

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第4445751号
(P4445751)

(45) 発行日 平成22年4月7日 (2010.4.7)

(24) 登録日 平成22年1月22日 (2010.1.22)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 231/14 (2006.01)

C O 7 D 231/14

C O 7 D 401/14 (2006.01)

C O 7 D 401/14

C O 7 D 403/12 (2006.01)

C O 7 D 403/12

C O 7 D 413/14 (2006.01)

C O 7 D 413/14

A O 1 N 43/56 (2006.01)

A O 1 N 43/56

D

請求項の数 3 (全 182 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2003-521227 (P2003-521227)
 (86) (22) 出願日 平成14年8月12日 (2002.8.12)
 (65) 公表番号 特表2005-502661 (P2005-502661A)
 (43) 公表日 平成17年1月27日 (2005.1.27)
 (86) 国際出願番号 PCT/US2002/026968
 (87) 国際公開番号 W02003/016304
 (87) 国際公開日 平成15年2月27日 (2003.2.27)
 審査請求日 平成16年6月21日 (2004.6.21)
 (31) 優先権主張番号 60/312, 440
 (32) 優先日 平成13年8月15日 (2001.8.15)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(73) 特許権者 390023674
 イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・
 アンド・カンパニー
 E. I. DU PONT DE NEMO
 URS AND COMPANY
 アメリカ合衆国、デラウェア州、ウイلم
 ントン、マーケット・ストリート 100
 7
 (74) 代理人 100127926
 弁理士 結田 純次
 (74) 代理人 100140132
 弁理士 竹林 則幸
 (74) 代理人 100091731
 弁理士 高木 千嘉

最終頁に続く

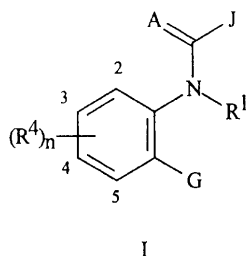
(54) 【発明の名称】 無脊椎有害生物を防除するための α -複素環式置換アリアルアミド

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】

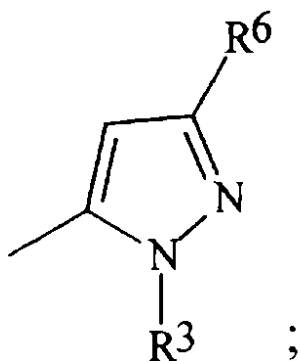


(式中、A は O であり；

G は場合により 1 つの C (=O) を環員として含む、5 員もしくは 6 員芳香族複素環または 5 員もしくは 6 員非芳香族複素環であり、各環は場合により 1 ~ 4 つの R² で置換され；

J は J - 5 であり；

【化 2】



J-5

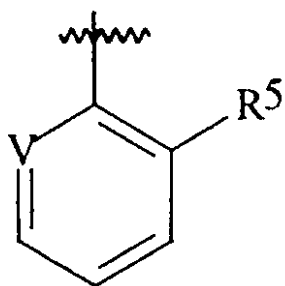
R^1 はHまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルであり；

R^2 はそれぞれ独立してH、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであり；あるいは

R^2 はそれぞれ独立してフェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシまたは5員もしくは6員芳香族複素環、ナフチル環系、または芳香族もしくは非芳香族8員、9員もしくは10員複素二環式縮合環系であって、各環または環系が R^5 から独立して選択される1～3つの置換基で置換され；

R^3 はH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、または

【化 3】



であり；

VはN、CH、CF、CCl、CBrまたはCIであり；

R^4 はそれぞれ独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、または $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであり；あるいは

R^4 はそれぞれ独立してフェニル、ベンジルまたはフェノキシ環であり、各環は R^5 から

独立して選択される 1～3 つの置換基で置換され；但し一つの R^4 基はフェニル環の 2 位で式 I の残部に結合し、該 R^4 基は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり；

R^5 はそれぞれ独立して H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_4 \sim C_7$ (アルキル) シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであり；

R^6 はそれぞれ独立して H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオであり；

n は 1 または 2 である)

の化合物、およびその N-オキシドおよびその塩。

【請求項 2】

生物学的に有効な量の請求項 1 に記載の化合物、その N-オキシドまたはその適切な塩と無脊椎有害生物またはその環境を接触させることを含んでなる無脊椎有害生物の防除方法。

【請求項 3】

生物学的に有効な量の請求項 1 に記載の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の更なる成分を含んでなる、無脊椎有害生物を防除するための組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、以下に列举する用途を含む農業用途および非農業用途に適した α -複素環式置換アリールアミド、それらの N-オキシド、塩および組成物と、農業環境および非農業環境の両方での無脊椎有害生物を防除するためのそれらの使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

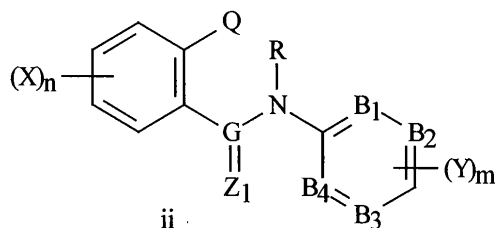
無脊椎有害生物防除は、高い収穫率を達成するのに非常に重要である。生育中の農作物および貯蔵農作物に対する無脊椎有害生物による被害によって、生産性が著しく低下し、その結果消費者に対するコストが高くなる。林業、温室作物、観賞植物、苗、貯蔵食品および繊維製品、家畜、家庭および公衆衛生および動物衛生における無脊椎有害生物防除もまた重要である。多くの製品がこれらの目的のために市販されているが、より効果的で、コストが低く、毒性が少なく、環境上安全なまたは異なる作用様式を有する新規な化合物が引き続き必要とされている。

【0003】

特許文献 1 には、殺虫剤として式 i i :

【0004】

【化 1】



【0005】

(式中、特にRが、H、アルキルまたはアルコシカルボニルであり；Xが、ハロ、C N、NO₂、C₃～C₆ハロシクロアルキルであり；Yが、ハロ、CN、NO₂、C₃～C₆ハロシクロアルキルであり；Z¹が、OまたはSであり；B₁～B₄が独立してNまたはCであり；mが1～5であり；nが0～4である)の2-ヘテロシクリルベンズアミド誘導体が開示されている。

10

【0006】

【特許文献1】国際公開第01/00593号パンフレット

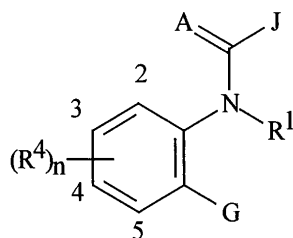
【発明の開示】

【0007】

本発明は、式I：

【0008】

【化 2】



I

20

30

【0009】

(式中、AはOまたはSであり；

GはC(=O)、SOまたはS(O)₂からなる群から独立して選択される1つまたは2つの環員を場合により含む、5員もしくは6員芳香族複素環または5員もしくは6員非芳香族複素環であり、各環が場合により1～4つのR²で置換され；

Jはそれぞれ独立してフェニル環、5員もしくは6員芳香族複素環または8員、9員もしくは10員炭素二環式もしくは複素二環式芳香族縮合環系であって、各環または環系が場合により1～4つのR³で置換され；

R¹はH；またはC₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニルまたはC₃～C₆シクロアルキルであり、それぞれが場合によりハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₂～C₄アルコシカルボニル、C₁～C₄アルキルアミノ、C₂～C₈ジアルキルアミノおよびC₃～C₆シクロアルキルアミノからなる群から独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換され；あるいは

40

R¹はC₂～C₆アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコシカルボニル、C₂～C₆アルキルアミノカルボニル、C₃～C₈ジアルキルアミノカルボニルまたはC(=A)Jであり；

R²またはR³はそれぞれ独立してH、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、ハロゲ

50

ン、CN、CO₂H、CONH₂、NO₂、ヒドロキシ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄アルキルアミノ、C₂～C₈ジアルキルアミノ、C₃～C₆シクロアルキルアミノ、C₂～C₆アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコキシカルボニル、C₂～C₆アルキルアミノカルボニル、C₃～C₈ジアルキルアミノカルボニルまたはC₃～C₆トリアルキルシリルであり；あるいは

R²またはR³はそれぞれ独立してフェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシまたは5員もしくは6員芳香族複素環、ナフチル環系、または芳香族もしくは非芳香族8員、9員もしくは10員複素二環式縮合環系であって、各環または環系がR⁵から独立して選択される1～3つの置換基で置換され；あるいは

2つのR³が隣接する炭素原子に結合する場合には一緒になって—OCF₂O—、—CF₂CF₂O—、または—OCF₂CF₂O—となることができ；

R⁴はそれぞれ独立してC₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄アルキルアミノ、C₂～C₈ジアルキルアミノ、C₃～C₆シクロアルキルアミノ、またはC₃～C₆トリアルキルシリルであり；あるいは

R⁴はそれぞれ独立してフェニル、ベンジルまたはフェノキシ環であり、各環がR⁵から独立して選択される1～3つの置換基で置換され；

R⁵はそれぞれ独立してH、C₁～C₄アルキル、C₂～C₄アルケニル、C₂～C₄アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₂～C₄ハロアルケニル、C₂～C₄ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄アルキルアミノ、C₂～C₈ジアルキルアミノ、C₃～C₆シクロアルキルアミノ、C₄～C₇(アルキル)シクロアルキルアミノ、C₂～C₄アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコキシカルボニル、C₂～C₆アルキルアミノカルボニル、C₃～C₈ジアルキルアミノカルボニルまたはC₃～C₆トリアルキルシリルであり；

nは1～4の整数である)

の化合物、およびそのN-オキシドおよびその塩に関する。

【0010】

本発明は、無脊椎有害生物またはその環境を生物学的に有効な量の式Iの化合物、そのN-オキシドまたはその化合物の適切な塩（例えば、本明細書に記載の組成物として）と接触させることを含んでなる無脊椎有害生物の防除方法にも関する。本発明は、無脊椎有害生物またはその環境を、生物学的に有効な量の式Iの化合物、そのN-オキシドまたはその適切な塩、あるいはその化合物、そのN-オキシドまたはその適切な塩を含んでなる組成物、および無脊椎有害生物を防除するための生物学的に有効な量の少なくとも1種のその他の化合物または薬剤と接触させる、かかる方法にも関する。

【0011】

本発明は、生物学的に有効な量の式Iの化合物、そのN-オキシドまたはその化合物の適切な塩、および界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種のその他の成分を含んでなる、無脊椎有害生物を防除するための組成物にも関する。本発明は、生物学的に有効な量の式Iの化合物、そのN-オキシドまたはその化合物の適切な塩、および有効量の少なくとも1種のその他の生物活性化合物または物質を含んでなる組成物にも関する。

【0012】

10

20

30

40

50

発明の詳細

上記の説明において、単独で、または「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」などの化合物の単語で使用される「アルキル」には、メチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピルなどの直鎖または分枝鎖アルキル、または異なるブチル、ペンチルまたはヘキシル異性体が含まれる。「アルケニル」には、1-プロペニル、2-プロペニルなどの直鎖または分枝鎖アルケン、および異なるブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体が含まれる。「アルケニル」には、1, 2-プロパジエニルおよび2, 4-ヘキサジエニルもまた含まれる。「アルキニル」には、1-プロピニル、2-プロピニルなどの直鎖または分枝鎖アルキン、および異なるブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体が含まれる。「アルキニル」には、2, 5-ヘキサジイニルなどの多重三重結合で構成される部分もまた含まれる。「アルコキシ」には、例えば、メトキシ、エトキシ、 n -プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、および異なるブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体が含まれる。「アルキルチオ」には、メチルチオ、エチルチオなどの分枝鎖または直鎖アルキルチオ部分、および異なるプロピルチオおよびブチルチオ異性体が含まれる。「シクロアルキル」には、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルが含まれる。「トリアルキルシリル」には、 $(\text{CH}_3)_3\text{Si}$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_3\text{Si}$ および $[(\text{CH}_3)_3\text{C}](\text{CH}_3)_2\text{Si}$ が含まれる。

【0013】

「芳香族」という用語は、その環の原子それぞれが本質的に同一平面にあり、環の面に対して p -軌道垂線を有し、 $(4n+2)\pi$ 電子 (n は 0 または正の整数である) がヒュッケル則に従って環と会合していることを示す。「芳香族環系」という用語は、多環式環系の少なくとも 1 つの環が芳香族である、完全に不飽和な炭素環および複素環を示す。芳香族炭素環式環または炭素二環式縮合環系には、完全に芳香族の炭素環、および多環式環系の少なくとも 1 つの環が芳香族である炭素環 (例えば、フェニル、ナフチルおよび 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル) が含まれる。「非芳香族炭素環式環」という用語は、完全飽和炭素環ならびに部分もしくは完全不飽和炭素環を示し、ヒュッケル則が環によって満たされていない。環または環系に関して「ヘテロ (hetero)」という用語は、少なくとも 1 つの環原子が炭素ではなく、かつ各環が窒素を 4 個以下、酸素を 2 個以下、硫黄を 2 個以下含有することを条件として、窒素、酸素、および硫黄からなる群から独立して選択されるヘテロ原子 1~4 個を含有し得る環または環系を意味する。「芳香族複素環または環系」および「芳香族複素二環式縮合環系」という用語には、完全に芳香族の複素環および多環式環系の少なくとも 1 つの環が芳香族である複素環が含まれる (芳香族とは、ヒュッケル則が満たされていることを意味する)。「非芳香族複素環式環または環系」という用語は、その環系の環のいずれによってもヒュッケル則が満たされていない完全飽和複素環ならびに部分または完全不飽和複素環を示す。複素環式環または環系は、いずれかの利用可能な炭素または窒素を介して、前記炭素または窒素上での水素に置換によって、結合させることができる。

【0014】

単独で、または「ハロアルキル」などの化合物の単語で使用される「ハロゲン」には、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素が含まれる。さらに、「ハロアルキル」などの化合物の単語で使用される場合には、前記アルキルは、同一または異なるハロゲン原子で一部または完全に置換されることができる。「ハロアルキル」の例としては、 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 および CF_3CCl_2 が挙げられる。「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」、「ハロアルコキシ」等は、「ハロアルキル」という用語と同様に定義される。「ハロアルケニル」の例としては、 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ および $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ が挙げられる。「ハロアルコキシ」の例としては、 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ が挙げられる。

【0015】

「アルキルカルボニル」の例としては、 $C(O)CH_3$ 、 $C(O)CH_2CH_2CH_3$ および $C(O)CH(CH_3)_2$ が挙げられる。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $CH_3OC(=O)$ 、 $CH_3CH_2OC(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2OC(=O)$ 、 $(CH_3)_2CHOC(=O)$ および異なるブトキシもしくはペントキシカルボニル異性体が挙げられる。「アルキルアミノカルボニル」の例としては、 $CH_3NHC(=O)$ 、 $CH_3CH_2NHC(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2NHC(=O)$ 、 $(CH_3)_2CHNHC(=O)$ および異なるブチルアミノもしくはペンチルアミノカルボニル異性体が挙げられる。「ジアルキルアミノカルボニル」の例としては、 $(CH_3)_2NC(=O)$ 、 $(CH_3CH_2)_2NC(=O)$ 、 $CH_3CH_2(CH_3)NC(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2(CH_3)NC(=O)$ および $(CH_3)_2CHN(CH_3)C(=O)$ が挙げられる。

10

【0016】

置換基中の炭素原子の総数は、「 $C_i \sim C_j$ 」（式中、 i および j は 1～8 の整数である）によって示される。例えば、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからプロピルスルホニルを表す。

【0017】

上記の説明において、式 I の化合物が複素環式環を含有する場合、すべての置換基が、いずれかの利用可能な炭素または窒素を介して、前記炭素または窒素上での水素の置換によってこの環に結合される。

【0018】

20

置換基の数が 1 を超え得ることを示す下付き文字を有する置換基で化合物が置換される場合、前記置換基（それらが 1 を超える場合）は、定義される置換基の群から独立して選択される。さらに、下付き文字が範囲、例えば $(R)_{i \sim j}$ を示す場合には、置換基の数は、 $i \sim j$ の整数から選択される。

【0019】

「場合により置換される」という用語は、基を置換しても、しなくてもよいことを意味する。「1～3 個の置換基で場合により置換される」等は、その基が未置換であるか、またはその利用可能な位置のうち 1～3 つが置換されてもよいことを意味する。基が、水素であることが可能である置換基、例えば R^1 または R^5 を含有する場合、次いで、この置換基が水素とすると、これは未置換である前記基に相当すると見なされる。

30

【0020】

本発明の化合物は、1 つまたは複数の立体異性体として存在し得る。種々の立体異性体には、鏡像異性体、ジアステレオマー、アトロプ異性体および幾何異性体が含まれる。当業者であれば、一方の立体異性体は、他方の立体異性体（1 つまたは複数）に対して強化されている場合、または他方の異性体（1 つまたは複数）から離れている場合、より活性であり、かつ／または有利な効果を示す場合があることは理解されよう。さらに、当業者には、前記立体異性体をどのように分離、強化、および／または選択的に製造するかは公知である。したがって、本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個々の立体異性体、または光学活性の状態として存在することが可能である。本発明の一部の化合物は、1 つまたは複数の互変異性体として存在することができ、かつかかる化合物のすべての互変異性型が本発明の一部である。したがって、本発明の化合物は、互変異性体の混合物または個々の互変異性体として存在することが可能である。

40

【0021】

本発明は、式 I、その N-オキシドおよびその農業的に適する塩から選択される化合物を含んでなる。当業者であれば、窒素は、その酸化物に酸化するために利用可能な孤立電子対を必要とするため、窒素含有複素環すべてが N-オキシドを形成するわけではないことは理解されよう；当業者であれば、N-オキシドを形成することができる窒素含有複素環を理解されよう。当業者であれば、第 3 級アミンが N-オキシドを形成することができることも理解されよう。複素環と第 3 級アミンとの N-オキシドを製造するための合成法は、当業者には非常によく知られており、過酢酸および m-クロロ過安息香酸 (MCPB

50

A) などのペルオキシ酸、過酸化水素、*t*-ブチルヒドロペルオキシドなどのアルキルヒドロペルオキシド、過ホウ酸ナトリウム、およびジメチルジオキシランなどのジオキシランを用いた複素環と第3級アミンの酸化が挙げられる。N-オキシドのこれらの製造方法は、文献に広範囲に記述かつ検討されている。例えば、T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol. 3, pp18-19, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 43, pp139-151, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 9, pp285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 22, pp390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Pressを参照のこと。

【0022】

本発明の化合物の塩には、無機または有機酸、例えば臭化水素酸、塩化水素酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸との酸付加塩が含まれる。本発明の化合物の塩には、化合物がカルボン酸またはフェノールなどの酸性基を含有する場合、有機塩基（例えば、ピリジン、アンモニア、またはトリエチルアミン）または無機塩基（例えば、ナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウムまたはバリウムの水素化物、水酸化物、または炭素塩）で形成される塩が含まれる。

【0023】

上記のように、 R^1 は（特に） $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであることが可能であり、それぞれが場合によりハロゲン、CN、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノおよび $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノからなる群から独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換される。これらの R^1 基に関して「場合により置換される」という用語は、未置換であるか、または少なくとも1つの非水素置換基を有する R^1 基を意味する。場合により置換される R^1 基の例としては、 R^1 基の炭素原子上の水素を、上記に列挙した置換基から独立して選択される1つまたは複数（特定の R^1 基での置換に利用可能な水素の総数まで）の置換基で置換することによって場合により置換される基である。これらの置換基は上記の例において列挙されているが、それらは任意の置換基であることから、存在する必要はないことに留意のこと。未置換である R^1 基は注目すべきである。1～5つの置換基で置換される R^1 基は注目すべきである。1つの置換基で置換される R^1 基もまた注目すべきである。

【0024】

上記のように、Jはそれぞれ独立してフェニル環、5員もしくは6員芳香族複素環または芳香族8員、9員もしくは10員炭素二環式もしくは複素二環式芳香族縮合環系であって、各環または環系が場合により1～4つの R^3 で置換される。これらのJ基に関して「場合により置換される」という用語は、未置換であるか、または少なくとも1つの非水素置換基を有する基を意味する。1～4つの R^3 で場合により置換されるフェニルの例としては、提示1においてU-1として示される環（ R^v は R^3 であり、 r は1～4の整数で

ある)が挙げられる。芳香族8員、9員または10員炭素二環式縮合環系の例としては、提示1にU-85として示される1~3つの R^3 で場合により置換されるナフチル基、および提示1にU-89として示される1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル基(R^v は R^3 であり、 r は1~4の整数である)が挙げられる。1~4つの R^3 で場合により置換される5員もしくは6員芳香族複素環の例としては、提示1に示されるU-2~U-53の環(R^v は R^3 であり、 r は1~4の整数である)が挙げられる。以下のJ-1~J-4もまた、5員もしくは6員芳香族複素環を示すことに留意のこと。U-2~U-20はJ-1の例であり、U-21~U-35およびU-40はJ-2の例であり、U-41~U-48はJ-3の例であり、U-49~U-53はJ-4の例であることに留意のこと。1~4つの R^3 で場合により置換される芳香族8員、9員または10員複素二環式縮合環系の例としては、提示1に示されるU-54~U-84(R^v は R^3 であり、 r は1~4の整数である)が挙げられる。

10

【0025】

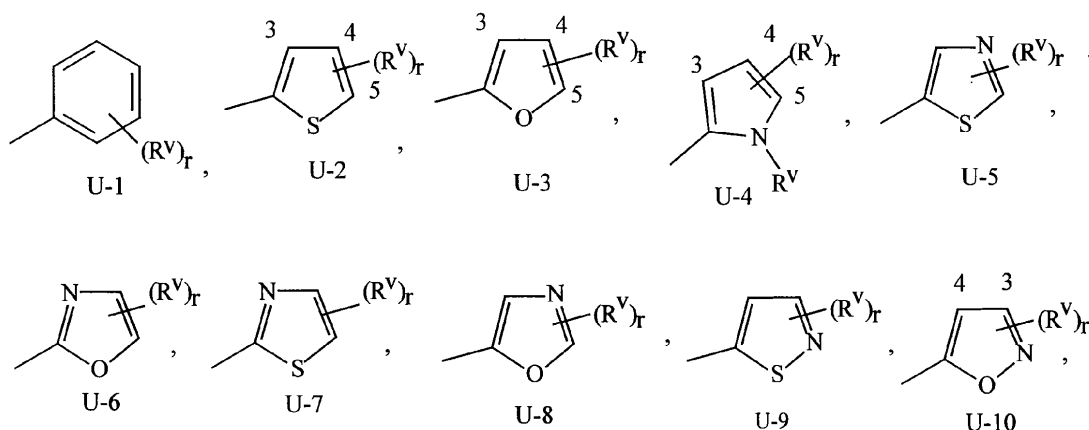
R^v 基は構造U-1~U-89で示されるが、それらは任意の置換基であることから、存在する必要はないことに留意のこと。原子に結合する場合、 R^v がHである場合には、これはあたかも前記原子が未置換であることと同じであることに留意のこと。それらの原子価を満たすために置換を必要とする窒素原子は、Hまたは R^v で置換される。一部のU基のみが、4個未満の R^v 基で置換することができる(例えば、U-14、U-15、U-18からU-21およびU-32からU-34のみが1つの R^v で置換することができる)ことに留意のこと。 $(R^v)_r$ とU基との間の結合ポイントが浮動として示されている場合、 $(R^v)_r$ はU基の利用可能ないずれかの炭素原子に結合することができることに留意のこと。U基上の結合ポイントが浮動として示される場合、U基は、水素原子の置換によって、そのU基の利用可能ないずれかの炭素を介して式Iの残部に結合することができることに留意のこと。

