매주 내지 대략 6개월마다 1회의 범위의 투여 간격이 주목된다. 월 1회 투여 간격(즉, 동물에게 화합물을 한달에 1회 투여함)이 특히 주목된다.

[0335] 하기 시험은 특정 해충에 대한 화학식 1의 화합물의 방제 효능을 보여준다. "방제 효능"은 유의하게 감소된 섭식을 야기하는 무척추 기생 해충 발생의 억제(사멸 포함)를 나타낸다. 그러나, 본 화합물에 의해 생기는 해충 방제 보호는 이들 중에 한정되지 않는다. 화합물 설명에 대해서는 인덱스 표 A 및 인덱스 표 B를 참조한다.

[0336] 인덱스 표 A



화합물	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	용점(°C)
1	Cl	H	Cl	CH ₃	CH ₂ (2-pyridinyl)	67-69
2	Cl	H	Cl	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
3	Cl	H	Cl	CH ₃	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
4	Cl	H	Cl	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
5	Cl	H	Cl	CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	*
6	Cl	H	Cl	CH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	*
7	Cl	H	Cl	F	CH ₂ (2-pyridinyl)	*
8	Cl	H	Cl	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	*
9	Cl	H	Cl	CH ₃	(R)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
10	Cl	H	Cl	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	*

* ¹H NMR 데이터에 대해서는 인덱스 표 B를 참조한다.

[0337]

[0338] 인덱스 표 B

화합물	¹ H NMR Data (CDCl ₃ solution unless indicated otherwise) ^a
2	δ 7.52 (m, 4H), 7.43 (m, 2H), 6.20 (br s, 1H), 4.08 (d, 1H), 3.72 (d, 1H), 3.66 (m, 2H), 2.76 (t, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.15 (s, 3H).
3	δ 7.43–7.54 (m, 6H), 6.99 (br t, 1H), 6.75 (br t, 1H), 4.21 (d, 2H), 4.08 (d, 1H), 3.95 (m, 2H), 3.70 (d, 1H), 2.47 (s, 3H).
4	δ 7.51 (m, 4H), 7.43 (m, 2H), 5.74 (br d, 1H), 4.08 (d, 1H), 3.70 (d, 1H), 2.60 (t, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.3 (d, 3H).
5	δ 7.5 (m, 4H), 7.43 (m, 1H), 7.0 (s, 1H), 6.84 (br s, 1H), 4.08 (d, 1H), 4.0 (m, 2H), 3.71 (d, 1H), 3.17 (m, 1H), 2.91 (m, 1H), 2.68 (s, 3H), 2.49 (s, 3H).
6	δ 7.5 (m, 4H), 7.43 (m, 2H), 7.0 (s, 1H), 6.58 (br s, 1H), 4.08 (d, 1H), 4.0 (m, 2H), 3.71 (d, 1H), 3.36 (m, 2H), 3.0 (s, 3H), 2.49 (s, 3H).
7	δ 8.6 (d, 1H), 8.2 (t, 1H), 8.1 (m, 1H), 7.7 (dt, 1H), 7.6–7.4 (m, 5H), 7.35 (d, 1H), 7.25 (m, 1H), 4.8 (d, 2H), 4.1 (d, 1H), 3.7 (d, 1H).
8	δ 7.5 (m, 4H), 7.43 (m, 2H), 5.75 (br s, 1H), 4.08 (d, 1H), 3.71 (d, 1H), 3.07 (s, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.51 (s, 6H).
9	δ 7.36–7.51 (m, 7H), 6.85 (dd, 1H), 4.83 (m, 1H), 4.09 (d, 1H), 3.88 (m, 2H), 3.71 (d, 1H), 2.40 (s, 3H), 1.51 (d, 3H).
10	δ 7.5 (m, 5H), 7.43 (s, 1H), 6.03 (br s, 1H), 4.08 (d, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.71 (d, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 1.69 (s, 6H).

^a ¹H NMR 데이터를 테트라메틸실란 아래쪽에서 ppm 단위로 보고함.
 커플링은 (s)-단일선, (d)-이중선, (t)-삼중선, (q)-사중선, (dd)-이중선의 이중선,
 (dt)-삼중선의 이중선, (br)-넓은 피크, (m)-다중선으로 표기함.