20

【0026】

【化3】

提示1

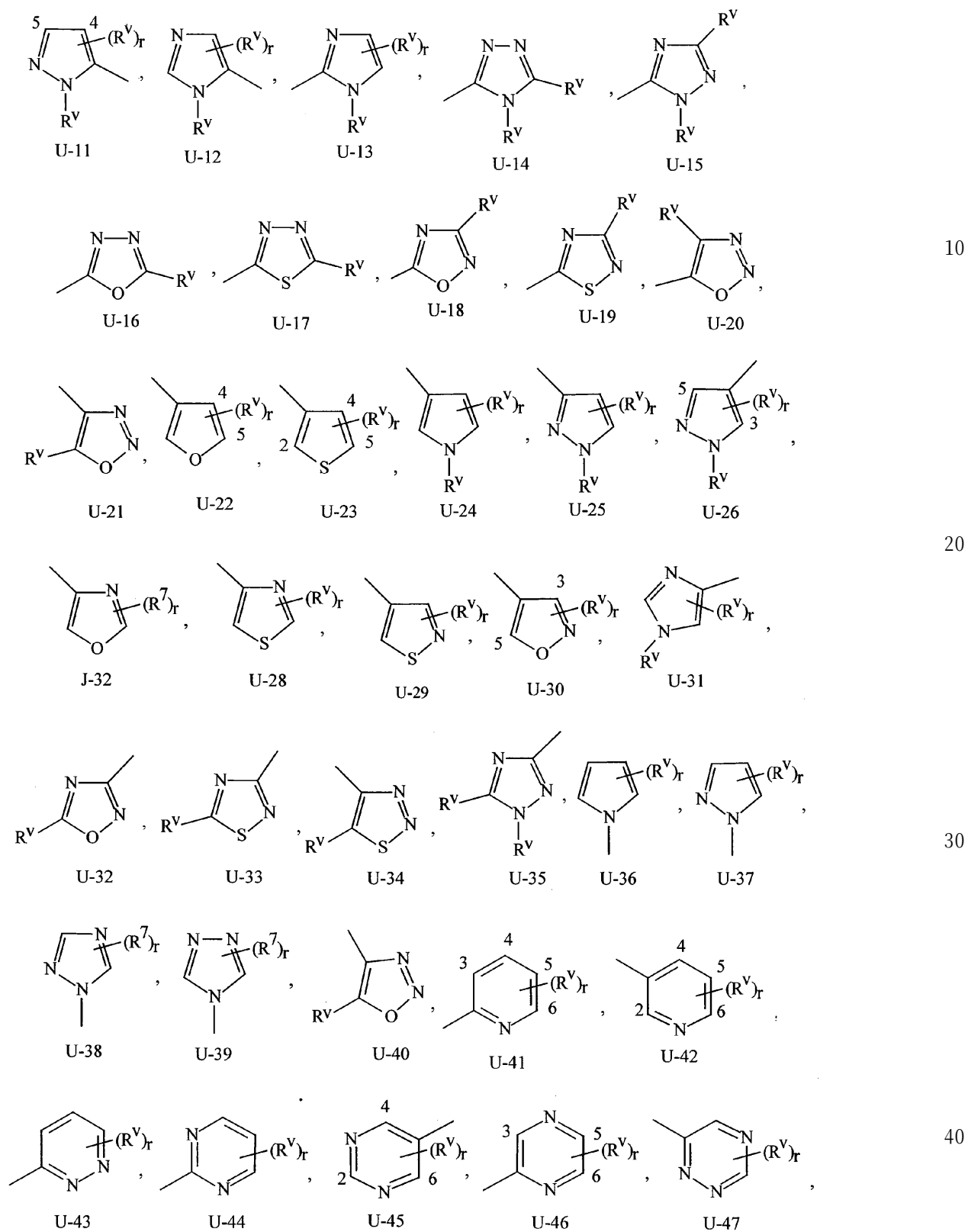


30

【0027】

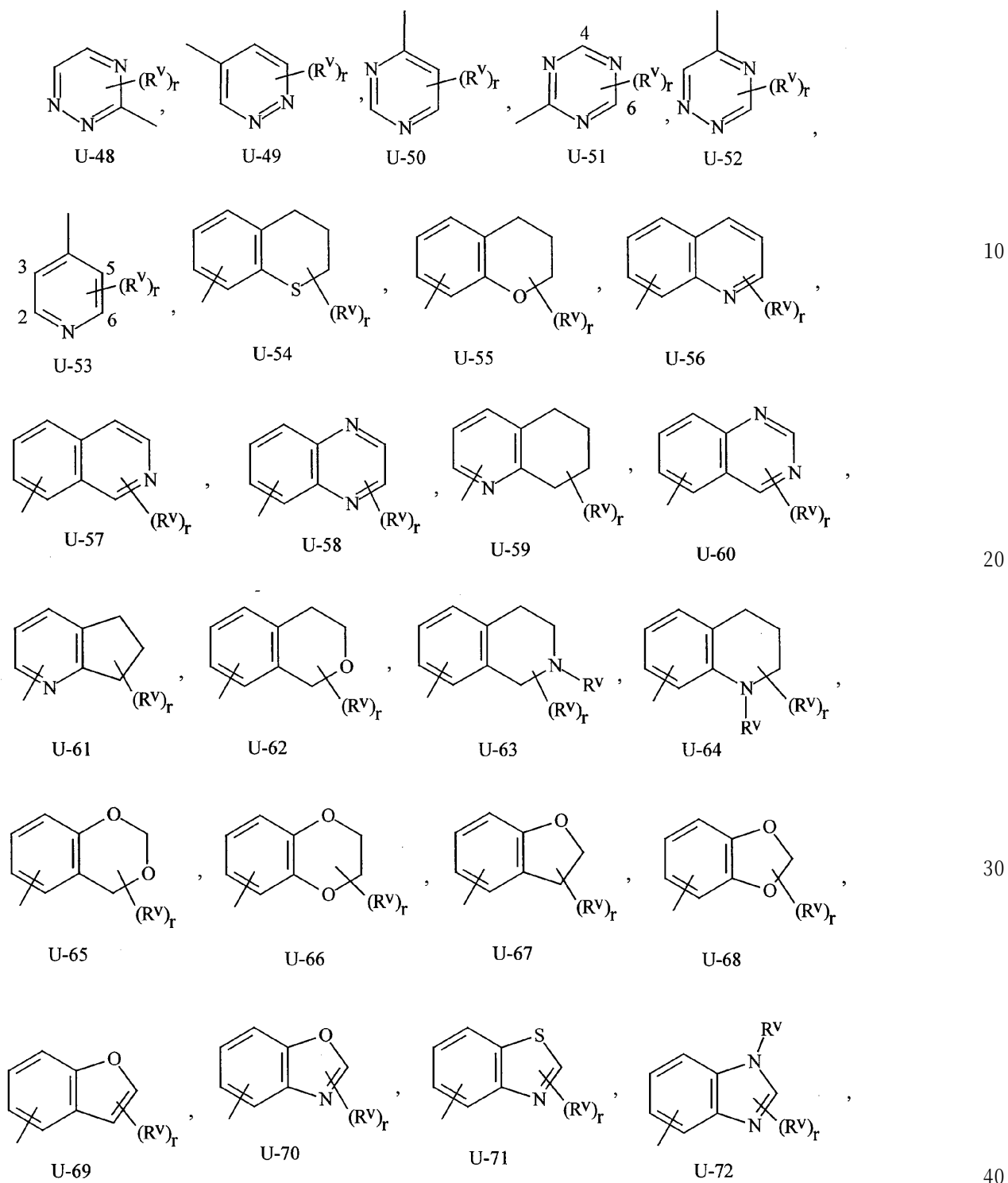
40

【化 4】



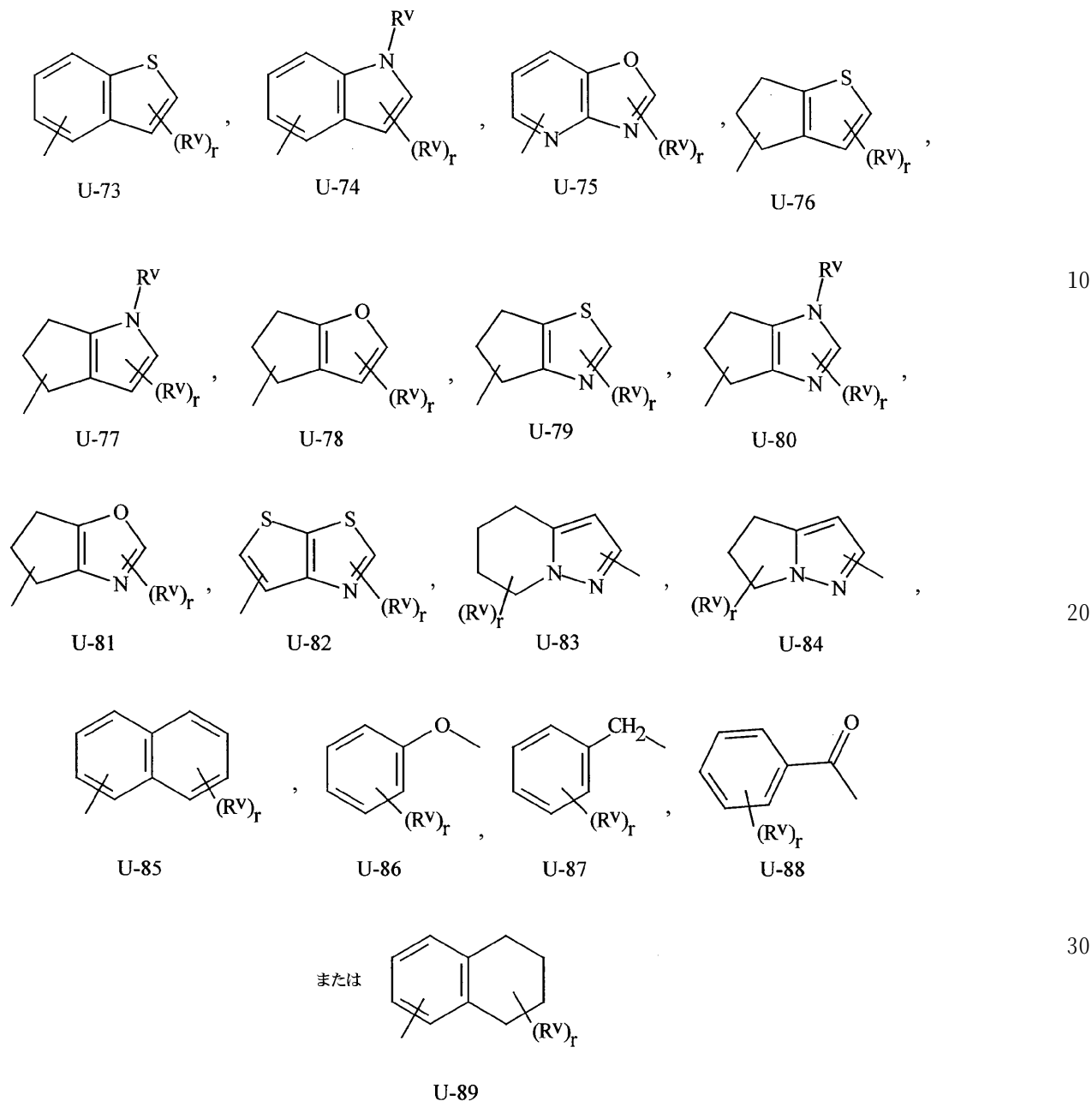
【 0 0 2 8 】

【化 5】



【 0 0 2 9 】

【化 6】



【0030】

上記のように、GはC(=O)、SOまたはS(O)₂からなる群から独立して選択される1つまたは2つの環員を場合により含む、5員もしくは6員芳香族複素環または5員もしくは6員非芳香族複素環式環であり、各環が場合により1～4つのR²で置換される。これらのG基に関して「場合により置換される」という用語は、未置換であるか、または少なくとも1つの非水素置換基を有する基を意味する。1～4つのR²で場合により置換される5員もしくは6員芳香族複素環の例としては、提示1に示される環U-2～U-53(R^vはR²であり、rは1～4の整数である)が挙げられる。以下のG-1～G-5もまた、5員もしくは6員芳香族複素環を示すことに留意のこと。U-2～U-20はG-1の例であり、U-21～U-35およびU-40はG-2の例であり、U-36～U-39はG-3の例であり、U-41～U-48はU-4の例であり、U-49～U-53はG-5の例であることに留意のこと。

【0031】

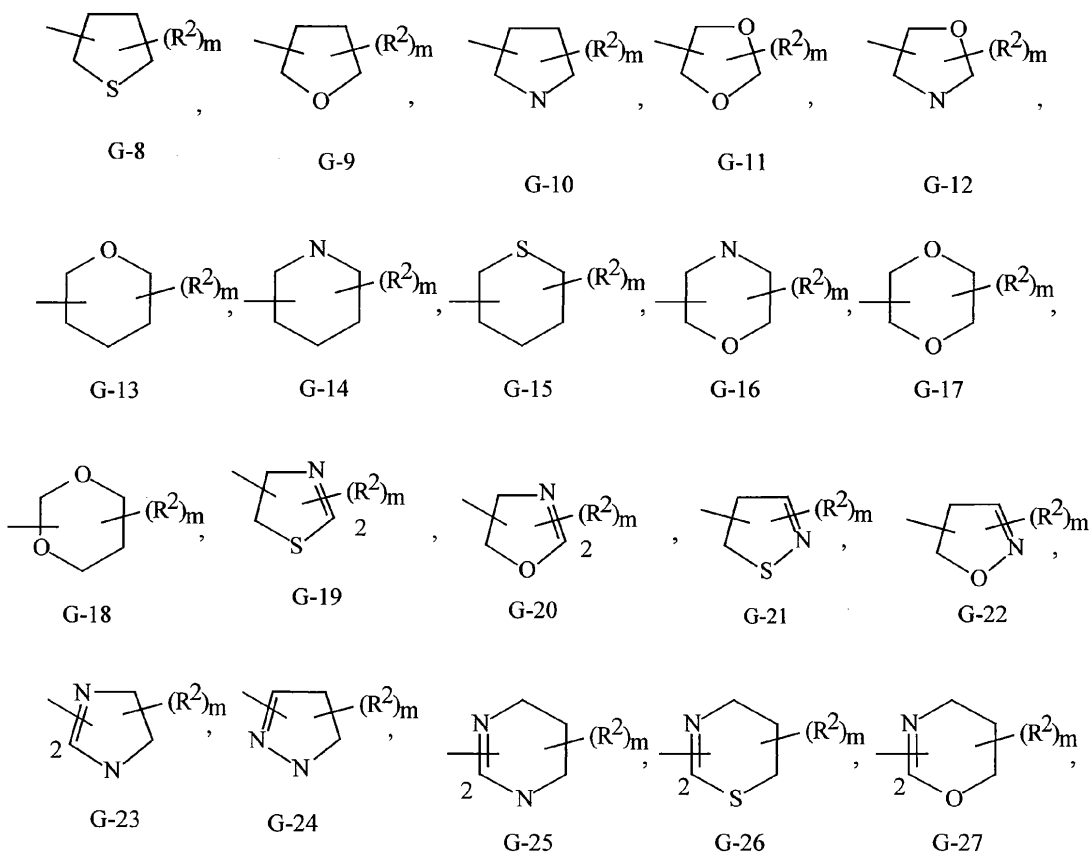
C(=O)、SOまたはS(O)₂からなる群から独立して選択される1つまたは2つ

の環員を含み、かつ1～4つの R^2 で場合により置換される、5員もしくは6員非芳香族複素環式環としてのGの例は提示2に示される。これらG基上の結合ポイントが浮動として示される場合、G基は、水素原子の置換によってG基の利用可能炭素または窒素を介して式Iの残部に結合することができることに留意のこと。その任意の置換基は、水素原子を置換することによって、利用可能な炭素または窒素に結合することができる。GがG-31からG-346およびG-39からG-42から選択される環を含んでなる場合、QはO、Sまたは NR^2 から選択されることに留意のこと。GがG-10、G-12、G-14、G-16、G-23、G-24、G-25、G-30～G-36およびG-39～G-42である場合（Qが NR^2 である場合）には、それらの原子価を満たすために置換を必要とする窒素原子がHまたは R^2 で置換されることに留意のこと。以下のG-6、G-7およびG-43もまた、5員もしくは6員非芳香族複素環式環を意味することも留意のこと。その結合ポイントが2一位にある場合、G-19、G-20およびG-23はG-6の例であることに留意のこと。その結合ポイントが2一位にある場合、G-25、G-26およびG-27はG-7の例であることに留意のこと。その結合ポイントが2一位にある場合、G-40がG-43の例であることに留意のこと。

【0032】

【化7】

提示2



【0033】

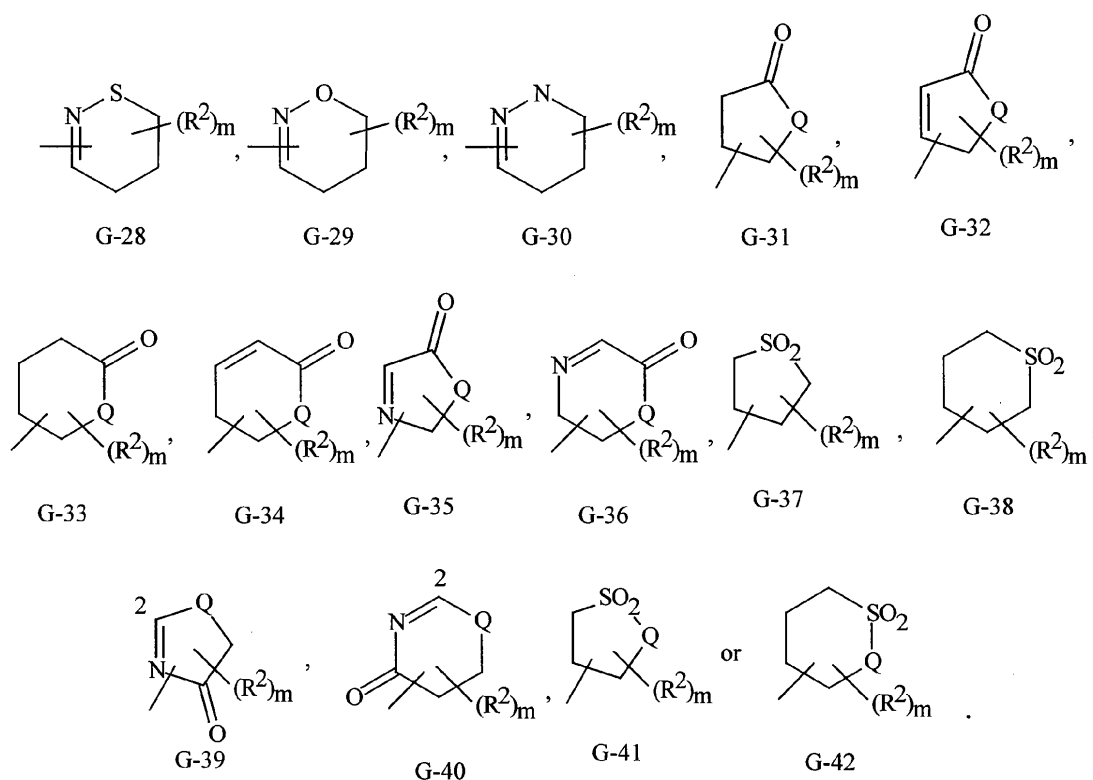
10

20

30

40

【化 8】



10

20

【0034】

上記のように、各 R^2 および各 R^3 が独立して（特に）フェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシ、または5員もしくは6員芳香族複素環、ナフチル環系、または芳香族もしくは非芳香族8員、9員または10員複素二環式縮合環系であることが可能であり、各環または環系は、 R^5 から独立して選択される1～3つの置換基で置換される。かかる R^2 および R^3 の例としては、提示1に示される環U-1（フェニル）、U-87（ベンジル）、U-88（ベンゾイル）、U-86（フェノキシ）、U-85（ナフチル）、U-2～U-53（5員もしくは6員芳香族複素環）およびU-54～U-84（芳香族もしくは非芳香族8員、9員または10員複素二環式縮合環系）（ R^v は R^5 であり、 r は1～3の整数である）が挙げられる。

30

【0035】

上記のように、 R^4 はそれぞれ独立して（中でも）フェニル、ベンジル、またはフェノキシ環であることが可能であり、各環は、 R^5 から独立して選択される1～3つの置換基で置換される。かかる R^4 基の例としては、提示1に示される環U-1（フェニル）、U-87（ベンジル）およびU-86（フェノキシ）（ R^v は R^5 であり、 r は1～3の整数である）が挙げられる。

40

【0036】

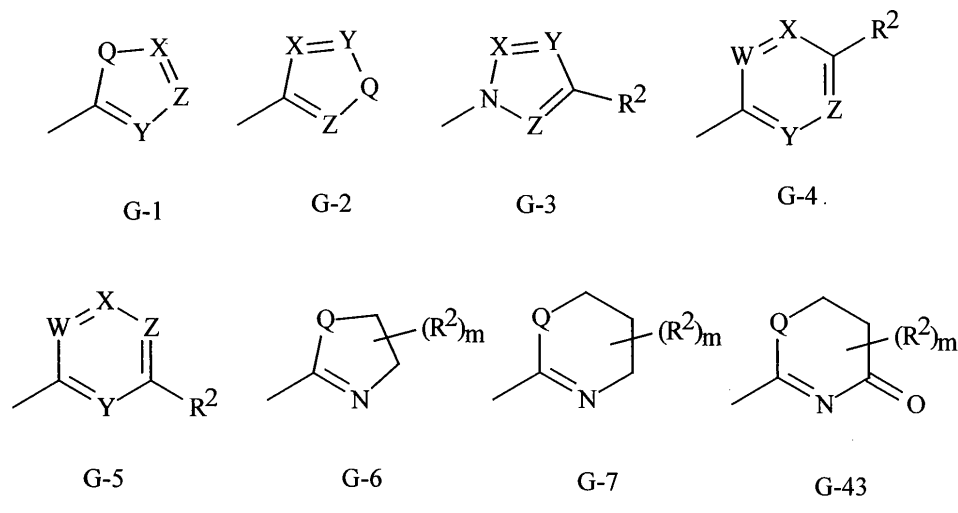
活性がより良く、かつ／または合成が容易であるという理由から、好ましい化合物は：好ましい化合物1．式Iの化合物

式中、AはOであり；

GはG-1、G-2、G-3、G-4、G-5、G-6、G-7およびG-43からなる群から選択され、各Gは1～4つの R^2 で場合により置換され

【0037】

【化 9】



10

【0038】

QはO、SまたはNR²であり；

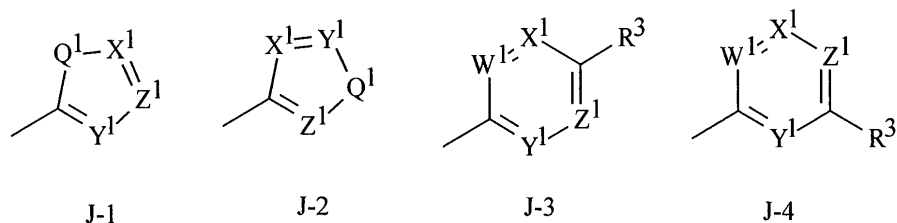
W、X、YおよびZは独立してNまたはCR²であり、ただし、G-4およびG-5においてはW、X、YもしくはZの少なくとも1つがNであり；

Jはフェニル環またはJ-1、J-2、J-3およびJ-4からなる群から選択される5員もしくは6員芳香族複素環であり、各J環は1～3つのR³で場合により置換され

20

【0039】

【化 10】



；

30

【0040】

Q¹はO、SまたはNR³であり；

W¹、X¹、Y¹およびZ¹は独立してNまたはCR³であり、ただし、J-3およびJ-4においてはW¹、X¹、Y¹もしくはZ¹の少なくとも1つがNであり；

R³はそれぞれ独立してH、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₂～C₄アルコキシカルボニル、C₂～C₆アルキルアミノカルボニルまたはC₃～C₈ジアルキルアミノカルボニルであり；あるいは

40

R³はそれぞれ独立してフェニル、ベンジルまたは5員もしくは6員芳香族複素環であり、各環がR⁵から独立して選択される1～3つの置換基で場合により置換され；あるいは

2つのR³が隣接する炭素原子に結合する場合には一緒になって—OCF₂O—、—CF₂CF₂O—または—OCF₂CF₂O—となることができ；

1つのR⁴基がフェニル環の2位または5位のいずれかで式Iの残部に結合し、かつ前記R⁴がC₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニルまたはC₁～C₄ハロアルキルスルホニルであり；

50

mは0～4の整数である。

【0041】

好ましい化合物2．好ましい化合物1の化合物

式中、 R^1 はHまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルであり；

$C=A$ 部分に対してオルト位でJに結合する1つの R^3 基、および場合により1つまたは2つの更なる R^3 が存在し、 R^3 基がそれぞれ独立してH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル；またはフェニル、ベンジル、または5員もしくは6員芳香族複素環であり、各環がハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシで場合により置換され；

nは1または2である。

【0042】

好ましい化合物3．好ましい化合物2の化合物

式中、Jはフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジン環であり、それぞれが $C=A$ 部分に対してオルト位でJに結合する1つの R^3 そして場合により1つまたは2つの更なる R^3 で置換され；

【0043】

好ましい化合物4．好ましい化合物3の化合物

式中、 R^1 はHであり；

1つの R^4 が $NR^1C(=A)$ J部分に対してオルトのフェニル環の2位で式Iの残部に結合し且つ $C_1 \sim C_3$ アルキル、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ およびハロゲンからなる群から選択され、場合により第2の R^4 が $NR^1C(=A)$ J部分に対してパラのフェニル環の4位で結合し且つハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからなる群から選択され；

pは0、1または2である。

【0044】

好ましい化合物5．好ましい化合物4の化合物

式中、JはJ-5、J-6、J-7、J-8、J-9およびJ-10からなる群から選択されるピラゾールまたはピロール環であり、各環は R^3 で置換され、場合により R^6 および R^7 で置換され；

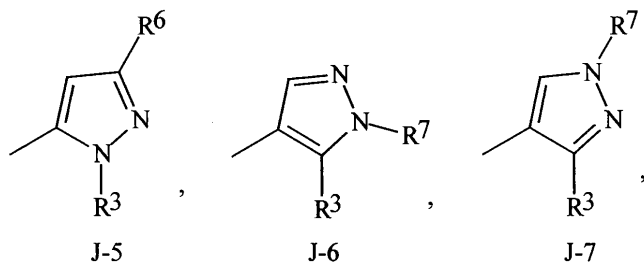
【0045】

10

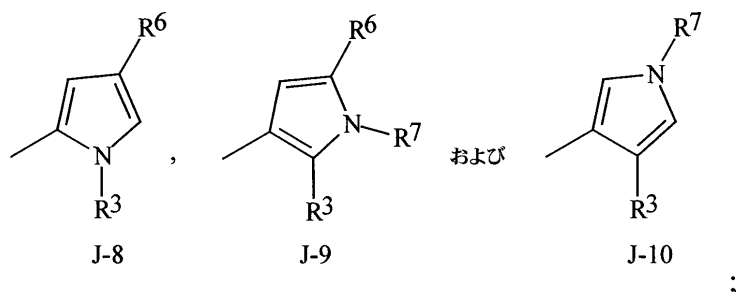
20

30

【化 1 1】



10



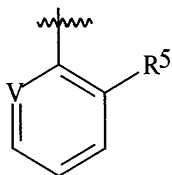
【0046】

R³ はH、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、または

20

【0047】

【化 1 2】



;

【0048】

VはN、CH、CF、CCl、CBrまたはCIであり；

各R⁵ および各R⁶ は独立してH、C₁～C₆ アルキル、C₃～C₆ シクロアルキル、C₁～C₆ ハロアルキル、ハロゲン、CN、C₁～C₄ アルコキシ、C₁～C₄ ハロアルコキシまたはC₁～C₄ ハロアルキルチオであり；

R⁷ はH、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ ハロアルキル、C₃～C₆ アルケニル、C₃～C₆ ハロアルケニル、C₃～C₆ アルキニルまたはC₃～C₆ ハロアルキニルである。

【0049】

R⁶ およびR⁷ はR³ のサブセットであることに留意のこと。V内に包含されるF、Cl、BrまたはI原子は、R⁵ のサブセットであることに留意のこと。R³ について示される部分は、破線で強調表示される結合を介してJに結合することに留意のこと。

40

【0050】

好ましい化合物6．好ましい化合物5の化合物

式中、VはNである。

【0051】

好ましい化合物7．好ましい化合物5の化合物

式中、VはCH、CF、CClまたはCBrである。

【0052】

好ましい化合物8．好ましい化合物6または好ましい化合物7の化合物

式中、R⁵ は、H、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、ハロゲンまたはC

50

Nであり；

R^6 は、H、 CH_3 、 CF_3 、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ またはハロゲンであり；

R^7 は、 CH_2CF_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【0053】

好ましい化合物9．好ましい化合物8の化合物

式中、 R^3 で置換され、そして場合により R^6 で置換されるJがJ-5であり； R^5 はClまたはBrであり； R^6 はハロゲン、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ または CF_3 である。

【0054】

好ましい化合物10．好ましい化合物8の化合物

10

式中、 R^3 で置換され、そして場合により R^7 で置換されるJがJ-6であり； R^9 はClまたはBrであり； R^7 は CH_2CF_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【0055】

好ましい化合物11．好ましい化合物8の化合物

式中、 R^3 で置換され、そして場合により R^7 で置換されるJがJ-7であり； R^9 はClまたはBrであり； R^7 は CH_2CF_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【0056】

好ましい化合物12．好ましい化合物8の化合物

式中、 R^3 で置換され、そして場合により R^6 で置換されるJがJ-8であり； R^5 はClまたはBrであり； R^6 はハロゲン、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ または CF_3 である。

20

【0057】

好ましい化合物13．好ましい化合物8の化合物

式中、 R^3 で置換され、そして場合により R^6 および R^7 で置換されるJがJ-9であり； R^5 はClまたはBrであり； R^6 はハロゲン、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ または CF_3 であり； R^7 は CH_2CF_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

【0058】

好ましい化合物14．好ましい化合物8の化合物

式中、 R^3 で置換され、そして場合により R^7 で置換されるJがJ-10であり； R^9 はClまたはBrであり； R^7 は CH_2CF_3 、 CHF_2 または CF_3 である。

30

【0059】

好ましい化合物6から好ましい化合物14の化合物（式中、GはG-1、G-2、G-6またはG-43である）は注目すべきである。

【0060】

最も好ましいのは：

1-（3-クロロ-2-ピリジニル）-N-〔2-（1H-イミダゾール-2-イル）-6-メチルフェニル〕-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

1-（2-クロロメチル-N-〔2-メチル-6-（1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル）フェニル〕-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

40

1-（2-クロロフェニル）-N-〔2-（4, 5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル）-6-メチルフェニル〕-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

1-（3-クロロ-2-ピリジニル）-N-〔2-（4, 5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル）-6-メチルフェニル〕-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

N-〔4-ブromo-2-（4, 5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル）-6-メチルフェニル〕-1-（2-クロロフェニル）-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

50

N-〔4-ブromo-2-(4,5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル〕-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-〔2-(4,5-ジヒドロ-2-オキサゾリル)-6-メチルフェニル〕-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、および

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-〔2,4-ジクロロ-6-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)フェニル〕-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドからなる群から選択される式 I の化合物である。

【0061】

本発明は、生物学的に有効な量の式 I の化合物、そのN-オキシドまたはその化合物の適切な塩を含んでなる、無脊椎有害生物を防除するための組成物にも関する。好ましい組成物は、好ましい化合物 1～14 において好まれる式 I の化合物、および特に好ましい上記の化合物を含んでなる組成物である。

【0062】

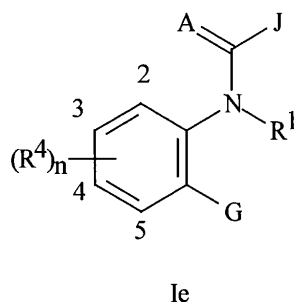
本発明は、生物学的に有効な量の式 I の化合物、そのN-オキシドまたはその化合物の適切な塩（例えば、本明細書で説明される組成物として）と、無脊椎有害生物またはその環境を接触させることを含んでなる無脊椎有害生物の防除方法にも関する。好ましい方法は、好ましい化合物 1～14 において好まれる式 I の化合物、および上記の特に好ましい化合物を含んでなるものである。

【0063】

式 I e :

【0064】

【化 13】



【0065】

(式中、AはOまたはSであり；

GはC(=O)、SOまたはS(O)₂からなる群から選択される1つまたは2つの環員を場合により含む、5員もしくは6員芳香族複素環または5員もしくは6員非芳香族複素環であり、各環が場合により1～4つのR²で置換され；

Jはそれぞれ独立してフェニル環、ナフチル環系、5員もしくは6員芳香族複素環または8員、9員もしくは10員複素二環式芳香族縮合環系であって、各環または環系が場合により1～4つのR³で置換され；

R¹はH；またはC₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニルまたはC₃～C₆シクロアルキルであり、それぞれが場合によりハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₂～C₄アルコキシカルボニル、C₁～C₄アルキルアミノ、C₂～C₈ジアルキルアミノおよびC₃～C₆シクロアルキルアミノからなる群から選択される1つまたは複数の置換基で置換され；あるいは

R¹はC₂～C₆アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコキシカルボニル、C₂～C₆アルキルアミノカルボニル、C₃～C₈ジアルキルアミノカルボニルまたはC(=A)Jであり；

R^2 または R^3 はそれぞれ独立して H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 CO_2H 、 $CONH_2$ 、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであり；あるいは

R^2 または R^3 はそれぞれ独立してフェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシ、5員もしくは6員芳香族複素環、ナフチル環系、または芳香族もしくは非芳香族8員、9員または10員複素二環式縮合環系であって、各環または環系が $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ (アルキル) シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルからなる群から独立して選択される1～3つの置換基で場合により置換され；あるいは

(R^3)₂ は隣接する炭素原子に結合する場合には一緒になって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ 、または $-OCF_2CF_2O-$ となることができ；

R^4 はそれぞれ独立して H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、または $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであり；あるいは

R^4 はそれぞれ独立してフェニル、ベンジルまたはフェノキシであり、それぞれが $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ (アルキル) シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルで場合により置換され；

n が 1～4 である)

の化合物、その N-オキシドまたはその農業的に適する塩は注目に値する。

【0066】

式 I e の選択された化合物もまた注目に値する：

選択 A. 式 I e の化合物

式中、A は O であり；

G は G-1、G-2、G-3、G-4、G-5、G-6、G-7 および G-43 からなる群から選択され、G はそれぞれ、1～4 つの R^2 で場合により置換され

10

20

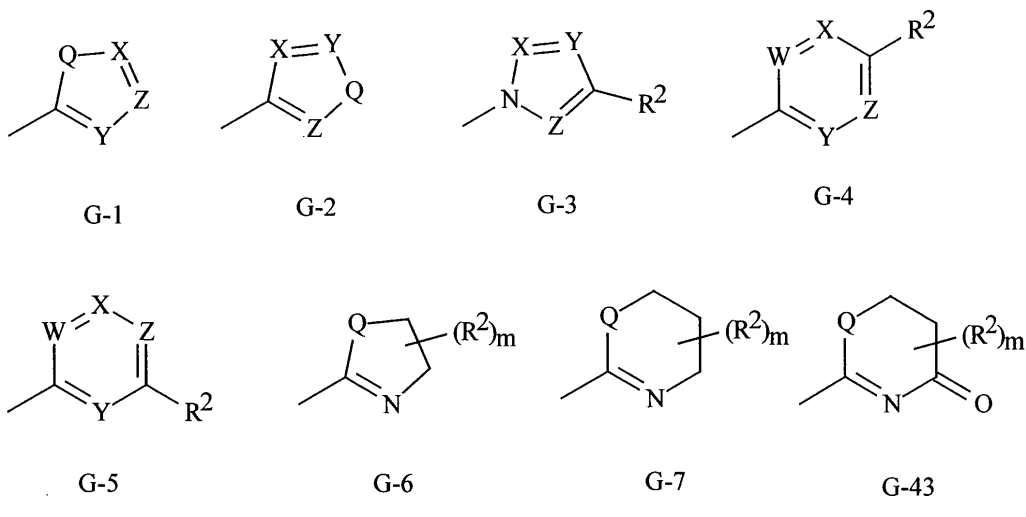
30

40

50

【0067】

【化14】



10

【0068】

QはO、Sまたは NR^2 であり；

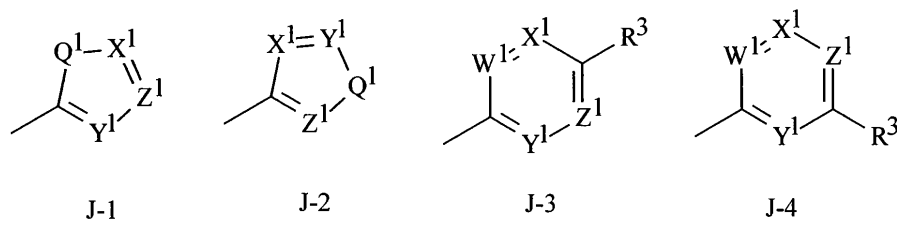
W、X、YおよびZが独立してNまたは CR^2 であり、ただし、G-4およびG-5においてはW、X、YもしくはZの少なくとも1つがNであり；

20

Jはフェニル環またはJ-1、J-2、J-3およびJ-4からなる群から選択される5員もしくは6員芳香族複素環であり、Jはそれぞれ独立して1～3つの R^3 で置換され

【0069】

【化15】



30

【0070】

 Q^1 はO、Sまたは NR^2 であり；

W^1 、 X^1 、 Y^1 および Z^1 は独立してNまたは CR^3 であり、ただし、J-3およびJ-4においては W^1 、 X^1 、 Y^1 もしくは Z^1 の少なくとも1つがNであり；

mは0～4である。

【0071】

選択B. 選択Aの化合物

式中、nは1～2であり；

40

 R^1 は、Hまたは $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキルであり；

1つの R^3 基は、 $\text{C}=\text{A}$ 部分に対してオルト位でJに結合し、かつ前記 R^3 が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルチオ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルスルホニル、または $\text{C}_2 \sim \text{C}_4$ アルコシカルボニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたはフェニル、ベンジル、または5員もしくは6員芳香族複素環であり、各環が、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_4$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_4$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルコキシで場合に

50

より置換され；

任意の第2の R^3 基が独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、または $C_2 \sim C_4$ アルコシカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたはフェニル、ベンジル、または5員もしくは6員芳香族複素環であり、各環が、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシで場合により置換される。

10

【0072】

選択C．選択Bの化合物

式中、Jはフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンであり、それぞれがJおよび $C=A$ を連結する窒素原子に対してオルト位でJに結合する1つの R^3 および第2の任意の R^3 で置換される。

【0073】

選択D．選択Cの化合物

式中、 R^1 はHであり；1つの R^4 は、 $NR^1C(=A)$ J部分に対してオルトの2位で結合し、かつ $C_1 \sim C_3$ アルキル、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ およびハロゲンからなる群から選択され、任意の第2の R^4 は、 $NR^1C(=A)$ J部分に対してパラの4位で結合し、かつハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからなる群から選択され；pは0、1または2である。

20

【0074】

選択E．選択Dの化合物

式中、JはJ-1であり； Q^1 は NR^{3a} であり； X^1 はNまたはCHであり； Y^1 はCHであり； Z^1 は CR^{3b} であり； R^{3a} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシから選択される1つまたは2つの置換基で置換されるフェニルまたは2-ピリジルであり； R^{3b} はハロゲンまたは CF_3 である。

【0075】

30

選択F．選択Dの化合物

式中、GはG-1、G-2、G-6またはG-43である。

【0076】

スキーム1～45に記載の以下の方法および変形形態の1つまたは複数を用いて、式Iの化合物を製造することができる。以下の式2～108の化合物におけるA、G、J、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、Vおよびnの定義は、上記に定義されている通りである。式Ia～e、2a～2b、4a～vおよび5a～yの化合物は、それぞれ式I、2、4および5の化合物の様々なサブセットである。 $R^{2a} \sim R^{2e}$ は R^2 のサブセットであり、 $R^3(c)$ および $R^3(d)$ は R^3 のサブセットである。

【0077】

40

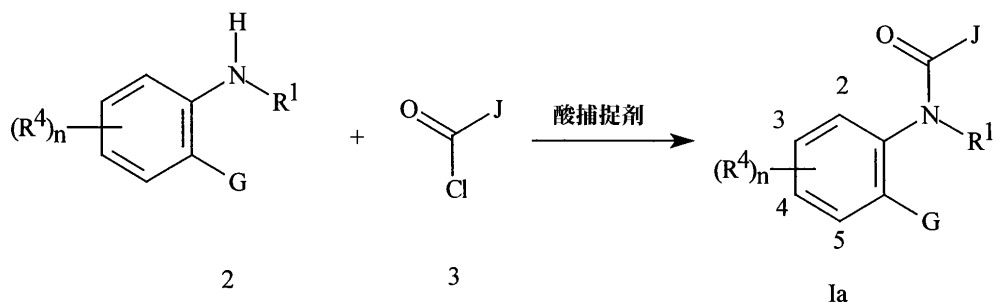
通常の手順はスキーム1に記述されており、式2のアミンと式3の酸塩化物を酸捕捉剤または塩基の存在下にてカップリングして、式Iaの化合物を提供することを含む。通常の酸捕捉剤としては、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンおよびピリジンなどのアミン塩基が挙げられる；他の捕捉剤としては、水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムなどの水酸化物および炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムなどの炭酸塩が挙げられる。特定の例において、ポリマー結合ジイソプロピルエチルアミンおよびポリマー結合ジメチルアミノピリジンなどのポリマー担持酸捕捉剤を使用するのが有効である。カップリングは、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチルエーテルまたはジクロロメタンなどの適切な不活性溶媒中で行い、式Iaのアニリドを得ることができる。

【0078】

50

【化 1 6】

スキーム 1



10

【0079】

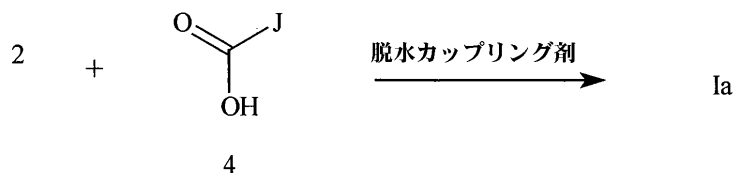
式 Ia の化合物を製造するための代替の手順は、式 2 のアミンを式 4 の酸と、ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、1, 1'-カルボニルジイミダゾール、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)-ホスフィンクロリドまたはヘキサフルオロリン酸ベンゾトリアゾール-1-イルオキシートリス(ジメチルアミノ)ホスホニウムなどの脱水剤の存在下にてカップリングすることを含む。カップリングは、ジクロロメタンまたは N, N-ジメチルホルムアミドなどの適切な不活性溶媒中で行うことができる。ここで、ポリマー結合シクロヘキシルカルボジイミドなどのポリマー担持試薬が再び有用である。合成

20

【0080】

【化 1 7】

スキーム 2



30

【0081】

当業者であれば、数多くの公知の方法によって式 4 の酸から式 3 の酸塩化物を製造することができることも理解されよう。例えば、式 3 の酸塩化物は、トルエンまたはジクロロメタンなどの不活性溶媒中で触媒量の N, N-ジメチルホルムアミドの存在下にて、カルボン酸 4 を塩化チオニルまたは塩化オキサリルと反応させることによって、式 4 のカルボン酸から容易に製造される。

【0082】

式 2 a の複素環式置換アニリンは通常、ニトロ基の接触水素化 (スキーム 3) によって式 5 の対応する 2-ニトロベンゼンから入手することができる。通常の手順は、酸化炭素または酸化白金などの金属触媒の存在下で、エタノールおよびイソプロパノールなどのヒドロキシ溶媒中での水素での還元を含む。それらは、酢酸中にて亜鉛で還元することによって製造することもできる。これらの手順は化学文献に詳しく述べられている。式 5 の置換フェニル複素環は、Rodd's Chemistry of Organic Compounds: Heterocyclic Compounds, Volume I V, parts C, F and I J 1989, Comprehensive Heterocyclic Chemistry, Volumes 2, 3, 4, 5 and 6 (1984) および Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Volumes 3, 4, 5 and 6 1996, 国際公開 (PCT 国際出願) 第 98/56, 789 号 (1998) および国際公開 (PCT 国

40

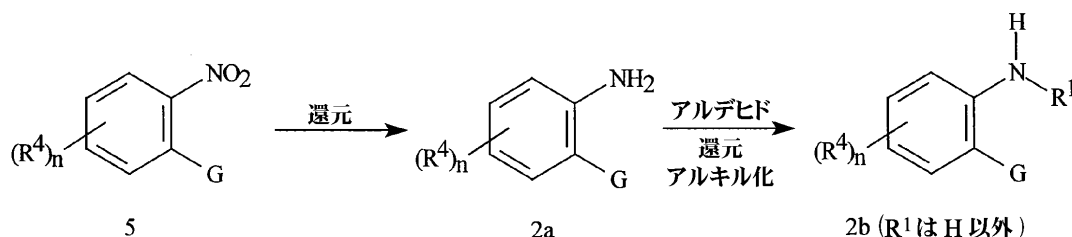
50

際出願)第96/06,096号(1996)に記載の方法などの一般的な方法に従って製造することができる。アルキル、置換アルキル等の R^1 置換基は一般に、いずれかの直接的アルキル化を含む公知の手順によって、またはアニリンの還元的アルキル化の一般的に好ましい方法によってこの段階で導入することができる。一般に用いられる手順は、水素化シアノホウ素ナトリウムなどの還元剤の存在下にてアニリン2aをアルデヒドと化合させて、式2b(式中、 R^1 はアルキル、アルケニル、アルキニルまたはその置換誘導体である)の化合物を生成するものである。

【0083】

【化18】

スキーム3



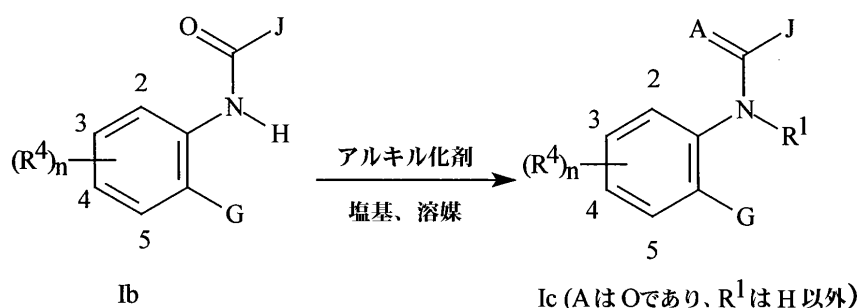
【0084】

スキーム4では、式Ibの化合物を、水素化ナトリウムまたはn-ブチルリチウムなどの塩基の存在下にて、テトラヒドロフランまたはN,N-ジメチルホルムアミドなどの不活性溶媒中で、ハロゲン化アルキルなどの適切なアルキル化剤でアルキル化し、式Ic(式中、 R^1 は水素以外である)のアニリドを得ることができることを示している。この手順は、式Ic(式中、 R^1 はアルキル、アルケニルまたはアルキニルである)の化合物を製造するのに特に有用である。

【0085】

【化19】

スキーム4



【0086】

式Id(式中、 R^1 は、水素または本発明の概要で定義される他の置換基である)のチオアニリンの製造をスキーム5に概説する。ピリジンなどの適切な溶媒中で室温にてまたは加熱して、式Iaのアニリドと五硫化リンまたはLawesson試薬と反応させることによって、式Idのチオアニリンが得られる。

【0087】

10

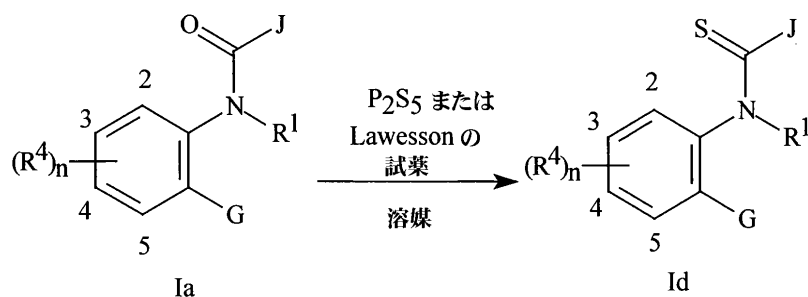
20

30

40

【化 2 0】

スキーム 5



10

【0088】

式 4 a (式 4 (式中、J は場合により置換されるフェニル環である) の化合物) の安息香酸は当技術分野ではよく知られている。式 4 の特定の酸の製法は、スキーム 6 ~ 11 に記述する。様々な複素環式酸およびそれらを合成するための一般的な方法は、国際公開第 98/57397 号に記載されている。

【0089】

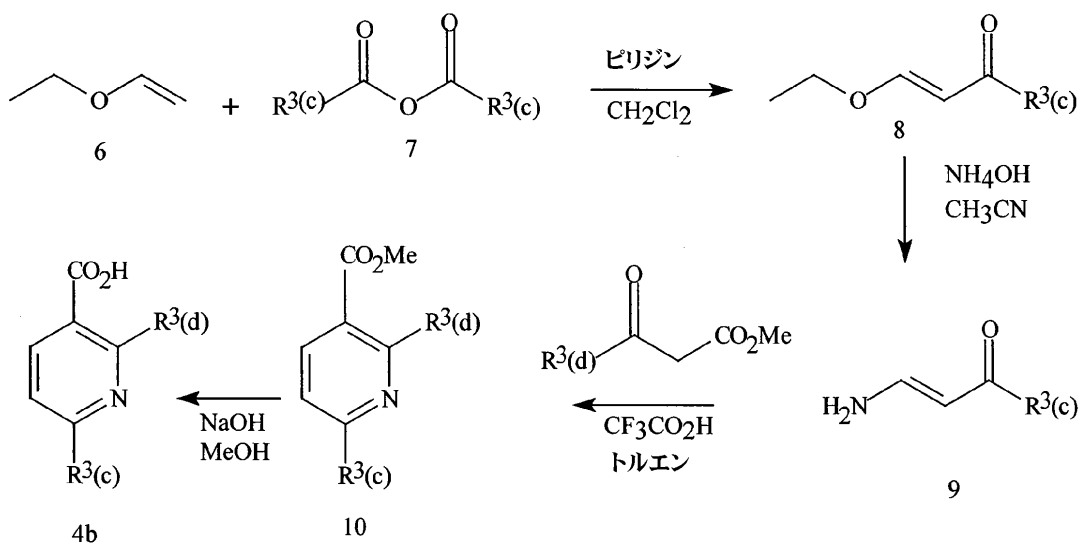
代表的なピリジン酸 (4 b) の合成をスキーム 6 に示す。この手順は、β-ケトエステルおよび 4-アミノブテノン (9) からのピリジンの公知の合成を含む。置換基 $R^3(c)$ および $R^3(d)$ は、例えば、アルキル、ハロアルキル、および場合により置換される芳香族環および芳香族複素環を含む。

20

【0090】

【化 2 1】

スキーム 6



30

40

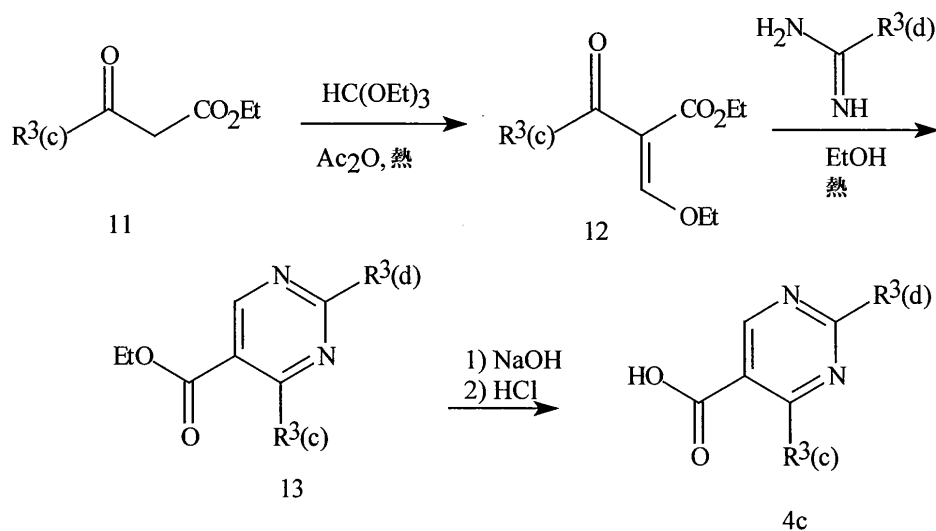
【0091】

代表的なピリミジン酸 (4 c) の合成をスキーム 7 に示す。この手順は、ビニリデン-β-ケトエステル (12) およびアミジンからのピリミジンの公知の合成を含む。置換基 $R^3(c)$ および $R^3(d)$ は、例えば、アルキル、ハロアルキル、および場合により置換される芳香族環および芳香族複素環を含む。

【0092】

【化 2 2】

スキーム 7



10

【0093】

代表的なピラゾール酸（4d～4h）の合成をスキーム8～11に示す。ピラゾール4dはスキーム8に示す。スキーム8における4dの合成は、重要な段階として、ピラゾールのアルキル化によってR³(c)置換基の導入を含む。アルキル化剤R³(c)-Lg（式中、Lgは脱離基、例えばCl、Br、I、p-トルエンスルホネートまたはメタンスルホネートなどのスルホネート、-SO₂OR³(c)などのスルフェートである）は、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₂～C₆アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコキシカルボニル、C₃～C₈ジアルキルアミノカルボニル、C₃～C₆トリアルキルシリルなどのR³(c)基；またはフェニル、ベンジル、ベンゾイル、5員もしくは6員芳香族複素環または芳香族8員、9員もしくは10員複素二環式芳香族縮合環系（それぞれの環または環系が場合により置換される）を含む。メチル基の酸化によりピラゾールカルボン酸が得られる。さらに好ましいR³(d)基のいくつかは、ハロアルキルおよびハロゲンを含む。

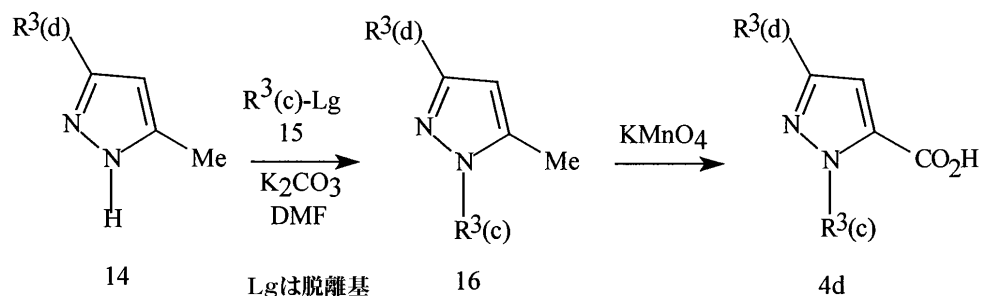
20

30

【0094】

【化 2 3】

スキーム 8



40

【0095】

式4eのピラゾールの合成をスキーム9で説明する。これらのピラゾール酸は、重要な段階として式18のメタレーションおよびカルボキシル化によって製造することが可能である。R³(c)基は、スキーム8と同様の手法で、つまりR³(c)アルキル化剤でアルキル化することによって導入される。代表的なR³(d)基には、例えばシアノおよび

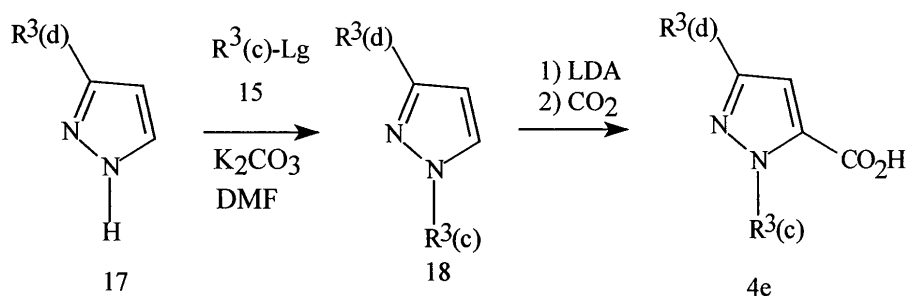
50

ハロアルキルが含まれる。

【0096】

【化24】

スキーム9



10

【0097】

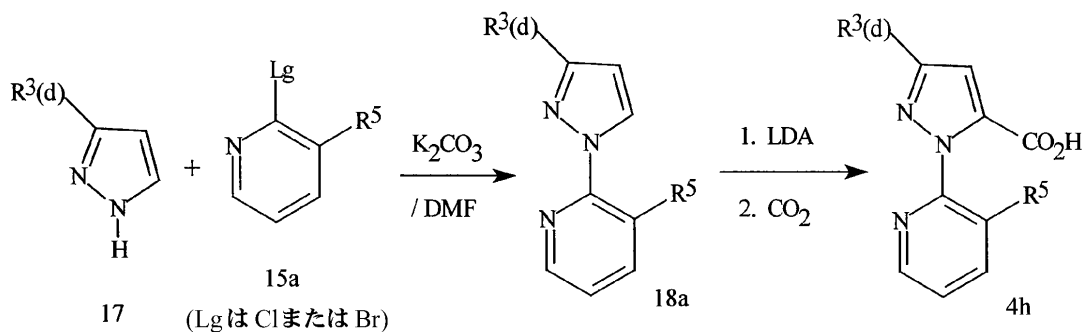
この手順は、スキーム9aに示される好ましい部分J-5に関連する、式4hの1-(2-ピリジニル)ピラゾールカルボン酸を製造するのに特に有用である。式17のピラゾールと式15aの2,3-ジハロピリジンとの反応によって、所望の位置化学に対して良好な特異性を有する式18aの1-ピリジルピラゾールが良好な収量で得られる。リチウムジイソプロピルアミド(LDA)で18aをメタレーションし、続いてそのリチウム塩を二酸化炭素で急冷することによって、式4hの1-(2-ピリジニル)ピラゾールカルボン酸が得られる。