[0339]

[0340] 인덱스 표 A에 열거된 화합물의 제조 방법은 국제특허 공개 WO 2005/085216호에 개시되어 있다. 화학식 1의 화합물의 제조 방법을 교시하는 것이 필요할 경우 (그리고 이 방법이 본 명세서의 개시 내용과 불일치하지 않을 경우에만) 이 특허 공보는 본 명세서에 참고로 포함된다.

[0341] 본 발명의 생물학적 실시예

[0342] 시험 A

[0343] 고양이 벼룩(크테노세팔리데스 펠리스)의 방제를 평가함에 있어서, CD-1(등록상표) 생쥐(약 30 g, 수컷, 미국 매사추세츠주 윌밍턴 소재의 찰스 리버 래보러토리즈(Charles River Laboratories)로부터 입수)에게 프로필렌 글리콜/글리세롤 포르말(60:40) 중에 가용화된 10 mg/kg 양의 시험 화합물을 경구 투약하였다. 시험 화합물을 경구 투여한 지 2시간 후, 약 8 내지 16마리의 성체 벼룩을 각 생쥐에 적용하였다. 이어서 생쥐에 벼룩을 적용한 지 48시간 후에 벼룩을 사망률에 대해 평가하였다.

[0344] 시험된 화합물 중에서, 하기 화합물은 적어도 50%의 사망률로 이어졌다: 화합물 1, 화합물 2, 화합물 3 및 화합물 4.

[0345] 시험 B

[0346] 고양이 벼룩(크테노세팔리데스 펠리스)의 방제를 평가함에 있어서, CD-1(등록상표) 생쥐(약 30 g, 수컷, 미국 매사추세츠주 윌밍턴 소재의 찰스 리버 래보러토리즈(Charles River Laboratories)로부터 입수)에게 프로필렌 글리콜/글리세롤 포르말(60:40) 중에 가용화된 10 mg/kg 양의 시험 화합물을 경구 투약하였다. 시험 화합물을 경구 투여한 지 24시간 후, 약 8 내지 16마리의 성체 벼룩을 각 생쥐에 적용하였다. 이어서 생쥐에 벼룩을 적용한 지 48시간 후에 벼룩을 사망률에 대해 평가하였다.

[0347] 시험된 화합물 중에서, 하기 화합물은 적어도 20%의 사망률로 이어졌다: 화합물 1, 화합물 2 및 화합물 3. 하기 화합물은 적어도 50%의 사망률로 이어졌다: 화합물 2 및 화합물 3.

[0348] 시험 C

[0349] 고양이 벼룩(크테노세팔리데스 펠리스)의 방제를 평가함에 있어서, CD-1(등록상표) 생쥐(약 30 g, 수컷, 미국 매사추세츠주 윌밍턴 소재의 찰스 리버 래보러토리즈로부터 입수)에게 프로필렌 글리콜/글리세롤 포르말(60:40) 중에 가용화된 10 mg/kg 양의 시험 화합물을 피하 투약하였다. 시험 화합물을 피하 투여한 지 2시간 후, 약 8 내지 16마리의 성체 벼룩을 각 생쥐에 적용하였다. 이어서 생쥐에 벼룩을 적용한 지 48시간 후에 벼룩을 사망

물에 대해 평가하였다.

[0350] 시험된 화합물 중에서, 하기 화합물은 적어도 20%의 사망률로 이어졌다: 화합물 1, 화합물 2 및 화합물 3. 하기 화합물은 적어도 50%의 사망률로 이어졌다: 화합물 1 및 화합물 3.

[0351] 시험 D

[0352] 고양이 벼룩((크테노세팔리데스 펠리스)의 방제를 평가함에 있어서, 시험 화합물을 프로필렌 글리콜/글리세롤 포르말(60:40)에 가용화시키고 이어서 소 혈액에서 30 ppm의 최종 시험 비율로 희석시켰다. 처리된 혈액을 튜브 내에 두고, 튜브 바닥을 막으로 덮었다. 대략적으로 10마리의 고양이 벼룩 성체가 처리된 혈액 상의 막을 속속들이 먹게 하였다. 이어서, 72시간 후에 벼룩 성체를 사망률에 대해 평가하였다.

[0353] 시험된 화합물 중에서, 하기 화합물은 적어도 50%의 사망률로 이어졌다: 화합물 1, 화합물 2, 화합물 3, 화합물 5, 화합물 6, 화합물 7, 화합물 8, 화합물 9 및 화합물 10.