20

【0098】

【化25】

スキーム9a



30

【0099】

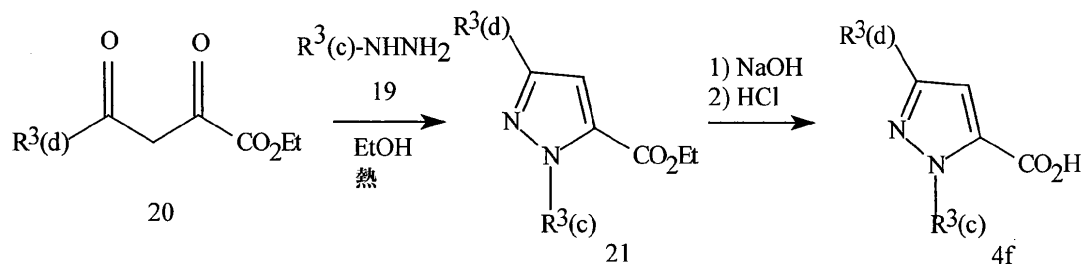
式4fのピラゾールの製法はスキーム10に示す。これらは、場合により置換されるフェニルヒドラジン19をケトピルベート20と反応させて、ピラゾールエステル21を得ることによって製造することができる。そのエステルを加水分解すると、ピラゾール酸4fが生成される。この手順は、 $R^3(c)$ が場合により置換されるフェニルであり、 $R^3(d)$ がハロアルキルである化合物を製造するのに特に有用である。

40

【0100】

【化 2 6】

スキーム 10



10

【0101】

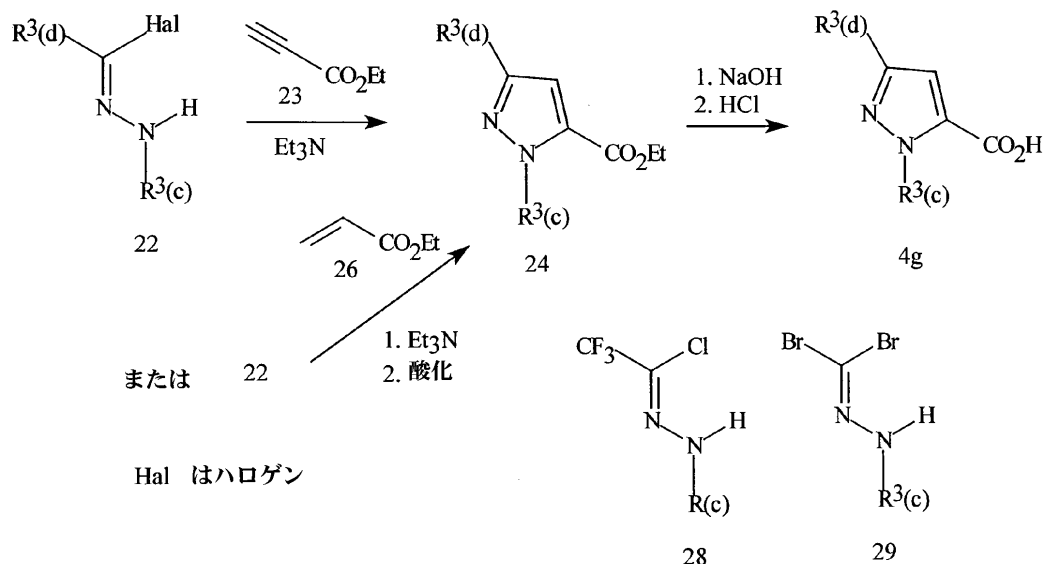
式 4 g のピラゾール酸をスキーム 11 で説明する。これらは、置換プロピオレート (23) またはアクリレート (26) のいずれかで式 22 の適切に置換されたニトリルイミンを 3 + 2 付加環化することによって製造することができる。アクリレートでの付加環化には、中間体ピラズリンをピラゾールにさらに酸化することが必要である。そのエステルを加水分解することによって、ピラゾール酸 4 g が得られる。この理由から好ましいイミノハロゲン化物には、トリフルオロメチルイミノクロリド (28) およびイミノジブロマイド (29) が含まれる。28 などの化合物は公知である (J. Heterocycl. Chem. 1985, 22 (2), 565-8)。29 などの化合物は公知の方法によって

20

【0102】

【化 2 7】

スキーム 11



30

40

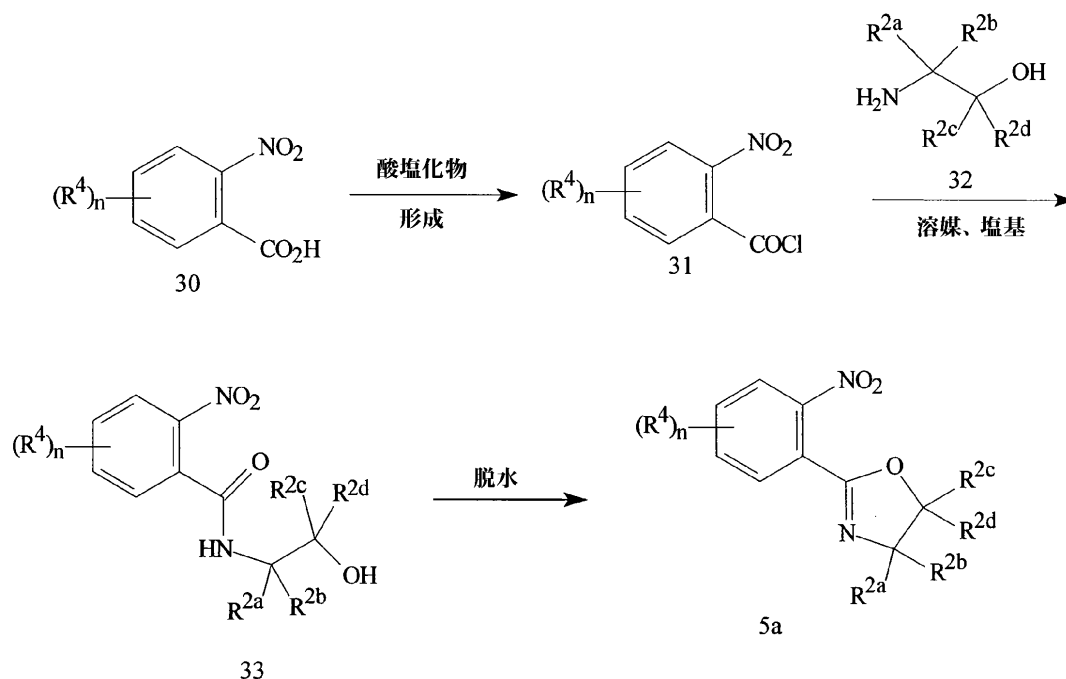
【0103】

式 30 の 2-ニトロ安息香酸からの式 5 a の置換 2-ニトロフェニルオキサゾリンの製造をスキーム 12 に概説する。

【0104】

【化 28】

スキーム 12



10

20

【0105】

式30のニトロ安息香酸の式31の酸塩化物物への転化は、トルエンまたはジクロロメタンなどの溶媒中で、適切な酸塩化物物生成試薬、例えば塩化チオニル、塩化オキサリル、またはホスゲンで30を処理することによって達成することができる。塩基、例えば第3級アミンまたはピリジンの存在下にて、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはジクロロメタンなどの溶媒中、式32の置換アミノアルコールで式31の酸塩化物物を処理することによって、式33のニトロフェニルアミドが得られる。適切な式33のアミドを脱水剤、例えば塩化チオニル、塩化オキサリルまたはオキシ塩化リンを用いて、そのまま、またはジクロロメタンもしくはトルエンなどの溶媒中で脱水することによって、式5aの中間体が得られる。

30

【0106】

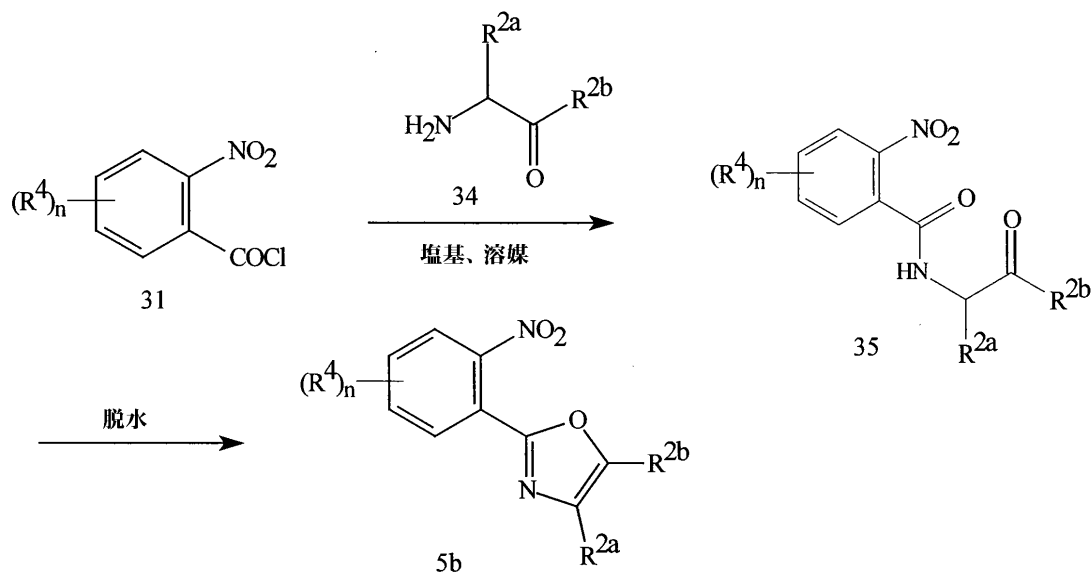
スキーム13では、式31の2-ニトロベンゾイルクロリドから式5bの置換2-ニトロフェニルオキサゾールの製造が概説されている。塩基、例えば第3級アミン、ピリジンの存在下にて、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはジクロロメタンなどの溶媒中で式34（式中、 R^{2b} が水素である）の置換アルドアミンまたは式34（式中、 R^{2b} が水素以外である）のケトアミンで置換式31の酸塩化物物を処理することによって、式35のニトロフェニルアルドアミドおよびケトアミドが得られる。脱水剤、例えば塩化チオニル、塩化オキサリルまたはオキシ塩化リンを用いて、そのまま、またはジクロロメタンもしくはトルエンなどの溶媒中で、式35のアルドアミドおよびケトアミドを脱水すること

40

【0107】

【化 2 9】

スキーム 13



10

【0108】

式 31 の 2-ニトロベンゾイルクロリドからの式 5 c の置換 2-ニトロフェニルオキサジアゾールの製造をスキーム 14 で概説する。塩基、例えば第 3 級アミン、ピリジンの存在下にて、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはジクロロメタンなどの溶媒中で、式 36 (式中、 R^{2b} が水素である) のヒドロキシホルムアミジンまたは式 36 (式中、 R^{2b} が水素以外である) のヒドロキシアセトアミジンで式 31 の酸塩化物を処理することによって、式 37 の中間体を得られ、それをそのまま、またはジクロロメタンもしくはトルエンなどの溶媒中で、適切な脱水剤、塩化チオニル、塩化オキサリルまたはオキシ塩化リンを用いて脱水すると、式 5 c の中間体を得られる。

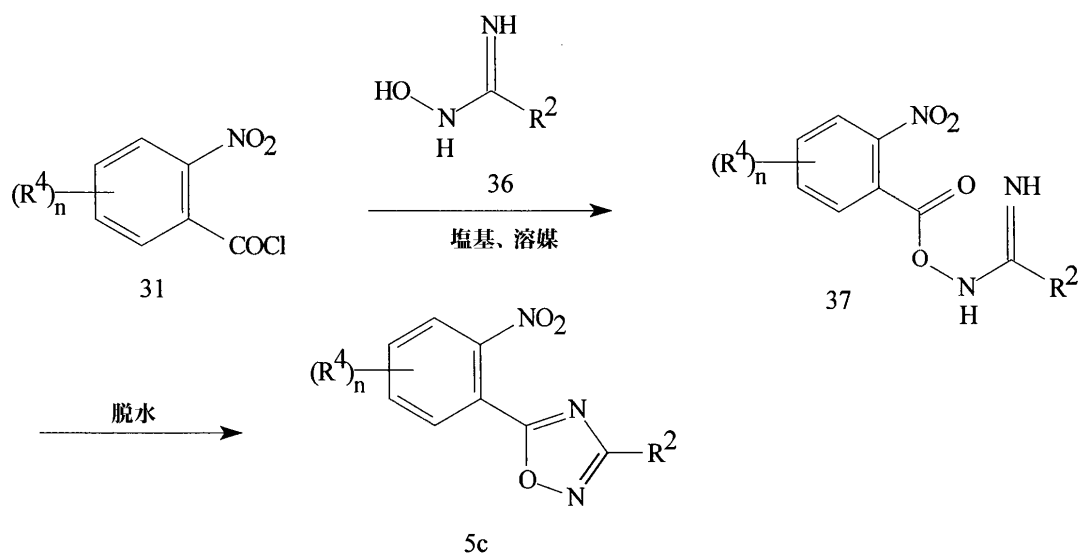
20

【0109】

【化 30】

30

スキーム 14



40

【0110】

式 31 の 2-ニトロベンゾイルクロリドからの式 5 d の置換 2-ニトロフェニルオキサジアゾール合成をスキーム 15 に概説する。塩基、例えば第 3 級アミン、ピリジンの存在

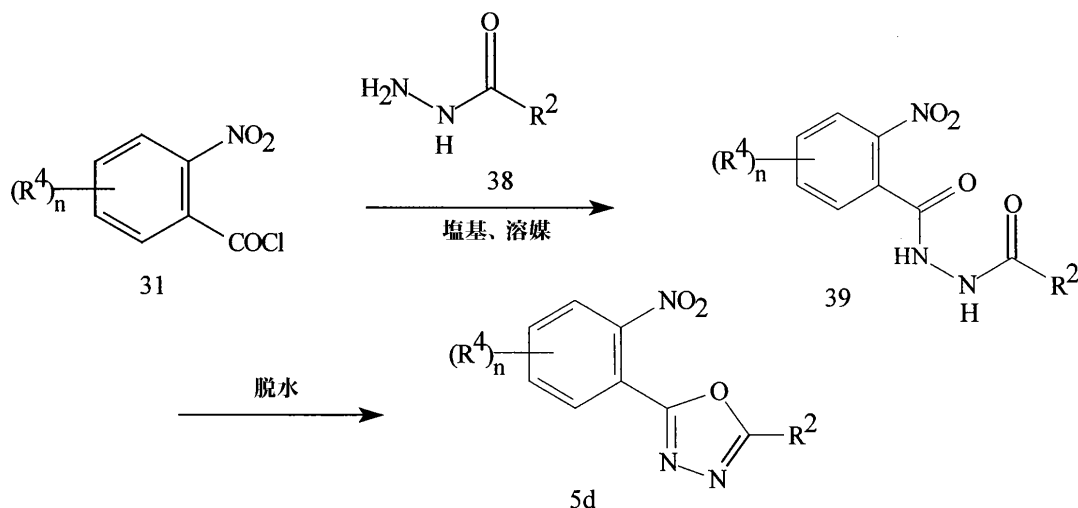
50

下にて、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはジクロロメタンなどの溶媒中で、式 3 8 のヒドラジドで式 3 1 の酸塩化物を処理することによって、式 3 9 の中間体が生成され、それをそのまま、またはジクロロメタンもしくはトルエンなどの溶媒中で、適切な脱水剤、塩化チオニル、塩化オキサリルまたはオキシ塩化リンを用いて脱水すると、式 5 d の中間体が得られる。

【 0 1 1 1 】

【 化 3 1 】

スキーム 15



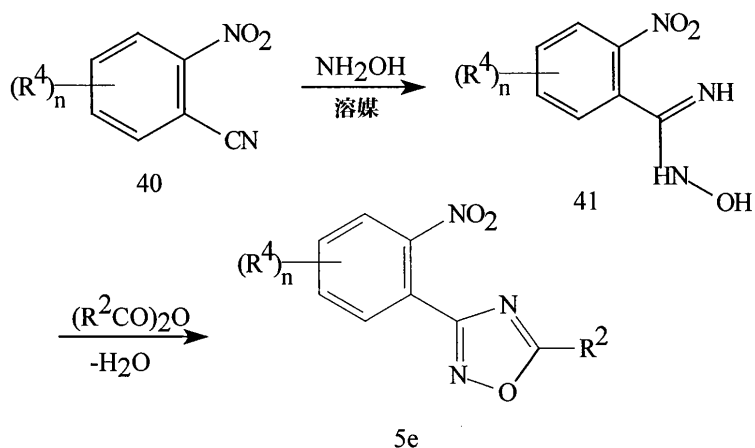
【 0 1 1 2 】

式 4 0 の 2-ニトロベンズニトリルからの式 5 e の置換 2-ニトロフェニルオキサジアゾールの製造をスキーム 1 6 に概説する。適切な溶媒、例えばメタノール、エタノールまたはアセトニトリル中で、ヒドロキシルアミンで式 4 0 のベンズニトリルを処理することによって、式 4 1 のヒドロキシベンズアミジンが得られる。テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはピリジンなどの溶媒中で式 $(R^2CO)_2O$ の無水物と 4 1 を反応させることによって、式 5 e の中間体が生成される。

【 0 1 1 3 】

【 化 3 2 】

スキーム 16



【 0 1 1 4 】

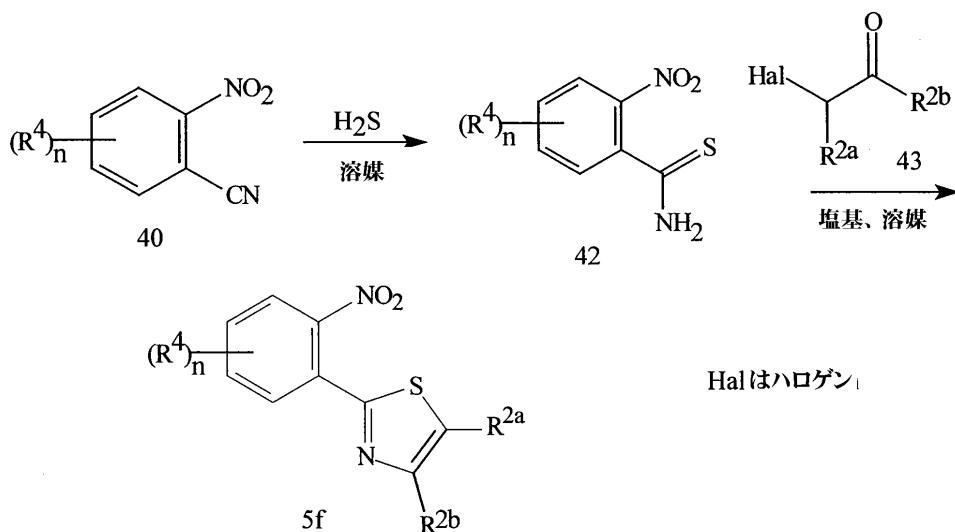
式 4 0 の 2-ニトロベンズニトリルから式 5 f の置換 2-ニトロフェニルチアゾールの製造をスキーム 1 7 で概説する。ピリジンなどの溶媒中にて硫化水素で式 4 0 のベンズニトリルを処理することによって、式 4 2 のチオベンズアミドが得られる。低級アルキルア

ルコールなどの溶媒中で、トリアルキルアミンなどの溶媒と共に、 α -ハロアルデヒドまたは式 43 の α -ハロケトンと 42 を反応させることによって、式 5 f の中間体が生成される。

【0115】

【化33】

スキーム 17



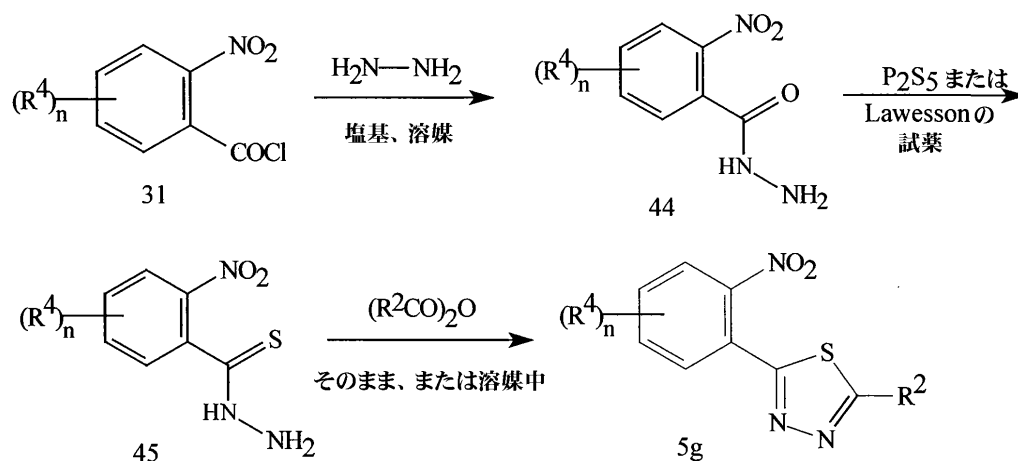
【0116】

スキーム 18 では、式 31 の 2-ニトロベンゾイルクロリドからの式 5 g の置換 2-ニトロフェニルチアジアゾールの製造を概説する。エタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはアセトニトリルなどの溶媒中で式 31 の酸塩化物をヒドラジンで処理することによって、式 44 のヒドラジドが生成され、それをピリジンなどの溶媒中で五硫化リンまたは Lawesson 試薬と反応させると、式 45 のチオヒドラジドが得られる。テトラヒドロフラン、ジオキサン、アセトニトリルまたはピリジンなどの適切な溶媒中で式 $(R^2CO)_2O$ の無水物と 45 を反応させることによって、式 5 g の中間体が生成される。

【0117】

【化34】

スキーム 18



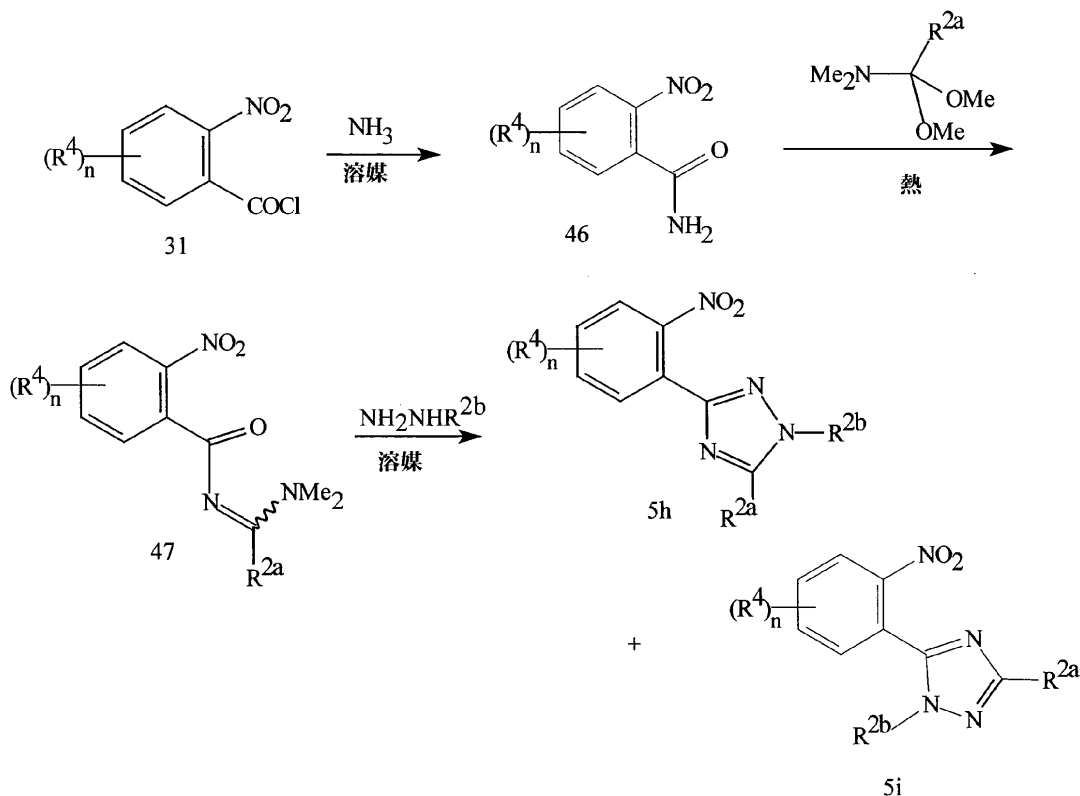
【0118】

スキーム 19 には、式 31 の 2-ニトロベンゾイルクロリドから式 5 h および 5 i の置換 2-ニトロフェニルtriaゾールの製造を概説する。

【0119】

【化35】

スキーム 19



10

20

【0120】

エタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはジエチルエーテルなどの溶媒中にて、式31の酸塩化物をアンモニアで処理することによって、式46のベンズアミドが得られる。式 $(\text{MeO})_2\text{CR}^{2a}\text{NMe}_2$ のN，N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタールまたはジメチルアミドジメチルアセタールで式46のベンズアミドをそのまま、またはトルエンなどの溶媒と共に加熱すると、式47の中間体を得られる。低級アルキルアルコールまたはアセトニトリルなどの適切な溶媒中で式 $\text{R}^{2b}\text{NHNH}_2$ のヒドラジンと47とを反応させることによって、式5hおよび5iが得られる。

30

【0121】

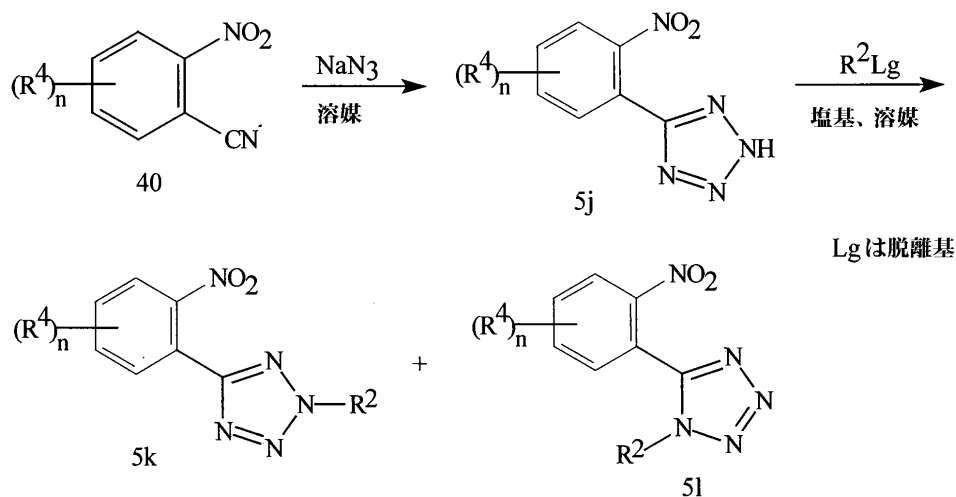
スキーム20では、式40の2-ニトロベンズニトリルからの式5j、5kおよび5lの置換2-ニトロフェニルテトラゾールの製造を示す。N，N-ジメチルホルムアミドまたはアセトニトリル中にて、アジ化ナトリウムで式40のベンズニトリルを処理することによって、式5jのテトラゾールが得られる。炭酸カリウムなどの適切な塩基の存在下にて、N，N-ジメチルホルムアミドなどの溶媒中で、式 R^2Lg （式中、 R^2 が未置換もしくは置換アルキルまたはハロアルキルであり、Lgがハロゲンまたはトシレートなどの脱離基である）のアルキル化剤で式5jをアルキル化することによって、式5kおよび5lの中間体が生成される。

40

【0122】

【化 3 6】

スキーム 20



10

【0123】

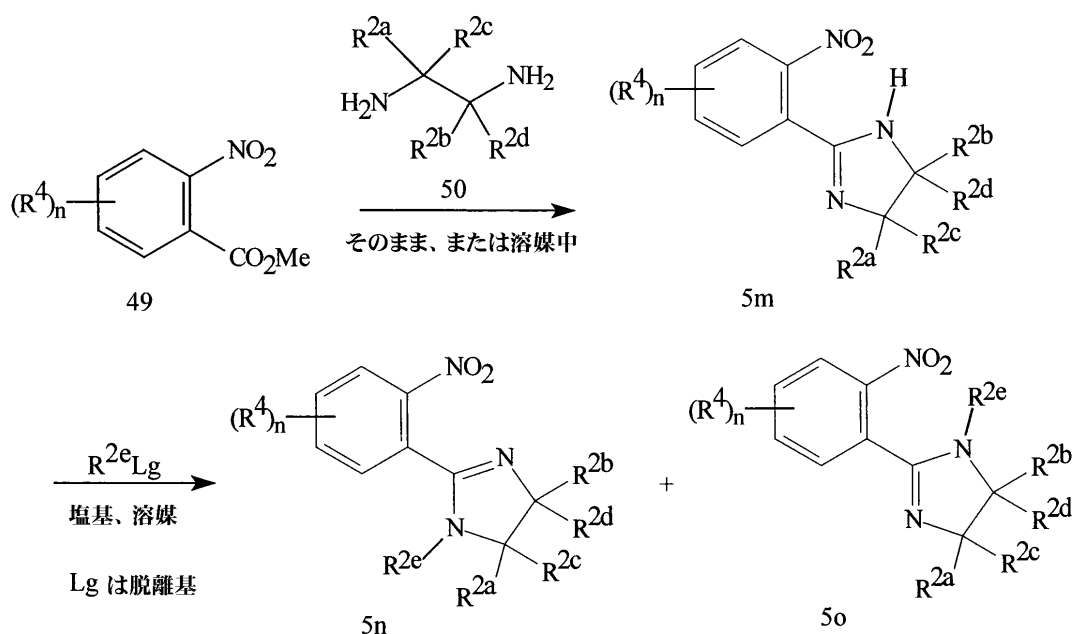
スキーム 21 では、式 5 m、5 n および 5 o の 2-ニトロフェニルイミダゾリンの製造方法を示す。そのまま、またはトルエン、キシレンまたはジクロロベンゼンなどの適切な溶媒中で、式 49 の 2-ニトロ安息香酸メチルを式 50 の置換 1, 2-ジアミノエタンと 100～250℃の温度で加熱すると、式 5 m の 2-ニトロフェニルイミダゾリンが得られる。炭酸カリウムまたは水素化ナトリウムなどの適切な塩基の存在下にて、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたは N, N-ジメチルホルムアミドなどの溶媒中で式 R^{2e} Lg (式中、Lg はハロゲンまたはトシレートなどの脱離基である) のアルキル化剤で 5 m をアルキル化すると、式 5 n および 5 o の中間体が生成される。

20

【0124】

【化 3 7】

スキーム 21



30

40

【0125】

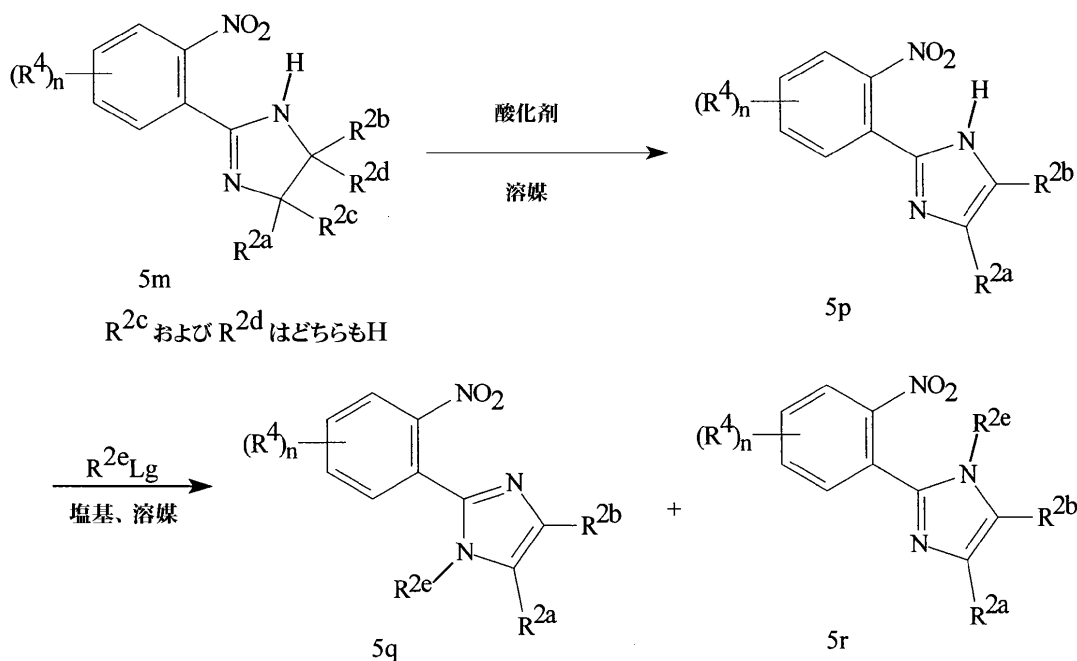
スキーム 22 では、式 5 p、5 q および 5 r の 2-ニトロフェニルイミダゾールを製造する方法を概説する。

【0126】

50

【化 3 8】

スキーム 22



10

20

【0 1 2 7】

ジクロロメタンまたはN, N-ジメチルホルムアミドなどの溶媒中で、式5m（式中、R^{2c}およびR^{2d}がどちらも水素である）のニトロフェニルイミダゾリンを二酸化マンガンのまたは二クロム酸ピリジニウムなどの適切な酸化剤で酸化することによって、式5pのニトロフェニルイミダゾールが得られる。炭酸カリウムまたは水素化ナトリウムなどの適切な塩基の存在下にて、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはN, N-ジメチルホルムアミドなどの溶媒中で、式R^{2e}Lg（式中、Lgはハロゲンまたはトシレートなどの脱離基である）のアルキル化剤で5pをアルキル化することによって、式5qおよび5rの中間体を得られる。

30

【0 1 2 8】

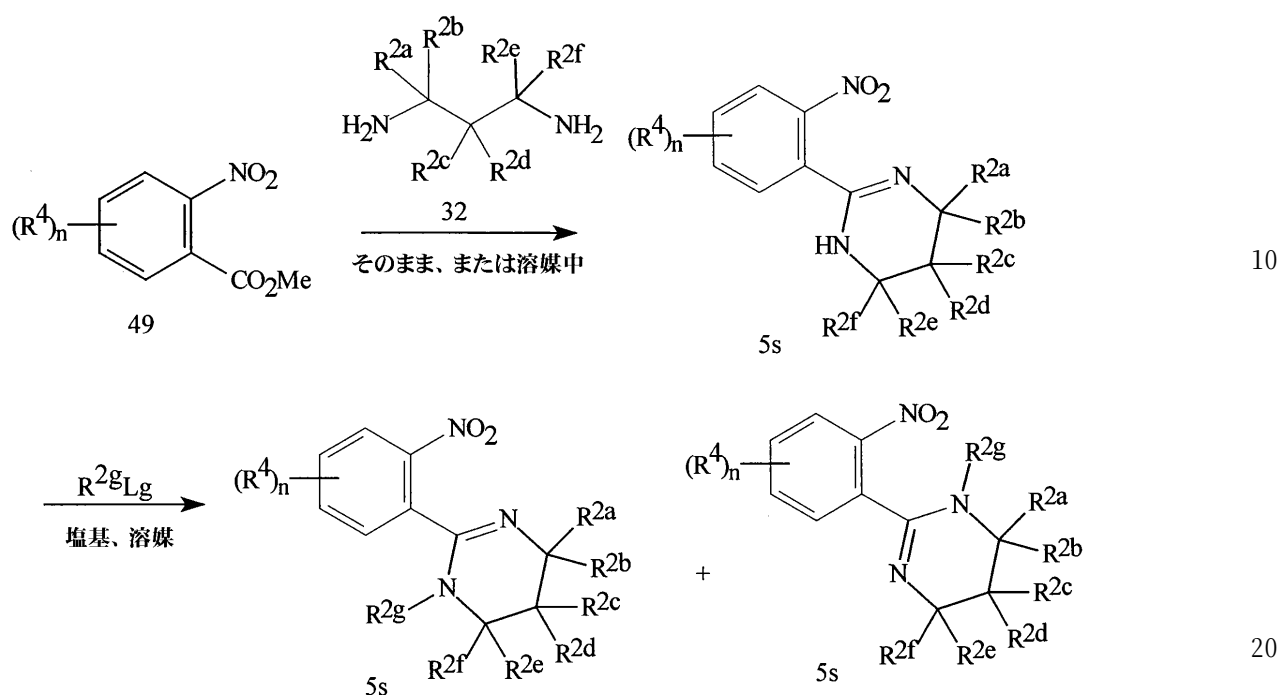
スキーム23では、式5s、5tおよび5uの2-ニトロフェニルテトラヒドロピリミジンを製造する方法を示す。そのままで、またはトルエン、キシレンまたはジクロロベンゼンなどの適切な溶媒中で、100～250℃の温度にて、式49の2-ニトロ安息香酸メチルを置換1, 3-ジアミノプロパンと共に加熱すると、式5sのニトロフェニルテトラヒドロピリミジンが得られる。炭酸カリウムまたは水素化ナトリウムなどの適切な塩基の存在下にて、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはN, N-ジメチルホルムアミドなどの溶媒中で、式R^{2g}Lg（式中、Lgはハロゲンまたはトシレートなどの脱離基である）のアルキル化剤で5sをアルキル化することによって、式5tおよび5uの中間体を得られる。

40

【0 1 2 9】

【化 3 9】

スキーム 23



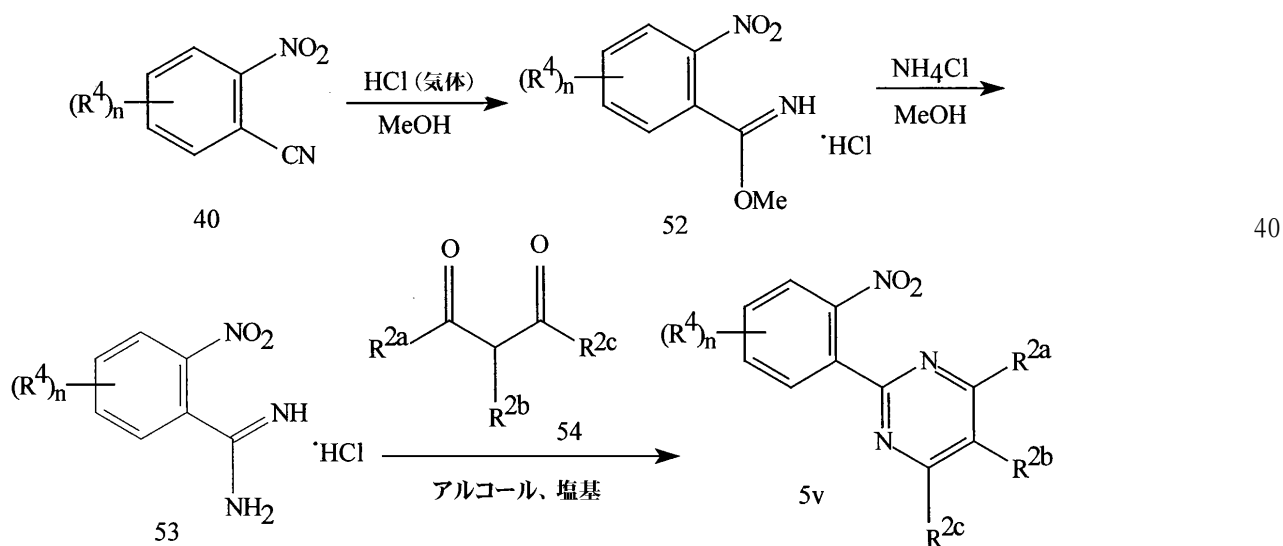
【 0 1 3 0 】

式 5 v の 2-ニトロフェニルピリミジンの合成をスキーム 2 4 に示す。ジエチルエーテルまたはテトラヒドロフランなどの共溶媒と共に、またはなしに、メタノール中で気体 HCl と式 4 0 のニトロベンゾニトリルとを反応させることによって、式 5 2 のイミデート塩酸塩が得られる。メタノール中で式 5 2 のイミデートを塩化アンモニウムで処理することによって、式 5 3 のニトロベンズアミジン塩酸塩が得られる。式 5 3 の化合物は、適切な溶媒、好ましくは低級アルキルアルコール中で、メチル化ナトリウムまたは炭酸カリウムなどの塩基の存在下にて式 5 4 のアルドケトンまたはジケトンと縮合すると、式 5 v の中間体が得られる。

【 0 1 3 1 】

【化 4 0】

スキーム 24



【 0 1 3 2 】

10

20

30

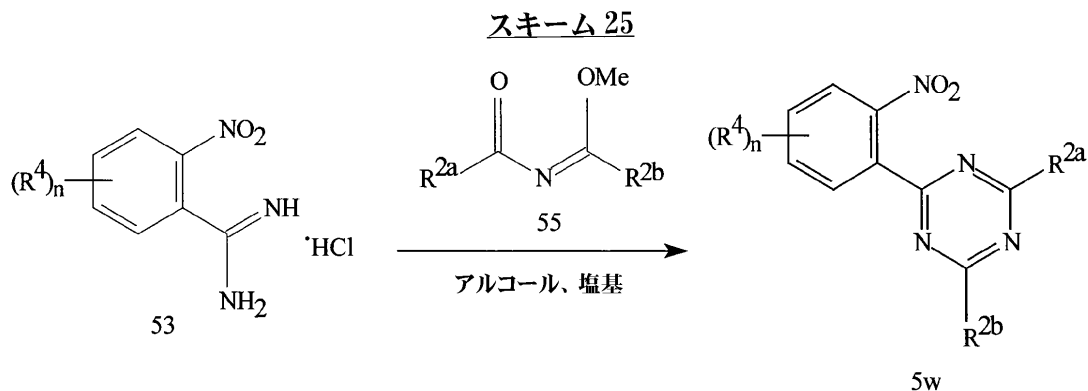
40

50

式 5 w の 2-ニトロフェニルトリアジンの合成をスキーム 25 に示す。適切な溶媒、好ましくは低級アルコール中で、塩基、例えばメチル化ナトリウムまたは炭酸カリウムの存在下にて、式 53 のニトロベンズアミジン塩酸塩を式 55 のアシルイミデートと縮合することによって、式 5 w の中間体が得られる。

【0133】

【化41】



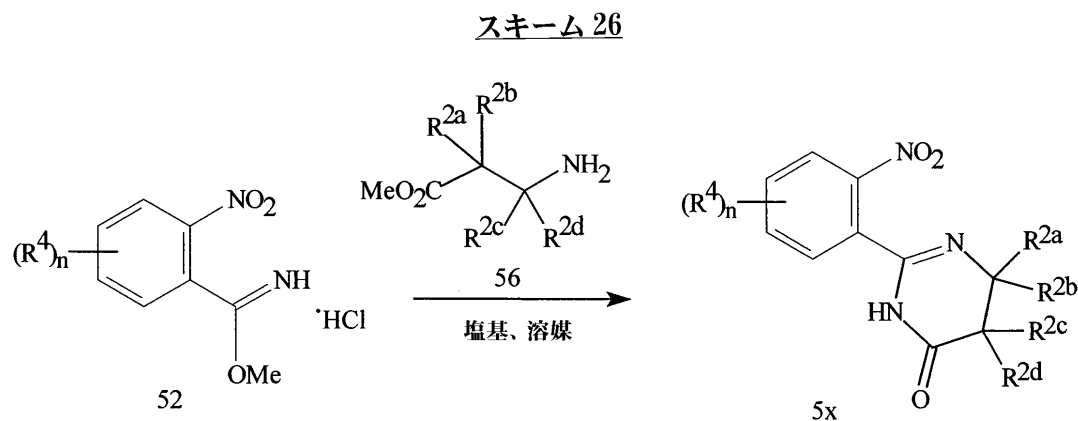
10

【0134】

式 5 x の 2-ニトロフェニルテトラヒドロピリミジノンの製造をスキーム 26 に概説する。適切な溶媒、好ましくは低級アルコール中で、塩基、例えばメチル化ナトリウムまたは炭酸カリウムの存在下にて、式 52 のニトロフェニルイミデートを式 56 の置換 β-アラニンエステルと縮合することによって、式 5 x の中間体が得られる。

【0135】

【化42】



30

【0136】

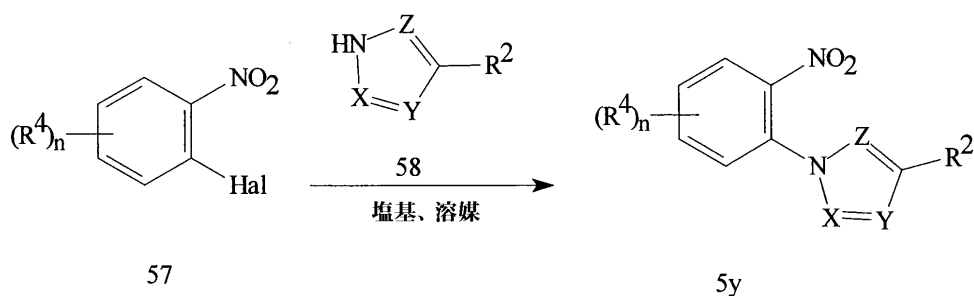
式 5 y のニトロフェニル置換アゾールの製造をスキーム 27 に示す。炭酸カリウムまたは水素化ナトリウムなどの適切な塩基の存在下にて、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリルまたはジオキサンなどの溶媒中で、式 57 (式中、Hal はハロゲン、好ましくはフッ素である) の置換 2-ハロニトロベンゼンを式 58 のアゾールと反応させることによって、式 5 y の中間体が得られる。

【0137】

40

【化 4 3】

スキーム 27



10

【0138】

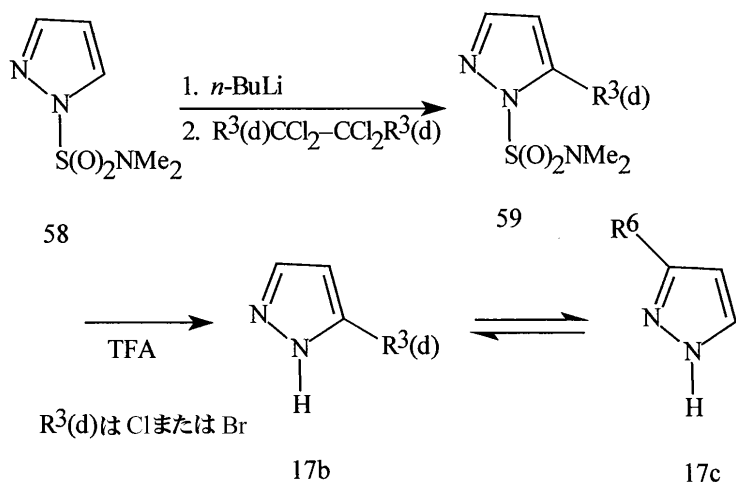
式17（式中、 $R^3(d)$ は CF_3 、ClまたはBrである）のピラゾールは公知の化合物である。ピラゾール17（ $R^3(d)$ は CF_3 である）は、文献の手順に従って製造することができる（J. Fluorine Chem. 1991, 53（1）, 61-70）。式17（式中、 $R^3(d)$ はClまたはBrである）のピラゾールもまた、文献の手順に従って製造することができる（H. Reimlinger and A. Van Overstraeten, Chem. Ber. 1966, 99（10）, 3350-7）。式17（式中、 $R^3(d)$ はClまたはBrである）のピラゾールを製造するための有用な代替方法をスキーム28に示す。n-ブチルリチウムで式58のスルファモイルピラゾールをメタレーションし、続いてそのアニオンをヘキサクロロエタン（ $R^3(d)$ はClである）または1, 2-ジブロモテトラクロロエタン（ $R^3(d)$ はBrである）のいずれかで直接的にハロゲン化することによって、そのハロゲン化誘導体59が得られる。トリフルオロ酢酸（TFA）でスルファモイル基の除去を手際よく行い、それによって、良好な収量で式17b（式中、 $R^3(d)$ が、それぞれClまたはBrである）のピラゾールが得られる。当業者であれば、式17cは式17bの互変異性体であることは理解されよう。

20

【0139】

【化 4 4】

スキーム 28



30

40

【0140】

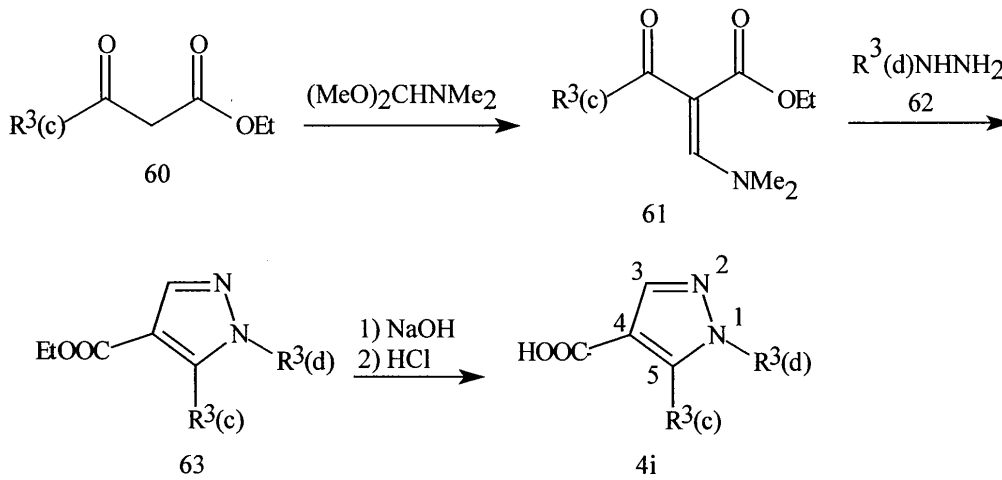
式4iの代表的なピラゾール酸の合成をスキーム29に示す。式61のジメチルアミノイリデンケトエステルを置換ヒドラジン（62）と反応させることによって、式63のピラゾールが得られる。好ましい $R^3(d)$ 置換基としては、アルキルおよびハロアルキルが挙げられ、2, 2, 2-トリフルオロエチルが特に好ましい。式63のエステルは、標準的な加水分解によって式4iの酸に転化される。

50

【 0 1 4 1 】

【 化 4 5 】

スキーム 29



10

【 0 1 4 2 】

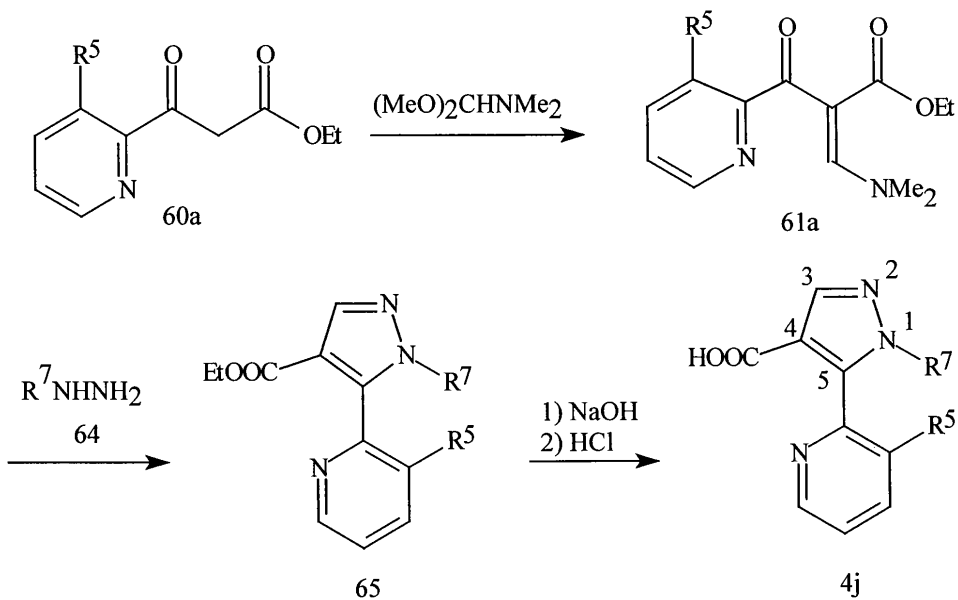
好ましい部分 J-6 (R^3 はピラゾール環の 5 位に結合する置換 2-ピリジル部分である) に関連する式 4j のピラゾール酸の合成をスキーム 30 に示す。この合成は、スキーム 29 について記述されている一般的な合成に従って行われる。

20

【 0 1 4 3 】

【 化 4 6 】

スキーム 30



30

40

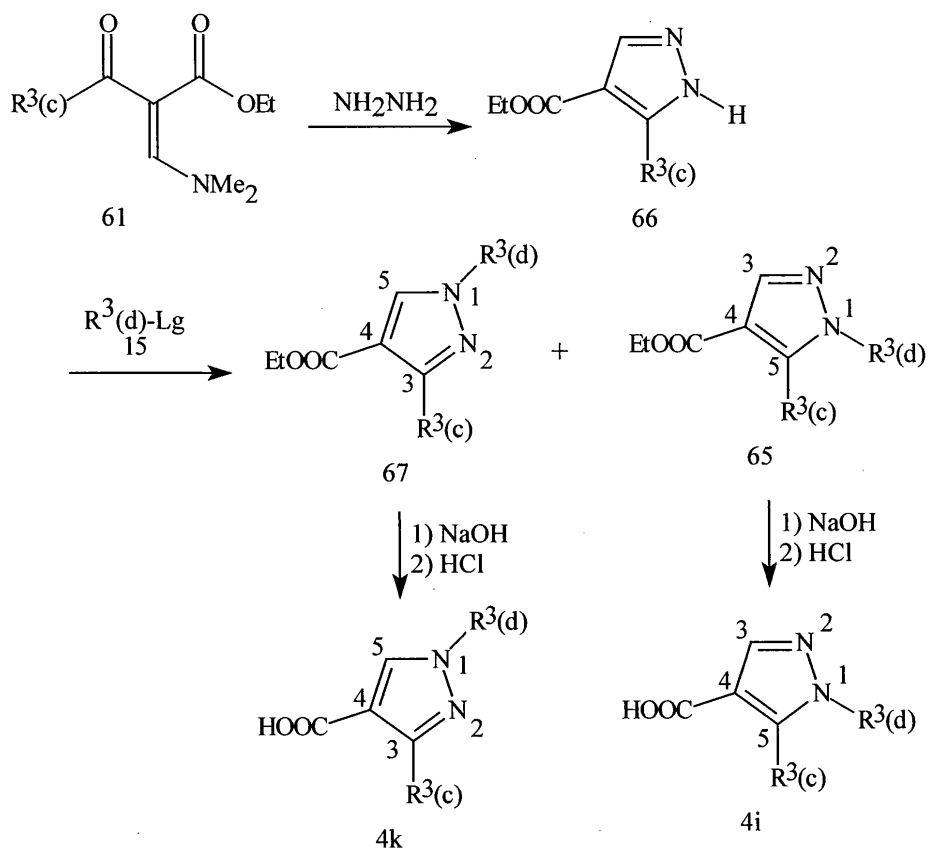
【 0 1 4 4 】

式 4k の代表的なピラゾール酸の合成ならびに式 4i の代替の合成をスキーム 31 に示す。

【 0 1 4 5 】

【化 4 7】

スキーム 31



【0 1 4 6】

式 6 1 のジメチルアミノイリデンケトエステルをヒドラジンと反応させることによって、式 6 6 のピラゾールが得られる。ピラゾール 6 6 を式 1 5 のアルキル化剤（スキーム 8 参照）と反応させることによって、式 6 7 および 6 5 のピラゾールの混合物が得られる。このピラゾール異性体の混合物は、クロマトグラフ法によって容易に分離され、相当する酸 4 k および 4 i にそれぞれ転化される。好ましい $\text{R}^3(\text{d})$ 置換基としては、アルキルおよびハロアルキル基が挙げられる。

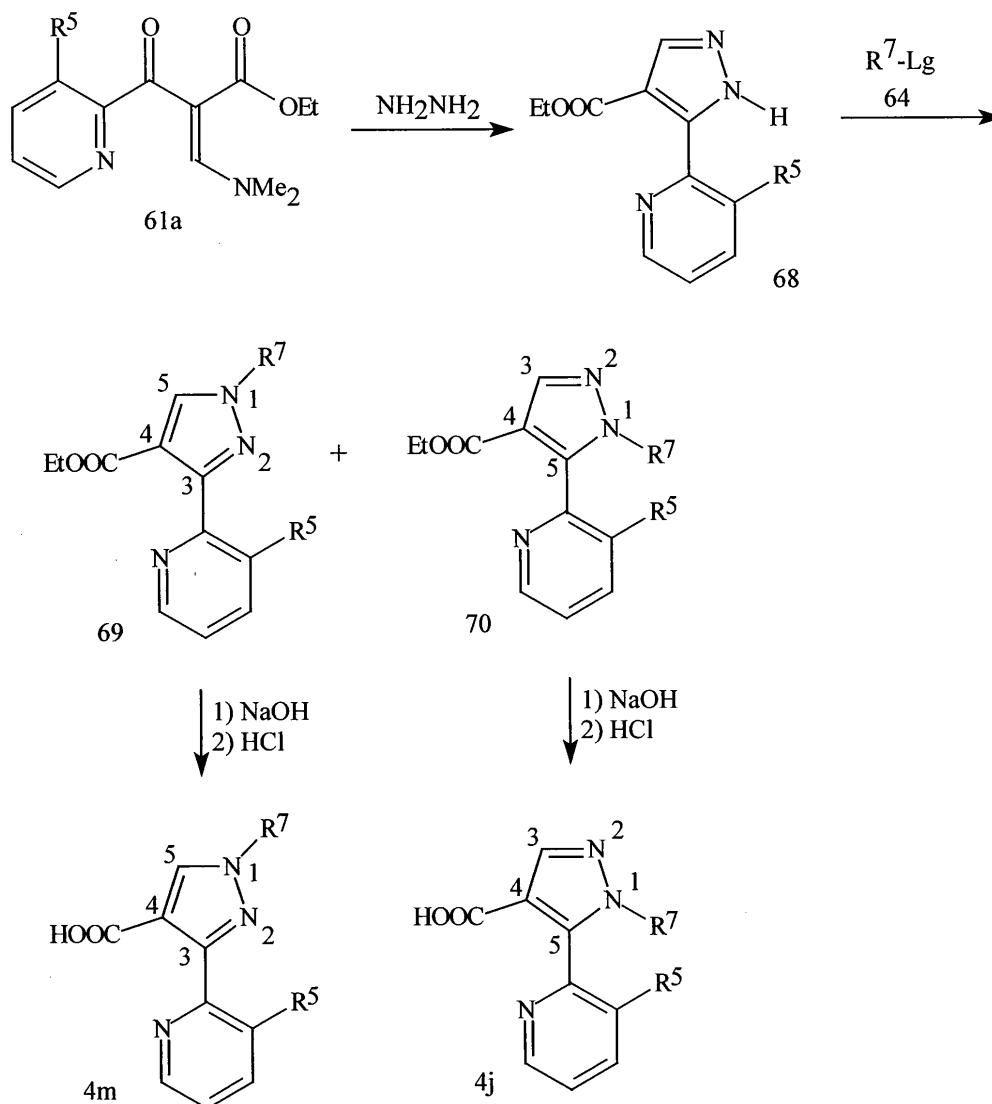
【0 1 4 7】

好ましい部分 J-7（式中、 R^3 が置換 2-ピリジニルであり、かつピラゾール環の 3 位に結合する）に関連する、式 4 m のピリジニルピラゾール酸の合成、ならびに式 4 j の代替の合成をスキーム 3 2 に示す。この合成は、スキーム 3 1 について記述されている一般的な合成に従って行われる。

【0 1 4 8】

【化 4 8】

スキーム 32



10

20

30

【0149】

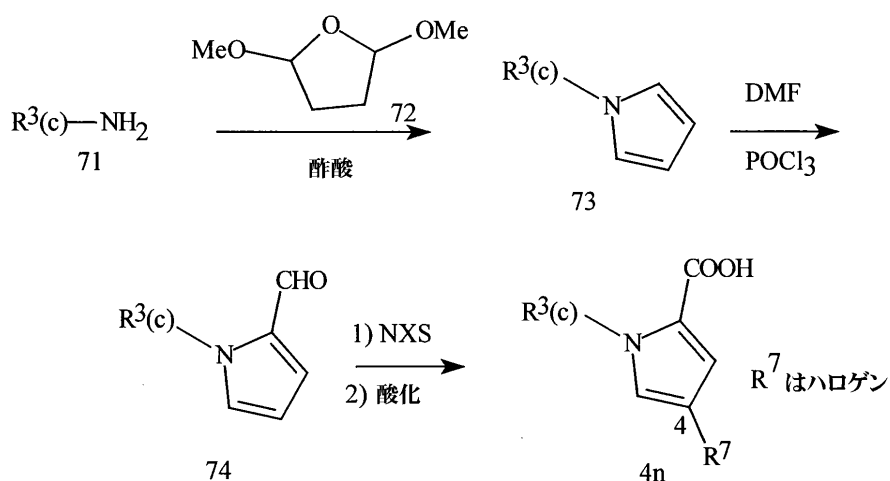
式 22 のピロール酸の一般的な合成をスキーム 33 に示す。式 71 の化合物を 2, 5-ジメトキシテトラヒドロフラン (72) で処理することによって、式 73 のピロールが得られる。式 74 のアルデヒドを得るためのピロール 73 のホルミル化は、N, N-ジメチルホルムアミド (DMF) およびオキシ塩化リンでの処理など、ヴィルスマイヤー-ハーク (Vilsmeier-Haack) ホルミル化標準条件を用いて達成することができる。N-クロロスクシンイミドまたは N-ブロモスクシンイミドなどの N-ハロスクシンイミド (NXS) での式 74 の化合物のハロゲン化は、ピロール環の 4 位で優先的に起こる。ハロゲン化アルデヒドを酸化すると、式 4n のピロール酸が得られる。その酸化は、様々な標準酸化条件を用いて達成することができる。

40

【0150】

【化 4 9】

スキーム 33



10

【0151】

好ましい部分 J-4 (式中、R⁵ が置換 2-ピリジニルであり、かつピロール環の窒素に結合する) に関連する、式 40 の特定のピリジニルピロール酸の合成をスキーム 34 に示す。この合成は、スキーム 33 について記述されている一般的な合成に従って行われる。

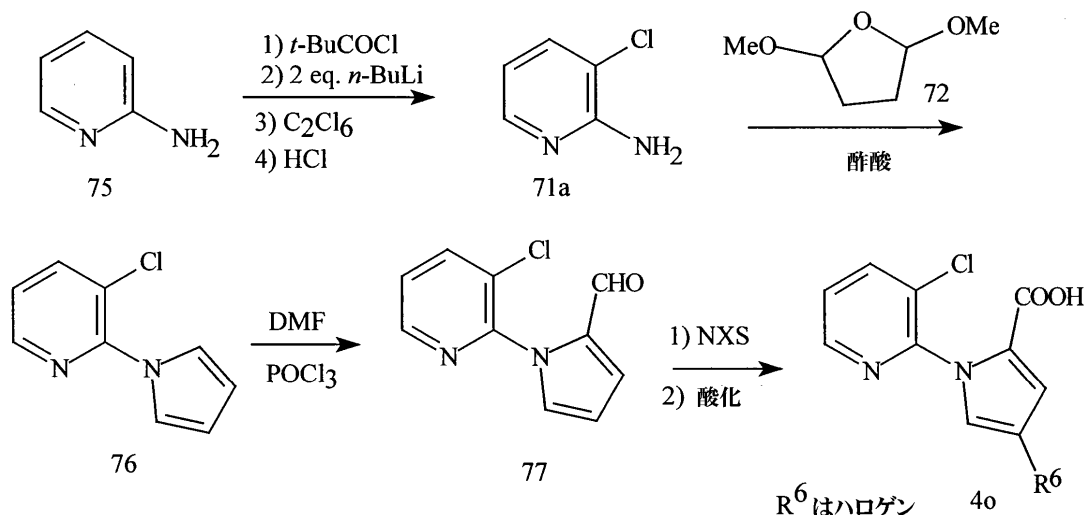
20

式 71a の化合物、3-クロロ-2-アミノピリジンは、公知の化合物である (J. Heterocycl. Chem. 1987, 24 (5), 1313-16 参照)。

【0152】

【化 50】

スキーム 34



30

40

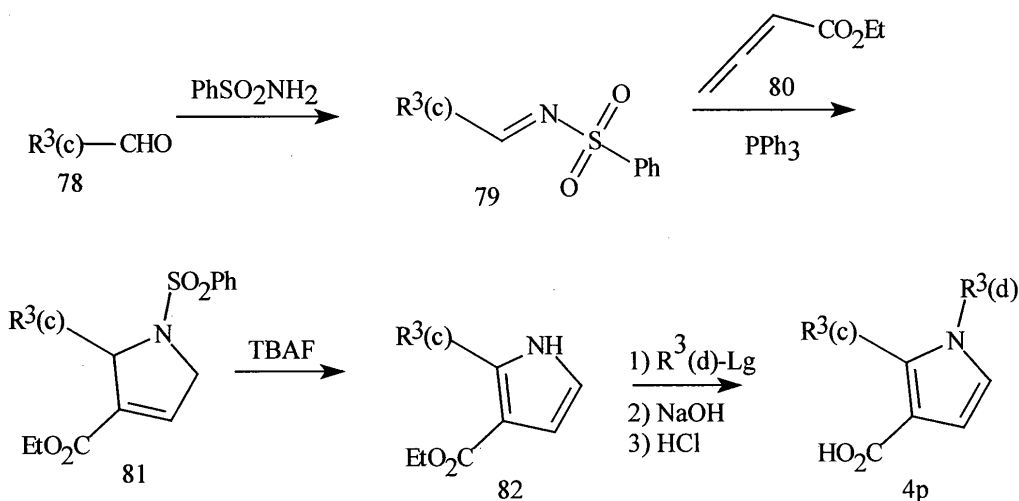
【0153】

式 4p のピロール酸の合成をスキーム 35 に示す。式 80 のアレンを式 79 のフェニルスルホニルヒドラジドで付加環化することによって (Pavri, N. P.; Trudell, M. L. J. Org. Chem. 1997, 62, 2649-2651 参照)、式 81 のピロリンが得られる。式 81 のピロリンをフッ化テトラブチルアンモニウム (TBAF) で処理すると、式 82 のピロールが得られる。ピロール 82 をアルキル化剤 R³ (d) -Lg (式中、Lg は上記で定義される脱離基である) と反応させ、加水分解することによって、式 4p のピロール酸が得られる。

【0154】

【化 5 1】

スキーム 35



10

【0 1 5 5】

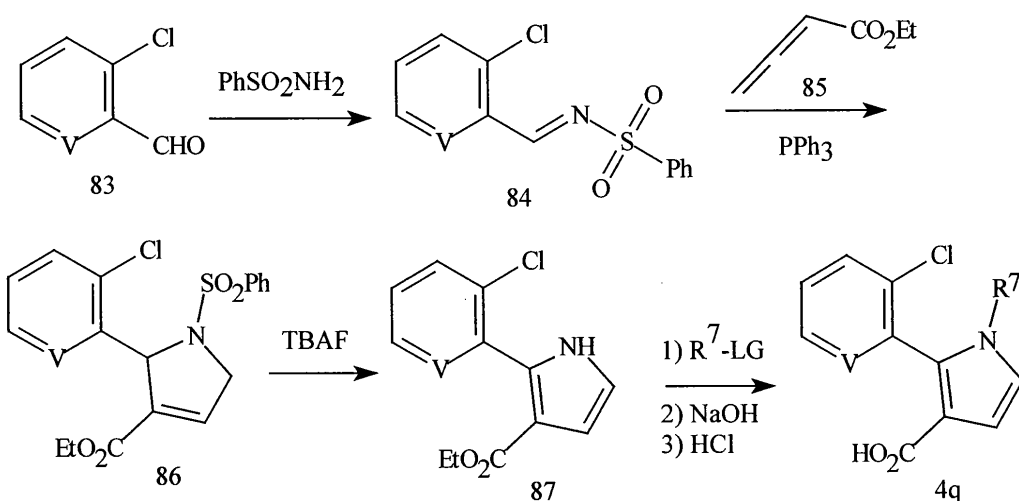
好ましい部分 J-5 (式中、 R^5 はフェニルまたは 2-ピリジルであり、かつピロール環の 2 位に結合する) に関連する、式 4 q のピロール酸の合成をスキーム 3 6 に示す。その合成は、スキーム 3 5 について記述されている一般的な方法に従って行われる。

20

【0 1 5 6】

【化 5 2】

スキーム 36



30

【0 1 5 7】

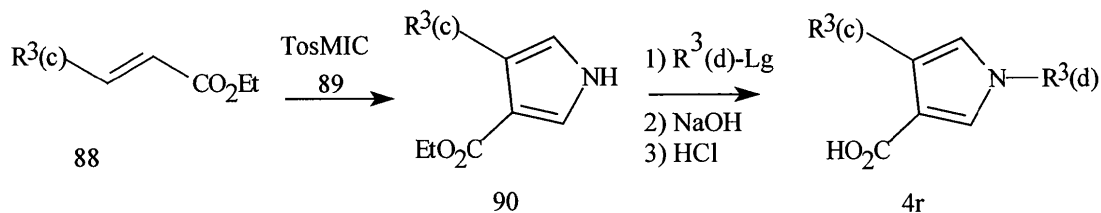
式 4 r のピロール酸の合成を式 3 7 に示す。式 8 8 の α , β -不飽和エステルと p-トリルスルホニルメチルイソシアニド (TosMIC) との反応によって、式 9 0 のピロールが得られる。主要な参考文献として、Xu, Z. ら, J. Org. Chem., 1988, 63, 5031-5041 を参照のこと。式 9 0 のピロールをアルキル化剤 $\text{R}^3(\text{d})\text{-Lg}$ (Lg は上記に定義される脱離基である) と反応させ、続いて加水分解することによって、式 4 r のピロール酸が得られる。

40

【0 1 5 8】

【化 5 3】

スキーム 37



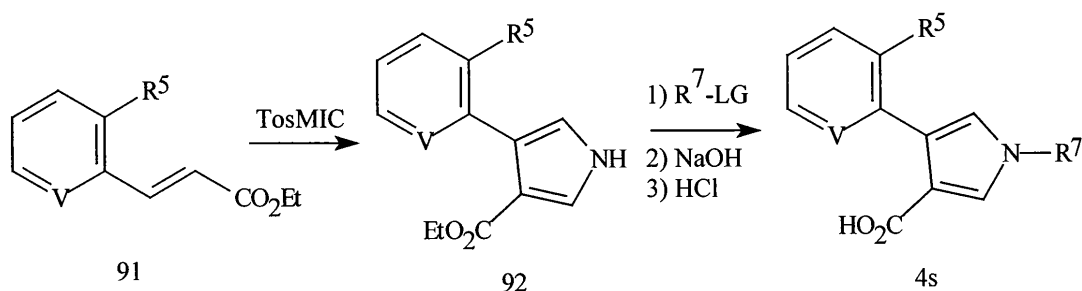
【0159】

好ましい部分 J-10 (式中、R⁵ は置換フェニルまたは置換 2-ピリジニル環である) に関連する、式 4s のピロール酸の合成をスキーム 38 に示す。その合成は、スキーム 37 について説明されている一般的方法に従って行われる。

【0160】

【化 5 4】

スキーム 38



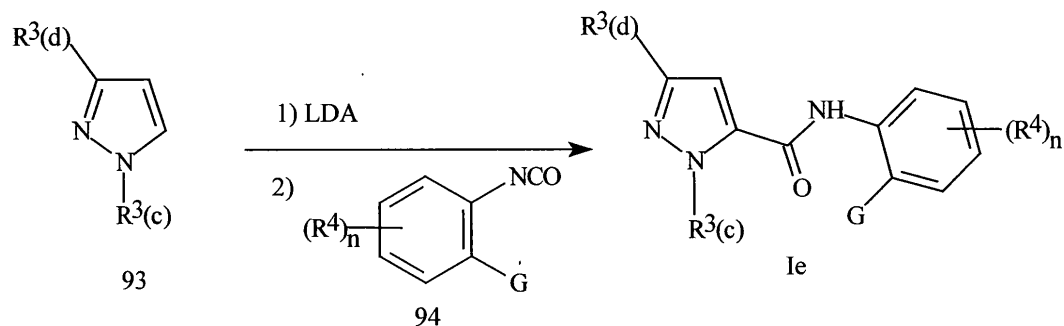
【0161】

式 I e の特定のピラゾールアミド類似体の合成をスキーム 39 に示す。

【0162】

【化 5 5】

スキーム 39



【0163】

この手順では、式 93 のリチオ化誘導体を利用する。式 93 の化合物をリチウムジイソプロピルアミド (LDA) で処理し、続いてそのリチウム塩を式 94 のアリールイソシアネートで急冷することによって、式 I c の化合物、式 I の化合物のサブセットが得られる。アリールイソシアネートは、例えば、ジホスゲンもしくはトリホスゲンなどのホスゲンまたはホスゲン同等物で処理することによって、式 2a の化合物 (スキーム 3 参照) から製造することができる。イソシアネートを製造するための主要な参考文献としては、「マーチ 有機化学〈上〉—反応・機構・構造」第 3 版 (March, Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms and Structure, Third Edition), John Wiley &

10

20

30

40

50

Sons, New York, 1985; p. 370を参照のこと。

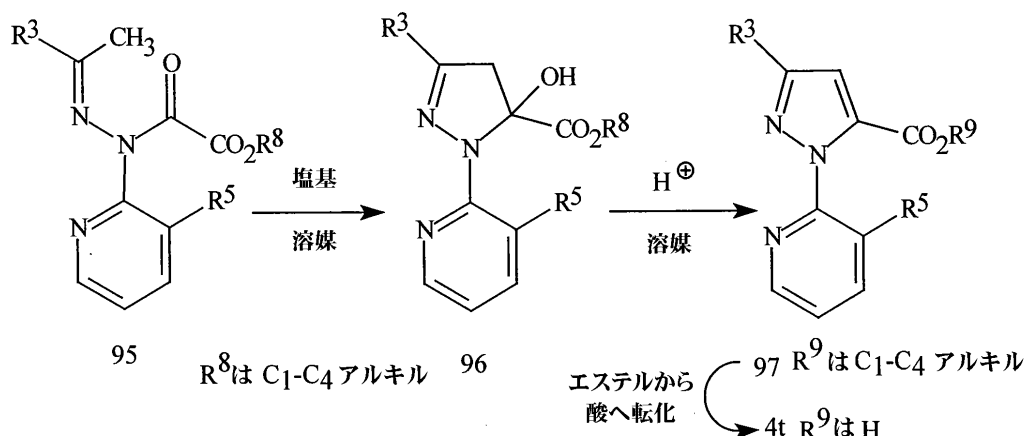
【0164】

式4t（式中、 R^3 は CF_3 である）のピラゾールカルボン酸は、スキーム8に概説される方法によって製造することができる。

【0165】

【化56】

スキーム40



【0166】

式95（式中、 R^8 は $C_1 \sim C_4$ アルキルである）の化合物を適切な有機溶媒中で適切な塩基と反応させることによって、酢酸などの酸で中和した後に式96の環化生成物が得られる。適切な塩基としては、限定されないが、例えば水素化ナトリウム、カリウムトートキシド、ジメチルナトリウム（ $CH_3S(O)CH_2^-Na^+$ ）、アルカリ金属（リチウム、ナトリウムまたはカリウムなどの）炭酸塩または水酸化物、テトラアルキル（メチル、エチルまたはブチルなど）アンモニウムフッ化物または水酸化物、または2-トートキシルイミノ-2-ジエチルアミノ-1,3-ジメチルパーヒドロ-1,3,2-ジアザホスホニンが挙げられる。適切な有機溶媒としては、限定されないが、例えばアセトン、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン、ジメチルスルホキシド、またはN,N-ジメチルホルムアミドが挙げられる。その環化反応は通常、約0～120℃の温度範囲内で行われる。溶媒、塩基温度および付加時間の影響は、すべて互いに依存し、反応条件の選択は、副生成物の形成を最小限に抑えるために重要である。好ましい塩基は、フッ化テトラブチルアンモニウムである。

【0167】

式96の化合物を脱水して式97の化合物を得て、続いて、そのカルボン酸エステル官能基をカルボン酸に転化することによって、式4tの化合物が得られる。その脱水は、触媒量の適切な酸で処理することによって行われる。この触媒作用を及ぼす酸としては、限定されないが、硫酸が挙げられる。その反応は一般に、有機溶媒を用いて行われる。当業者であれば理解されるように、脱水反応は、約0～200℃、さらに好ましくは約0～100℃の温度範囲で多種多様な溶媒中にて行われる。スキーム40の方法における脱水に関しては、酢酸を含んでなる溶媒および温度約65℃が好ましい。カルボン酸エステル化合物は、無水条件下での求核的切断を含む多数の方法および酸または塩基の使用を含む加水分解法によってカルボン酸化合物に転化することができる（方法の概要について、T. W. Greene and P. G. M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed., John Wiley & Sons, Inc., New York, 1991, pp. 224-269を参照のこと）。スキーム40の方法については、塩基触媒加水分解法が好ましい。適切な塩基としては、アルカリ金属（リチウム、ナトリウムまたはカリウムなど）水酸化物が含まれる。例えば、そのエステルは、水とエタノールなどのアルコールとの混合物中で溶解す

ることができる。水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムで処理すると、そのエステルはけん化されて、カルボン酸のナトリウム塩またはカリウム塩が得られる。塩化水素酸または硫酸などの強酸で酸性化することによって、式 4 t のカルボン酸が得られる。そのカルボン酸は、結晶化、抽出および蒸留を含む当業者に公知の方法によって単離することができる。

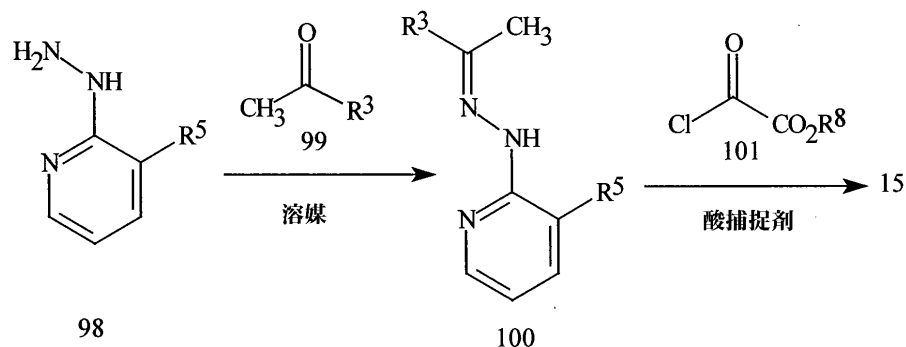
【0168】

式 95 の化合物は、スキーム 41 で概説される方法によって製造することができる。

【0169】

【化 57】

スキーム 41



式中、 R^3 は CF_3 であり、 R^8 は C_1 - C_4 アルキル

【0170】

水、メタノールまたは酢酸などの溶媒中で、式 98 のヒドラジン化合物を式 99 のケトンで処理することによって、式 100 のヒドラゾンが得られる。当業者であれば、この反応には任意の酸による触媒作用が必要な場合があり、式 100 のヒドラゾンの分子置換パターンに応じて高温も必要とされる場合があることは理解されよう。限定されないが、例えばジクロロメタンまたはテトロヒドロフランなどの適切な溶媒中で、トリエチルアミンなどの酸捕捉剤の存在下にて、式 100 のヒドラゾンを式 101 の化合物と反応させることによって、式 95 の化合物が得られる。その反応は通常、温度約 $0 \sim 100^\circ\text{C}$ で行われる。式 98 のヒドラジン化合物は、標準法によって、例えば式 15 a の相当するハロ化合物（スキーム 9 a）をヒドラジンで処理することによって製造することができる。

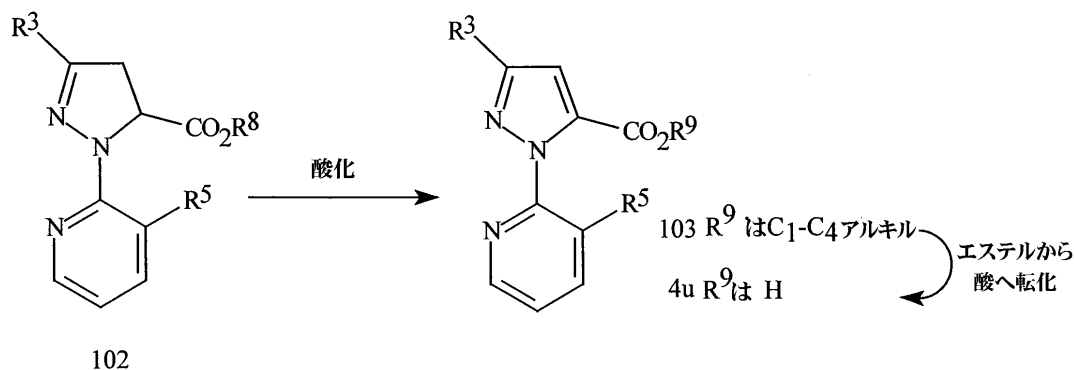
【0171】

式 4 u（式中、 R^3 は Cl または Br である）のピラゾールカルボン酸は、スキーム 42 に概説される方法によって製造することができる。

【0172】

【化 5 8】

スキーム 42



10

式中、 R^8 は C_1 - C_4 アルキル

【0173】

式102の化合物を場合により酸の存在下で酸化して、式103の化合物を生成し、続いてカルボン酸エステル官能基をカルボン酸に転化することによって、式4uの化合物が得られる。その酸化剤としては、過酸化水素、有機過酸化物、過硫酸カリウム、過硫酸ナトリウム、過硫酸アンモニウム、モノ過硫酸カリウム（例えば、オキソン（Oxone）（登録商標））または過マンガン酸カリウムが挙げられる。完全に転化するために、式102の化合物に対して少なくとも1当量の酸化剤を使用すべきであり、好ましくは約1～2当量である。この酸化は通常、溶媒の存在下にて行われる。溶媒としては、テトラヒドロフラン、p-ジオキサン等のエーテル、酢酸エチル、炭酸ジメチル等の有機エステル、またはN,N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル等の極性非プロトン性溶媒が挙げられる。酸化段階で使用するのに適した酸としては、硫酸、リン酸等の無機酸、および酢酸、安息香酸等の有機酸が挙げられる。使用する場合、その酸は、式102の化合物に対して0.1当量を超える量で使用すべきである。完全に転化するために、酸を1～5当量使用することができる。好ましい酸化剤は過硫酸カリウムであり、その酸化は、硫酸の存在下にて行うことが好ましい。その反応は、望ましい溶媒中で式102の化合物と、使用する場合には酸と混合することによって行うことができる。次いで、酸化剤を適当な割合で添加することができる。反応温度は通常、反応を完了するための適度な反応時間、好ましくは8時間未満を得るために、約0℃と低い温度から溶媒の沸点までと様々である。所望の生成物、式103の化合物は、結晶化、抽出および蒸留を含む当業者に公知の方法によって単離することができる。式103のエステルを式4uのカルボン酸に転化するのに適した方法はスキーム40に既に記述されている。

20

30

【0174】

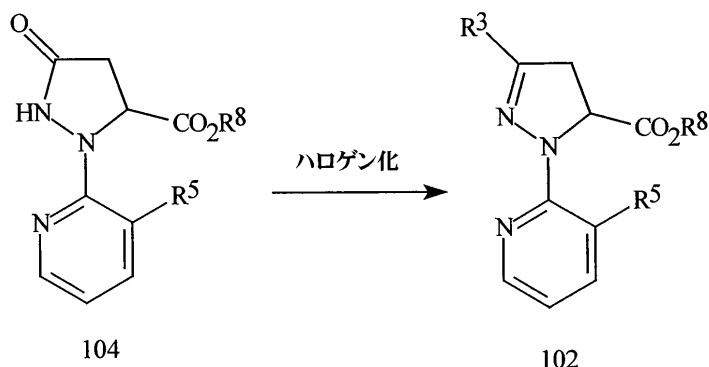
式102の化合物は、スキーム43で示される式104の相当する化合物から製造することができる。

【0175】

40

【化 5 9】

スキーム 43

式中、R⁸はC₁-C₄アルキル

【0176】

通常は溶媒の存在下において式104の化合物をハロゲン化剤で処理することによって、式102の相当するハロ化合物が得られる。使用することができるハロゲン化剤としては、オキシハロゲン化リン、三ハロゲン化リン、五ハロゲン化リン、塩化チオニル、ジハロトリアルキルホスホラン、ジハロジフェニルホスホラン、塩化オキサリルおよびホスゲンが挙げられる。オキシハロゲン化リンおよび五ハロゲン化リンが好ましい。完全に転化するために、式104の化合物に対して少なくとも0.33当量のオキシハロゲン化リンを使用すべきであり、好ましくは約0.33~1.2当量である。完全に転化するために、式104の化合物に対して少なくとも0.20当量の五ハロゲン化リンを使用すべきであり、好ましくは約0.20~1.0当量である。式104（式中、R⁶はC₁~C₄アルキルである）の化合物がこの反応には好ましい。このハロゲン化に用いられる一般的な溶媒としては、ジクロロメタン、クロロホルム、クロロブタン等のハロゲン化アルカン、ベンゼン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族溶媒、テトラヒドロフラン、p-ジオキサン、ジエチルエーテル等のエーテル、およびアセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド等の極性非プロトン性溶媒が挙げられる。場合により、トリエチルアミン、ピリジン、N,N-ジメチルアニリン等の有機塩基を添加してもよい。N,N-ジメチルホルムアミド、などの触媒の添加もまた、任意である。溶媒がアセトニトリルであり、かつ塩基が存在しないプロセスが好ましい。通常、アセトニトリル溶媒を使用する場合には、塩基も触媒も必要ない。好ましいプロセスは、アセトニトリル中で式104の化合物を混合することによって行われる。次いで、ハロゲン化剤を適当な時間にわたり添加し、次いで反応が完了するまで、その混合物を望ましい温度に維持する。その反応温度は通常、20℃~アセトニトリルの沸点であり、反応時間は通常、2時間未満である。次いで、反応物を重炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基、または酢酸ナトリウムなどの有機塩基で中和する。所望の生成物、式102の化合物を、結晶化、抽出および蒸留を含む当業者に公知の方法によって単離することができる。

【0177】

あるいは、式102（式中、R³はBrまたはClである）の化合物は、式102（式中、R³が異なるハロゲン（例えば、式102（R³はBrである）を製造する場合、Cl）またはp-トルエンスルホネートなどのスルホネート基である）の相当する化合物をそれぞれ臭化水素または塩化水素で処理することによって製造することができる。この方法によって、式102の出発化合物のR³ハロゲンまたはスルホネート置換基が、臭化水素または塩化水素それぞれからのBrまたはClで置換される。この反応は、ジプロモメタン、ジクロロメタンまたはアセトニトリルなどの適切な溶媒中で行われる。この反応は、圧力容器中で気圧にて、または気圧付近で、または気圧を超える圧力で行うことができる。式102の出発化合物におけるR³が、Clなどのハロゲンである場合、反応から生

じたハロゲン化水素がスパージングまたは他の適切な手段によって除去されるように、反応を行うことが好ましい。この反応は、温度約0～100℃、最も好都合なことには周囲温度付近（例えば、約10～40℃）で、さらに好ましくは20～30℃で行うことができる。ルイス酸触媒（式102（ R^3 はBrである）を製造するには、三臭化アルミニウムなどを添加することによって、反応を促進することができる。式102の生成物は、抽出、蒸留および結晶化を含む、当業者に公知の通常の方法によって単離される。

【0178】

式102（式中、 R^3 はClまたはBrである）の出発化合物は、既に示されている式104の相当する化合物から製造することができる。式102（式中、 R^3 がスルホネート基である）の出発化合物も同様に、ジクロロメタンなどの適切な溶媒中で、塩化スルホニル（例えば、塩化p-トルエンスルホニル）および第3級アミン（例えば、トリエチルアミン）などの塩基での処理などの標準法によって式104の対応する化合物から製造することができる。

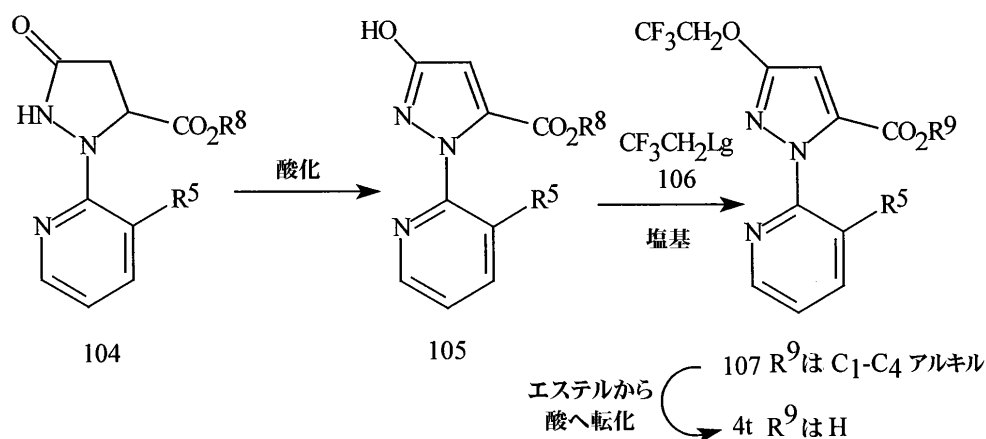
【0179】

式4v（式中、 R^3 は $OC_2H_4CF_3$ である）のピラゾールカルボン酸は、スキーム44に概説されている方法によって製造することができる。

【0180】

【化60】

スキーム 44



式中、 R^8 はC₁-C₄アルキルであり、Lgは脱離基

【0181】

この方法において、スキーム43に示されるようにハロゲン化する代わりに、式104の化合物を式105の化合物に酸化する。この酸化の反応条件は、スキーム42における式102の化合物の式103の化合物への転化に関して既に記述されている。

【0182】

次いで、塩基の存在下にてアルキル化剤 CF_3CH_2Lg （106）と接触させることによって、式105の化合物をアルキル化し、式107の化合物が形成される。アルキル化剤106において、Lgは、ハロゲン（例えば、Br、I）、 $OS(O)_2CH_3$ （メタンスルホネート）、 $OS(O)_2CF_3$ 、 $OS(O)_2Ph-p-CH_3$ （p-トルエンスルホネート）等の求核反応脱離基であり；メタンスルホネートがうまく機能する。その反応は少なくとも1当量の塩基の存在下にて行われる。適切な塩基としては、アルカリ金属（例えば、リチウム、ナトリウムまたはカリウム）炭酸塩および水酸化物などの無機塩基、およびトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンおよび1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデカー7-エンなどの有機塩基が挙げられる。この反応は一般に、メタノールおよびエタノールなどのアルコール、ジクロロメタンなどのハロゲン化アルカン、ベンゼン、トルエンおよびクロロベンゼンなどの芳香族溶媒、テトラヒドロフラン

などのエーテル、およびアセトニトリル、N，N－ジメチルホルムアミドなどの極性非プロトン性溶媒等を含み得る溶媒中で行われる。アルコールおよび極性非プロトン性溶媒が無機塩基と共に使用するのに好ましい。塩基として炭酸カリウム、溶媒としてアセトニトリルが好ましい。その反応は一般に、約0～150℃、最も一般的には周囲温度～100℃で行われる。式107の生成物は、抽出などの従来技術によって単離することができる。次いで、式107のエステルは、スキーム40における式97の式4tへの転化に関して既に記述されている方法によって、式4vのカルボン酸に転化することができる。

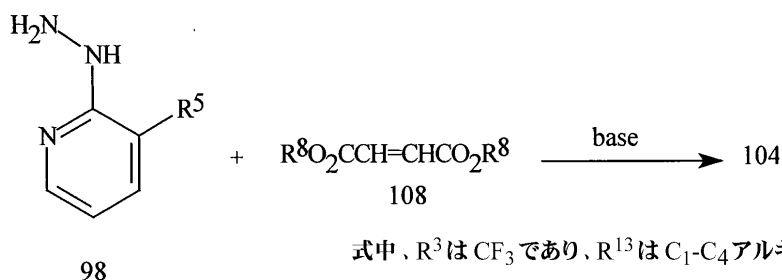
【0183】

式104の化合物は、スキーム45において概説されている式98の化合物から製造することができる。

【0184】

【化61】

スキーム45



式中、 R^8 は $\text{C}_1\text{-C}_4$ アルキル

【0185】

この方法において、式98のヒドラジン化合物を、式108の化合物（フマル酸エステルまたはマレイン酸エステルまたはその混合物が使用できる）と塩基および溶媒の存在下にて接触させる。塩基は通常、ナトリウムメトキシド、カリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド、リチウムt-ブトキシド等の金属アルコキシド塩である。式108の化合物に対して0.5当量を超える塩基を使用すべきであり、好ましくは0.9～1.3当量である。1.0当量を超える式108の化合物を使用すべきであり、好ましくは1.0～1.3当量である。アルコール、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、N，N－ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の極性プロトン性および極性非プロトン性溶媒を使用することができる。好ましい溶媒は、メタノールおよびエタノールなどのアルコールである。そのアルコールは、フマル酸エステルまたはマレイン酸エステルおよびアルコキシド塩基を構成するものと同じであることが特に好ましい。その反応は通常、式108の化合物と塩基とを溶媒中で混合することによって行われる。その混合物を加熱するか、または望ましい温度に冷却し、式108の化合物をある期間にわたって添加する。通常、反応温度は0℃～使用する溶媒の沸点である。反応は、溶媒の沸点を上げるために、気圧より高い圧力下にて行われる。約30～90℃の温度が一般に好ましい。添加時間は、熱伝達が許す限りできるだけ迅速である。通常の添加時間は1分～2時間である。最適な温度および添加時間は、式98および式108の化合物の個性に応じて異なる。添加した後、反応混合物を反応温度にて一定時間保持する。反応温度に応じて、必要とされる保持時間は、0～2時間である。通常の保持時間は10～60分である。次いで、反応物を酢酸などの有機酸、または塩酸、硫酸などの無機酸を添加することによって酸性化される。反応条件および単離手段に応じて、式104の化合物の $-\text{CO}_2\text{R}^8$ 官能基が $-\text{CO}_2\text{H}$ に加水分解される；例えば、反応混合物中に水が存在すると、かかる加水分解が促進される。カルボン酸（ $-\text{CO}_2\text{H}$ ）が形成されると、当技術分野で公知のエステル化法を用いて、それは転化され、 $-\text{CO}_2\text{R}^8$ （式中、 R^8 は $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルである）に戻される。所望の生成物、式104の化合物は

、結晶化、抽出または蒸留などの当業者に公知の方法によって単離される。

【0186】

式 I の化合物を製造するための上述のいくつかの試薬および反応条件は、中間体に存在する特定の官能基と適合しない場合があることを理解されたい。これらの場合に、保護／脱保護シーケンスまたは官能基の相互転換を合成へ組み込むことは、所望の生成物を得る助けとなるだろう。保護基の使用および選択は、化学合成における当業者には明らかであるだろう（例えば、Greene, T. W. ; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed. ; Wiley : New York, 1991 参照）。当業者であれば、場合によっては、個々のスキームに示されているように所定の試薬を導入した後、式 I の化合物の合成を完了するために、詳細に説明されていないその他の通常の合成段階を行うことが必要であることは理解されよう。当業者であれば、式 I の化合物を製造するために示されている特定の順序によって意味されるもの以外の順番で、上記のスキームで示される段階の組み合わせを行うことが必要である場合があることもまた理解されよう。

10

【0187】

当業者であれば、式 I の化合物および本明細書に記載の中間体が様々な求電子反応、求核反応、ラジカル反応、有機金属反応、酸化および還元反応にかけられて、置換基を加えるか、または既存の置換基を変更することができることもまた理解されよう。

【0188】

さらに詳述することなく、上記の説明を用いて当業者は、本発明をその最大限まで利用することができると考えられる。したがって、以下の実施例は、単に例示的なものであり決してその明細書を限定するものではないと解釈されるべきである。クロマトグラフ溶媒混合物の場合を除いて、または別段の指定がない限り、パーセンテージは重量による。クロマトグラフ溶媒混合物の部およびパーセンテージは、別段の指定がない限り体積による。¹H NMR スペクトルは、テトラメチルシランからの ppm 低磁場で示され；s は一重項であり、d は二重項であり、t は三重項であり、q は四重項であり、m は多重項であり、dd は二重項の二重項であり、dt は三重項の二重項であり、br s は広い一重項である。

20

【実施例】

【0189】

30

実施例 1

N-[4-ブromo-2-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

段階 A: 4,5-ジヒドロ-2-(3-メチル-2-ニトロフェニル)-1H-イミダゾールの製造

エチレンジアミン (15 mL) 中のメチル 3-メチル-2-ニトロベンゾエート 3.13 g (16.1 mmol) の溶液を還流で 1.5 時間加熱し、そのポイントで溶媒を減圧下にて 130 °C で除去した。次いで、水で冷却する前に、残留物を 190 °C で 1.25 時間加熱し、フラッシュカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、ジクロロメタン中 1% ~ 10% メタノール）によって精製し、段階 A の標題化合物 (0.35 g) を茶色のオイルとして得た。

40

¹H NMR (CDCl₃) δ 7.52 (m, 1H)、7.39 (t, 1H)、7.35 (m, 1H)、3.74 (s, 4H)、2.33 (s, 3H)。

【0190】

段階 B: 2-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルベンゼンアミン

エタノール (50 mL) 中の段階 A の標題化合物 (0.5 g, 2.44 mmol) の溶液に、水酸化パラジウム ((50 mg、炭素上で 20 重量%)。フラスコを 2 回排気し、窒素でフラッシングし、次いで 2 回排気し、水素でフラッシングした。排気する前に、そ

50

の混合物を水素気球下で3時間、激しく攪拌し、空気にさらし、セライト (Celite) (登録商標) のパッドに通して濾過した。その溶液を濃縮し、シリカゲルのパッドに通して濾過し、ジクロロメタン中の5%メタノール、次いで10%メタノール、次いで5%トリエチルアミン、10%メタノール、85%ジクロロメタンで溶離した。トリエチルアミン/メタノール/ジクロロメタン中で溶離する物質を濃縮し、淡褐色のオイルとして段階Bの標題化合物 (0.38 g) を得た。

^1H NMR (CDCl_3) δ 7.3–7.2 (d, 1H)、7.1 (d, 1H)、6.57 (t, 1H)、3.76 (s, 4H)、2.18 (s, 3H)。

【0191】

段階C：4-ブromo-2-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルベンゼンアミンの製造

N,N-ジメチルホルムアミド (10 mL) 中の段階Bの標題化合物 (0.38 g、2.17 mmol) の溶液に、N-ブromosuccinimide (0.38 g、2.13 mmol) を添加し、その混合物を周囲温度で1時間攪拌した。さらにN-ブromosuccinimide (0.06 g、0.34 mmol) を添加し、その混合物を、酢酸エチルで希釈する前にさらに0.5時間攪拌し、水で3回洗浄した。合わせた水性画分を酢酸エチルで抽出し、有機相を水で洗浄した。合わせた有機画分を乾燥させ (硫酸マグネシウム)、濃縮し、フラッシュカラムクロマトグラフィー (シリカゲル、ジクロロメタン中2%、次いで5%メタノール) によって精製し、淡褐色のオイルとして段階Cの標題化合物 (94 mg) を得た。

^1H NMR (CDCl_3) δ 7.33 (d, 1H)、7.18 (d, 1H)、3.76 (s, 4H)、2.15 (s, 3H)。

【0192】

段階D：N-[4-ブromo-2-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

ジメチルホルムアミド (1滴) を含有するジクロロメタン (10 mL) 中の1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸 (119 mg、0.41 mmol) の溶液に、塩化オキサリル (390 μL 、0.48 mmol) を添加した。その混合物を、減圧下にて濃縮する前に、周囲温度で2時間攪拌した。混合物をジクロロメタン (5 mL) に溶解し、ジクロロメタン (5 mL) 中の段階Cの標題化合物 (94 mg、0.37 mmol)、ジメチルアミノピリジン (小さな実験用スパチュラの先端を覆う量として計量される) およびトリエチルアミン (77 μL 、0.56 mmol) の溶液に加えた。その混合物を、重炭酸ナトリウムの飽和溶液を添加する前に、周囲温度で一晩攪拌した。セライト (Celite) (登録商標) 濾過助剤のカラムを通して濾過し、濃縮し、フラッシュカラムクロマトグラフィー (シリカゲル、クロロホルム中5%、次いで20%アセトン、次いでジクロロメタン中1%、次いで2%、次いで5%メタノール) によって精製し、実施例1の標題化合物、本発明の化合物を白色の固体 (22 mg) として得た。

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.5 (dd, 1H)、7.9 (dd, 1H)、7.5 (dd, 1H)、7.4 (m, 2H)、7.30 (s, 1H)、3.79 (s, 4H)、2.20 (s, 3H)。

【0193】

実施例2

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

段階A：2-(3-メチル-2-ニトロフェニル)-1H-イミダゾールの製造

ジメチルホルムアミド (20 mL) 中の実施例1の標題化合物、段階A (0.35 g、1.71 mmol) の溶液に、活性二酸化マンガン (4.46 g、51.3 mmol) を

添加し、その混合物を120℃で2時間加熱した。冷却した後、その混合物を酢酸エチルで希釈し、セライト（Celite）（登録商標）のパッドに通して濾過し、水で3回洗浄し、塩化ナトリウムの飽和溶液で1回洗浄した。有機相を乾燥させ（硫酸マグネシウム）、濃縮し、フラッシュカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、ヘキサン中で60%、次いで80%エチルエーテル、次いでエチルエーテル）によって精製し、段階Aの標題化合物（0.1g）を白色の固体として得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 7.76 (d, 1H)、7.46 (t, 1H)、7.33 (d, 1H)、7.3–7.1 (2 x bs, 2H)、2.37 (s, 3H)。

【0194】

段階B：2-（1H-イミダゾール-2-イル）-6-メチルベンゼンアミンの製造 10

エタノール（20mL）中の段階Aの標題化合物（0.1g、0.49mmol）の溶液に、水酸化パラジウム（炭素上で20重量%）（小さな実験用スパチュラの先端を覆う量として計量される）を添加した。フラスコを2回排気し、窒素でフラッシングし、次いで2回排気し、水素でフラッシングした。排気する前に、その混合物を水素気球下で0.45時間激しく攪拌し、空気にさらし、セライト（Celite）（登録商標）のパッドに通して濾過した。濃縮することによって、段階Bの標題化合物をオフホワイトの固体（82mg）を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 7.3–7.2 (m, 2H)、7.1 (m, 2H)、6.67 (t, 1H)、6.0 (bs)、2.23 (s, 3H)。

【0195】

段階C：1-（3-クロロ-2-ピリジニル）-N-〔2-1H-イミダゾール-2-イル）-6-メチルフェニル〕-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造 20

ジメチルホルムアミド（1滴）を含有するジクロロメタン（5mL）中の1-（3-クロロ-2-ピリジニル）-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボン酸（165mg、0.57mmol）の溶液に、塩化オキサリル（54 μ L、0.61mmol）を得た。その混合物を、減圧下で濃縮する前に周囲温度で2時間攪拌し、ジクロロメタン（5mL）に溶解した。ジイソプロピルエチルアミン（127 μ L、0.71mmol）を添加し、続いて段階Bの標題化合物（82mg、0.47mmol）を添加し、その混合物を周囲温度で4時間攪拌した。次いで、ジメチルアミノピリジン（小さな実験用スパチュラの先端を覆う量として計量される）を添加し、その混合物を周囲温度で一晩攪拌した。次いで、重炭酸ナトリウムの飽和溶液を添加し、その混合物をセライト（Celite）（登録商標）のカラムを通して濾過した。フラッシュカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、ヘキサン中で60%、次いで80%エチルエーテル、次いでエチルエーテル）により濃縮および精製することによって、実施例2の標題化合物、本発明の化合物を、融点224~226℃の白色の固体（0.12g）として得た。

【0196】

実施例3

段階A：N-〔2-（4-ブromo-1H-イミダゾール-2-イル）-6-メチルフェニル〕-1-（3-クロロ-2-ピリジニル）-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造 40

ジクロロメタン（3mL）中の実施例2の標題化合物（0.04g、0.09mmol）の溶液に、N-ブromosクシンイミド（16mg、0.09mmol）を添加し、その混合物を周囲温度で1時間攪拌した。フラッシュカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、ヘキサン中40%、次いで60%、次いで80%エチルエーテル）による精製によって、実施例3の標題化合物、本発明の化合物を白色の固体（52mg）として得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 11.2 (s, 1H)、10.9 (bs, 1H)、8.5 (dd, 1H)、8.2 (bs, 1H)、8.0–7.9 (dd, 1H)、7.53 (s, 1H)、7.5 (dd, 1H)、7.01 (bd, 1H)、6.70 (t, 1H)、6.63 (bd, 1H)、2.30 (s, 3H)。

【0197】

実施例 4

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2,4-ジクロロ-6-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

段階A: 2,4-ジクロロ-6-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)ベンゼンアミンの製造

-20℃のエチルエーテル(50 mL)中のエチレンジアミン(1.2 mL、18 mmol)の溶液に、n-ブチルリチウム(6.4 mL、ヘキサン中で2.5 M、16 mmol)を添加した。その混合物を、2,4-ジクロロ-6-トリフルオロメチルアニリン(0.92 g、4.2 mmol)を添加する前に、0℃で0.3時間攪拌した。混合物を0℃でさらに1.5時間攪拌し、そのポイントで、水(0.36 mL、20 mmol)を添加し、減圧下で溶媒を除去した。フラッシュカラムクロマトグラフィー(シリカゲル、ジクロロメタン中1%~10%メタノール)より精製し、段階Aの標題化合物(0.35 g)を黄色の固体として得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ 7.30 (d, 1H)、7.23 (d, 1H)、6.8 (bs, 2H)、4.7-4.6 (bs, 1H)、3.77 (bs, 4H)。

【0198】

段階B: 1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2,4-ジクロロ-6-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

ジメチルホルムアミド(1滴)を含有するジクロロメタン(10 mL)中の1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸(0.6 g、2.02 mmol)の溶液に、塩化オキサリル(198 μL、2.22 mmol)を添加した。その混合物を、減圧下で濃縮する前に周囲温度で2時間攪拌し、ジクロロメタン(5 mL)に溶解した。この溶液の10分の7を、ジクロロメタン(5 mL)中の段階Aの標題化合物(0.3 g、1.3 mmol)、トリエチルアミン(272 mL、1.95 mmol)およびジメチルアミノピリジン(16 mg、0.13 mmol)の溶液に添加し、その混合物を周囲温度で一晩攪拌した。次いで、重炭酸ナトリウムの飽和溶液を添加し、その混合物をセライト(Celite)(登録商標)のカラムを通して濾過した。濃縮し、フラッシュカラムクロマトグラフィー(シリカゲル、ジクロロメタン中1%、次いで2%、次いで5%メタノール、次いで再び、クロロホルム中10%、次いで20%アセトン、次いでジクロロメタン中5%メタノール)によって精製することによって、実施例4の標題化合物、本発明の化合物を黄色の固体(31 mg)として得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ 8.5-8.4 (d, 1H)、7.9 (d, 1H)、7.46 (d, 1H)、7.41 (d, 1H)、7.4 (dd, 1H)、7.31 (s, 1H)、3.77 (s, 4H)。

【0199】

実施例 5

1-(2-クロロフェニル)-N-[2-(4,5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

段階A: 4,5-ジヒドロ-1-メチル-2-(3-メチル-2-ニトロフェニル)-1H-イミダゾールの製造

N-メチルエチレンジアミン(5 g、68 mmol)中のメチル3-メチル-2-ニトロベンゾエート(3.0 g、15.4 mmol)の溶液を還流で1.5時間加熱し、そのポイントで溶媒を減圧下にて130℃で除去した。次いで、残留物を氷で冷却する前に190℃で1.25時間加熱し、段階Aの標題化合物(純度75%)を茶色のオイルとして得た。

¹H NMR (CDCl₃) δ 7.5 (m, 1H)、7.4 (m, 2H)、(3.9

0 (t, 2H)、3.51 (t, 2H)、2.74 (s, 3H)、2.43 (s, 3H)。

【0200】

段階B：2-（4，5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル）-6-メチルベンゼンアミン

エタノール（15 mL）中の段階Aの標題化合物（3.37 g、純度75%）の溶液に、水酸化パラジウム（170 mg、炭素上に20重量%）を添加した。フラスコを2回排気し、窒素でフラッシングし、次いで2回排気し、水素でフラッシングした。その混合物を、排気する前に水素気球下で3時間激しく攪拌し、空気にさらし、セライト（Celite）（登録商標）のパッドを通して濾過した。その溶液を濃縮し、シリカゲルのパッドを通して濾過し、ジクロロメタン中1%、次いで5%、次いで10%メタノール、次いで5%トリエチルアミン、10%メタノール、85%ジクロロメタンで溶離した。トリエチルアミン/メタノール/ジクロロメタン中で溶離する物質を濃縮し、段階Bの標題化合物（1.5 g）をオフホワイトの固体として得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 7.3 (d, 1H)、7.1 (d, 1H)、6.9 (bs, 1H)、6.6 (t, 1H)、5.6 (bs, 1H)、3.6-3.5 (m, 2H)、2.9 (t, 2H)、2.47 (s, 3H)、2.16 (s, 3H)。

【0201】

段階C：1-（2-クロロフェニル）-N-〔2-（4，5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル）-6-メチルフェニル〕-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

ジメチルホルムアミド（1滴）を含有するジクロロメタン（10 mL）中の1-（2-クロロフェニル）-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボン酸（1.2 g、4.13 mmol）の溶液に、塩化オキサリル（390 μ L、4.47 mmol）を添加した。その混合物を、減圧下で濃縮する前に、周囲温度で1時間攪拌した。混合物をジクロロメタン（5 mL）に溶解し、ジクロロメタン（10 mL）中の段階Bの標題化合物（0.65 g、3.44 mmol）、ジメチルアミノピリジン（42 mg、0.34 mmol）およびトリエチルアミン（766 μ L、5.50 mmol）の溶液に添加した。重炭酸ナトリウムの飽和溶液を添加する前に、混合物を周囲温度で3日間攪拌した。その混合物をジクロロメタンで2回抽出し、合わせた有機相を乾燥させ（硫酸マグネシウム）、濃縮し、フラッシュカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、エチルエーテル、次いで酢酸エチル、次いでジクロロメタン中2%、次いで5%メタノール）によって精製した。5%メタノール/ジクロロメタン中で溶離する物質を濃縮し、ジクロロメタンに溶解し、ポリスチレン樹脂（フルカ（Fluka）カタログ番号90603）上の1，5，7-トリアザビシクロ-[4.4.0]-デカ-5-エン1 gと共に0.5時間振とうした。濾過し、濃縮することによって、実施例5の標題化合物、本発明の化合物（0.16 g）を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 7.6-7.5 (m, 1H)、7.4 (m, 3H)、7.2 (m, 4H)、3.85 (t, 2H)、3.4 (bm, 2H)、2.71 (s, 3H)、2.17 (s, 3H)。

【0202】

実施例6

1-（2-クロロフェニル）-N-〔2-メチル-6-（1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル）フェニル〕-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

トルエン（20 mL）中の実施例5の標題化合物（35 mg、76 μ mol）の溶液に、活性二酸化マンガンを（132 mg、1.52 mmol）を添加し、その混合物を、セライト（Celite）（登録商標）のパッドを通して濾過する前に、還流で3日間加熱した。濃縮し、フラッシュカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、ヘキサン中で60%、次いで80%エチルエーテル、次いでエチルエーテル）によって精製することによって、

実施例 6 の標題化合物、本発明の化合物 (19 mg) を得た。

^1H NMR (CDCl_3) δ 10.5 (bs, 1H)、7.5 (m, 1H)、7.4 (m, 3H)、7.3–7.2 (m, 4H)、7.13 (d, 1H)、6.95 (d, 1H)、3.65 (s, 3H)、2.26 (s, 3H)。

【0203】

実施例 7

N-[4-ブromo-2-(4,5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-1-(2-クロロフェニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

ジクロロメタン (3 mL) 中の実施例 5 の標題化合物 (68 mg、0.15 mmol) の溶液に、N-ブromosuccinimide (26 mg、0.15 mmol) を添加した。その混合物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (シリカゲル、ジクロロメタン中で 2%、次いで 5% メタノール) によって精製する前に、周囲温度で一晩攪拌し、実施例 7 の標題化合物、本発明の化合物 (36 mg) を得た。

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.02 (s, 1H)、7.7–7.6 (d, 1H)、7.5–7.4 (m, 4H)、7.3 (d, 1H)、4.0–3.8 (bm, 4H)、2.94 (s, 3H)、2.34 (s, 3H)。

【0204】

実施例 8

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2-メチル-6-(1,4,5,6-テトラヒドロ-4-オキソ-2-ピリミジニル)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド

段階 A: 3-メチル-2-ニトロベンズアミドの製造

メチル 3-メチル-2-ニトロベンズエート (10.02 g、51.3 mmol) を、メタノール (50 mL) 中のアンモニアの 7 N 溶液に添加し、その混合物をフィッシャーポーター (Fisher-Porter) 社製チューブ中で 100 °C にて 3 時間加熱した。次いで、その溶液を冷却し、濃縮し、ジクロロメタンで粉砕して、段階 A の標題化合物を白色の固体 (1.4 g) として得た。

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.2 (bs, 1H)、7.7 (bs, 1H)、7.6 (m, 3H)、2.28 (s, 3H)。

【0205】

段階 B: メチル 3-メチル-2-ニトロベンゼンカルボキシイミデートテトラフルオロボレートの製造

ジクロロメタン (15 mL) 中の段階 A の標題化合物 (1.07 g、5.9 mmol) の溶液に、トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート (1.06 g、7.1 mmol) を添加し、その混合物を周囲温度で一晩攪拌した。濃縮することによって、段階 B の標題化合物を白色の固体 (1.7 g) として得た。

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 7.8 (m, 3H)、7.1 (t, 1H)、4.00 (s, 3H)、2.41 (s, 3H)。

【0206】

段階 C: 5,6-ジヒドロ-2-(3-メチル-2-ニトロフェニル)-4(1H)-ピリミジノンの製造

メタノール (20 mL) 中の段階 B の標題化合物 (1.7 g、5.9 mmol) の溶液に、 β -アラニンメチルエステル塩酸塩 (832 mg、5.9 mmol) を添加し、続いてナトリウムメトキシド (2.7 mL、メタノール中で 25 重量%、11.8 mmol) を添加し、その混合物を還流で 1.5 時間加熱した。次いで、混合物を冷却し、周囲温度で一晩攪拌し、再び還流で 3 時間加熱した。次いで、混合物を冷却し、濃縮し、ジクロロメタンで粉砕した。次いで、可溶性の画分をフラッシュカラムクロマトグラフィー (シリカゲル、エチルエーテル) によって精製し、段階 C の標題化合物を白色の固体 (0.12 g) として得た。

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.4–8.2 (bs, 1H)、7.6–7.4 (m, 3H)、3.80 (t, 2H)、2.53 (t, 2H)、2.40 (s, 3H)。

【0207】

段階D：2-(2-アミノ-3-メチルフェニル)-5,6-ジヒドロ-4(1H)-ピリミジノン

エタノール(10 mL)中の段階Cの標題化合物(0.12 g、0.52 mmol)の溶液に、水酸化パラジウム(炭素上で20重量%) (小さな実験用スパチュラの先端を覆う量として計量される)を添加した。フラスコを2回排気し、窒素でフラッシングし、次いで2回排気し、水素でフラッシングした。排気する前に、混合物を水素気球下で激しく2時間攪拌し、空気にさらし、セライト(Celite) (登録商標)のパッドを通して濾過した。その溶液を濃縮して、段階Dの標題化合物(0.11 g)を得た。

10

^1H NMR (CDCl_3) δ 8.0 (bs, 1H)、7.2–7.1 (m, 2H)、6.7–6.6 (t, 1H)、6.2 (bs, 2H)、3.91 (t, 2H)、2.56 (t, 2H)、2.19 (s, 3H)。

【0208】

段階E：1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2-メチル-6-(1,4,5,6-テトラヒドロ-4-オキソ-2-ピリミジニル)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの製造

ジメチルホルムアミド(1滴)を含有するジクロロメタン(10 mL)中の1-(2-クロロフェニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボン酸(0.6 g、2.02 mmol)の溶液に、塩化オキサリル(198 μL 、2.22 mmol)を添加した。減圧下で濃縮する前に、混合物を周囲温度で2時間攪拌し、ジクロロメタン(5 mL)に溶解した。この溶液の10分の3を、ジクロロメタン(5 mL)中の段階Dの標題化合物(0.11 g、0.54 mmol)、トリエチルアミン(113 mL、0.81 mmol)およびジメチルアミノ-ピリジン(7 mg、0.05 mmol)の溶液に添加し、その混合物を周囲温度で一晩攪拌した。次いで、重炭酸ナトリウムの飽和溶液を添加し、その混合物をセライト(Celite) (登録商標)のカラムを通して濾過した。濃縮し、フラッシュカラムクロマトグラフィー(シリカゲル、クロロホルム中1%、次いで5%、次いで10%、次いで20%アセトン)によって精製し、実施例8の標題化合物、本発明の化合物を白色の固体(64 mg)として得た。

20

^1H NMR (CDCl_3) δ 11.3 (bs, 1H)、8.5 (dd, 1H)、7.9 (dd, 1H)、7.5–7.4 (m, 1H)、7.4–7.2 (m, 3H)、7.18 (s, 1H)、3.85 (t, 3H)、2.54 (t, 2H)、2.23 (s, 3H)。

30

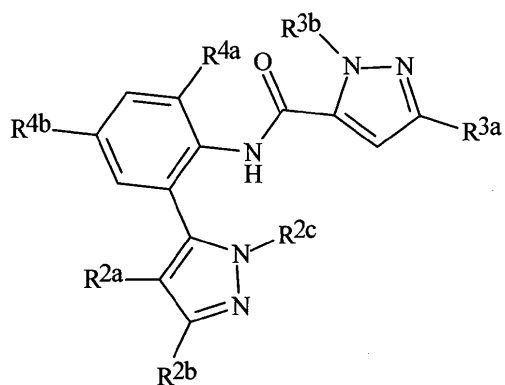
【0209】

当技術分野で公知の方法と共に本明細書に記述されている手順によって、表1～37の以下の化合物を製造することができる。以下の略語を表で用いる：Meはメチルを示し、Etはエチルを示し、Phはフェニルを示す。

【0210】

【表 1】

表 1



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H

【 0 2 1 1 】

【表 2】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	10
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	20
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	30
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	

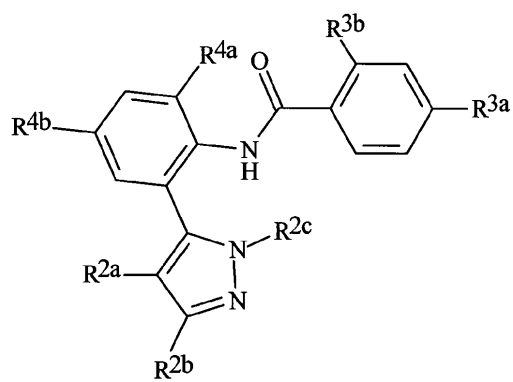
【表 3】

Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	20
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	30

【 0 2 1 3 】

【表 4】

表 2



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl

【 0 2 1 4 】

10

20

【表 5】

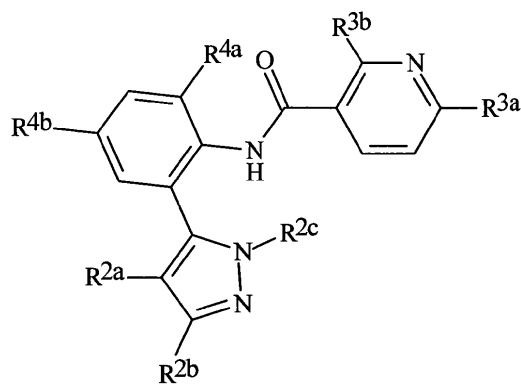
R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	10
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	20
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	30
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	40
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	

【表 6】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	20
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	30
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	40
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【表 7】

表 3



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H

【 0 2 1 7 】

【表 8】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	10
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	20
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	30
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	40
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	

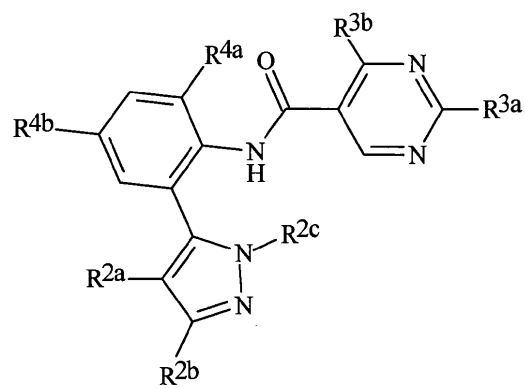
【表 9】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	10
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	20
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 2 1 9 】

【表 1 0】

表 4



10

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br

20

【 0 2 2 0】

【表 1 1】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H	10
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	20
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	30
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	40
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	

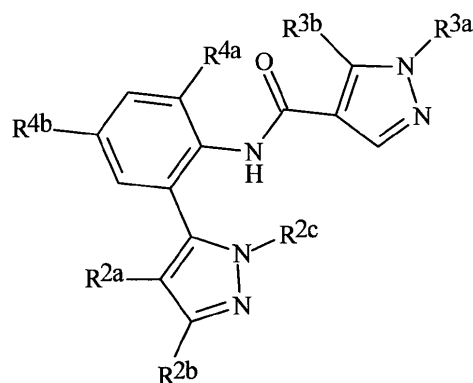
【表 1 2】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	20
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	30
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	40
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 2 2 2 】

【表 1 3】

表 5



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CHF ₂	Ph	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl

【 0 2 2 3 】

【表 1 4】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	20
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	30
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	40
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	

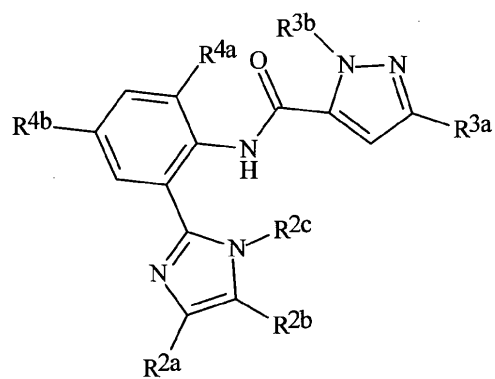
【表 1 5】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	10
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	20
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 2 2 5 】

【表 1 6】

表 6



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H

【 0 2 2 6 】

【表 17】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	10
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	20
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	30
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	40
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

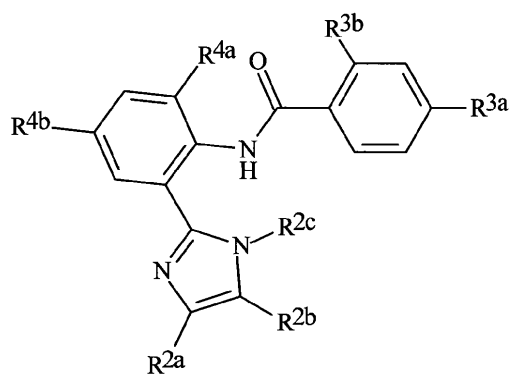
【表 1 8】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	10
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	20
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	30
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40

【 0 2 2 8 】

【表 19】

表 7



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl

【表 20】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	20
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	30
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	40
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	

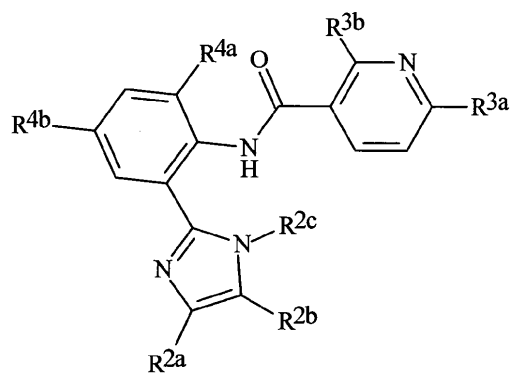
【表 2 1】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	20

【 0 2 3 1 】

【表 2 2】

表 8



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H

【 0 2 3 2 】

10

20

30

【表 2 3】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	10
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	20
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	30
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	40
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	

【 0 2 3 3 】

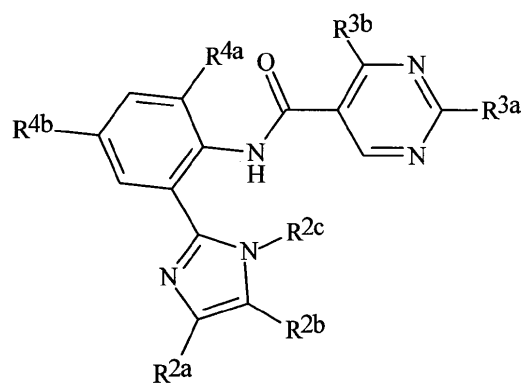
【表 2 4】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	10
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	20
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	30
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40

【 0 2 3 4】

【表 2 5】

表 9



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl

【 0 2 3 5 】

【表 2 6】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	20
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	30
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	40
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	

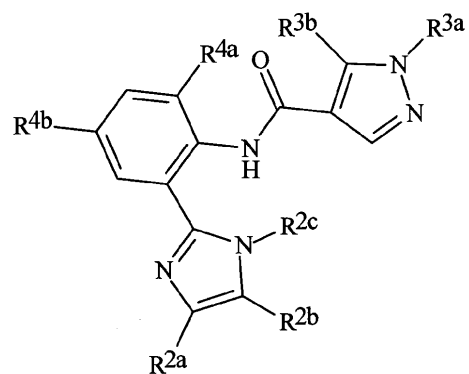
【表 2 7】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	20

【 0 2 3 7 】

【表 2 8】

表 10



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Me	Br
H	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CHF ₂	Ph	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H

【 0 2 3 8】

【表 2 9】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Me	Br	
H	H	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	H	10
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Me	H	
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ヒリジル	Me	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	H	
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ヒリジル	Me	Br	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	20
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Me	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Me	Br	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	30
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Me	H	
H	Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ヒリジル	Me	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ヒリジル	Cl	H	
H	Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ヒリジル	Me	Br	40
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	

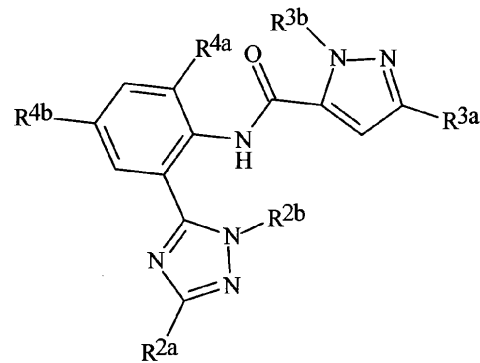
【表 3 0】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	20
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	30
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40

【 0 2 4 0 】

【表 3 1】

表 11



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H

【 0 2 4 1 】

【表 3 2】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

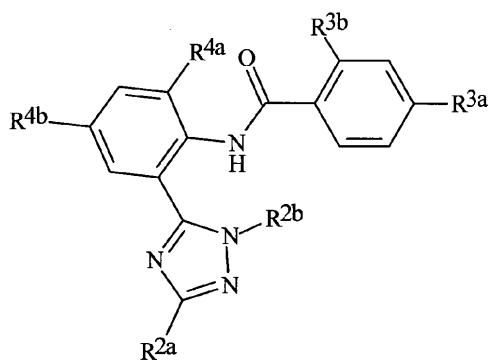
10

【 0 2 4 2 】

20

【表 3 3】

表 12



30

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

40

【 0 2 4 3 】

50

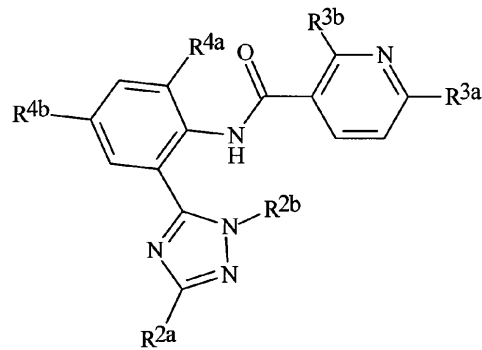
【表 3 4】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl	10
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	20
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl	
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	30
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl	
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 2 4 4 】

【表 3 5】

表 13



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H

【 0 2 4 5 】

【表 3 6】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

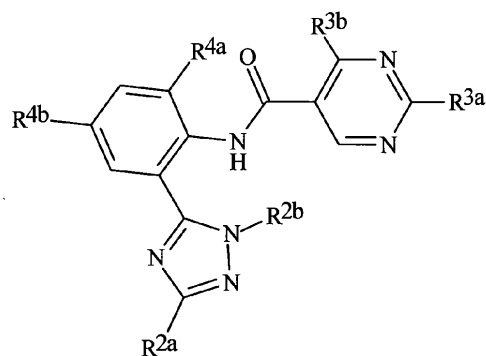
10

【 0 2 4 6 】

20

【表 3 7】

表 14



30

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

40

【 0 2 4 7 】

50

【表 3 8】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

10

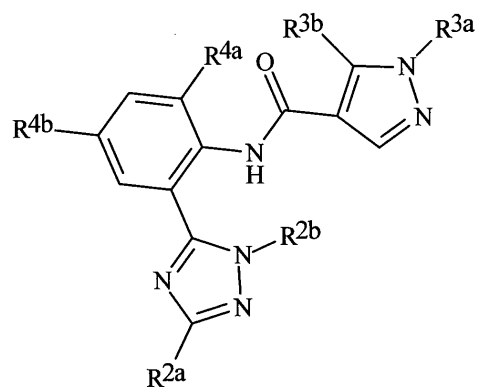
20

30

【 0 2 4 8 】

【表 3 9】

表 15



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
H	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

【表 4 0】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H	
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br	
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	20
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br	
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	30
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	H	
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br	
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	

【表 4 1】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
Me	Me	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
Me	Me	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	H
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

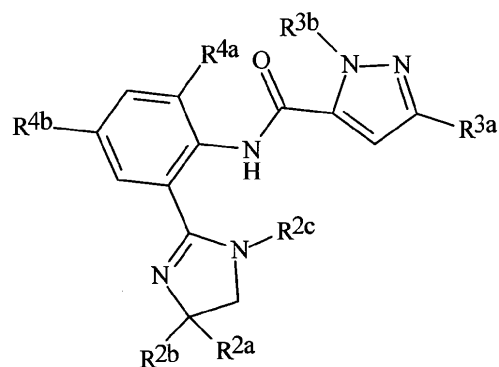
10

【 0 2 5 1 】

20

【表 4 2】

表 16



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H

【 0 2 5 2 】

【表 4 3】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	20
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	30
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	40
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	

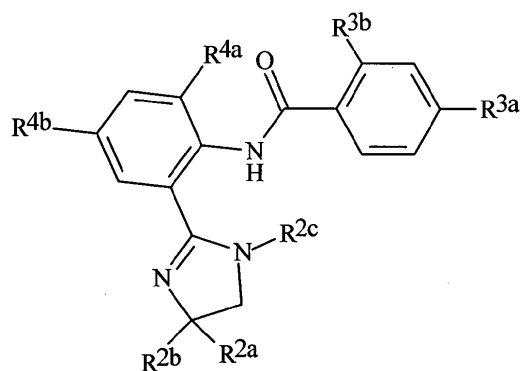
【表 4 4】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	10
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	20
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	30
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 2 5 4 】

【表 4 5】

表 17



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl

【 0 2 5 5 】

【表 4 6】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	20
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	30
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	40
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	

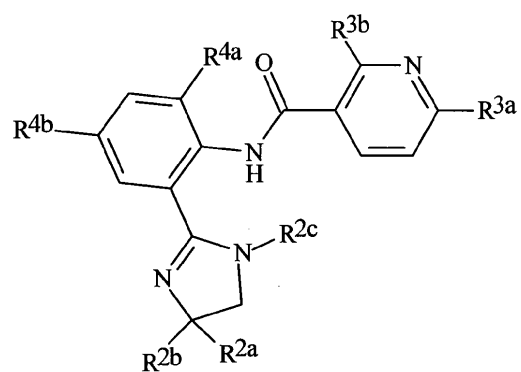
【表 4 7】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	20

【 0 2 5 7 】

【表 4 8】

表 18



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H

【 0 2 5 8 】

【表 4 9】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl

10

20

30

40

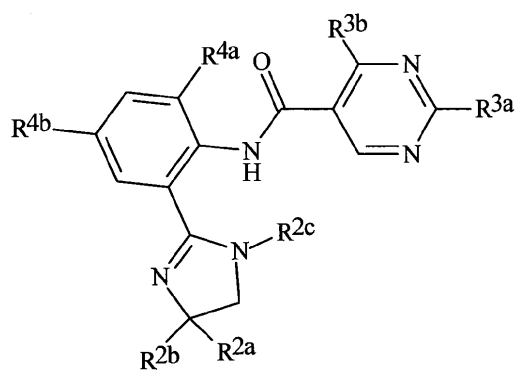
【表 5 0】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	20
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	30
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40

【 0 2 6 0 】

【表 5 1】

表 19



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl

【 0 2 6 1】

【表 5 2】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	20
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	30
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	40
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	

【表 5 3】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

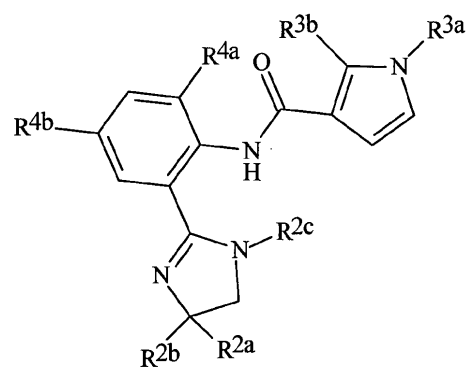
10

20

【 0 2 6 3 】

【表 5 4】

表 20



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CHF ₂	Ph	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H

【 0 2 6 4 】

【表 5 5】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	10
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	20
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	30
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	40
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	

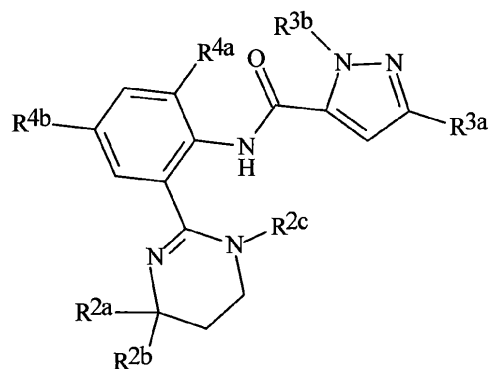
【表 5 6】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	10
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	20
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	30
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40

【 0 2 6 6 】

【表 5 7】

表 21



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl

【 0 2 6 7 】

【表 5 8】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	20
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	30
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	40
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	

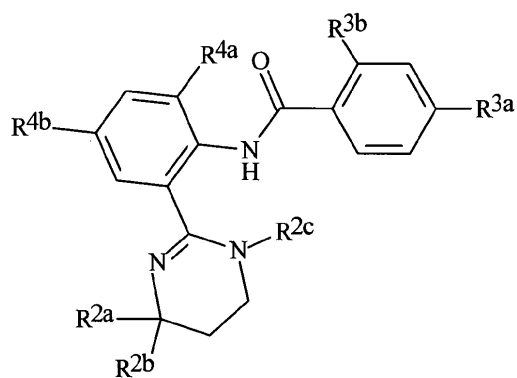
【表 5 9】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	20

【 0 2 6 9】

【表 6 0】

表 22



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H

【 0 2 7 0 】

10

20

30

【表 6 1】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	10
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	20
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	30
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	40
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	

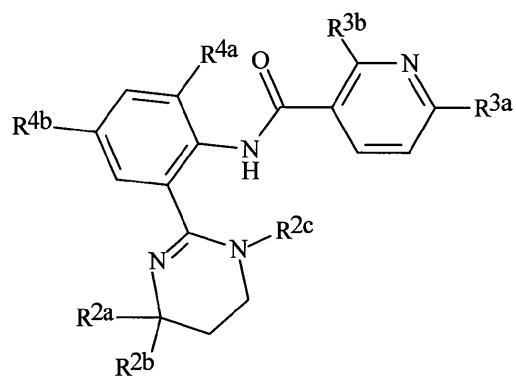
【表 6 2】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	20
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	30
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40

【 0 2 7 2 】

【表 6 3】

表 23



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl

【 0 2 7 3 】

【表 6 4】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	20
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	30
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	40
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	

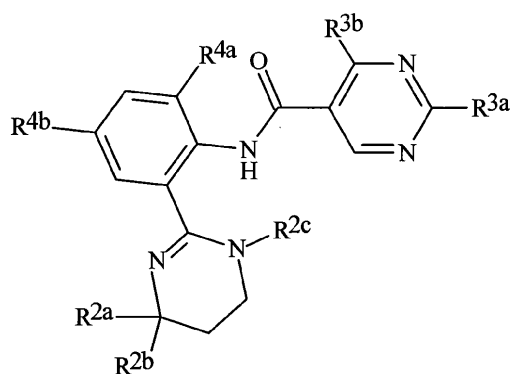
【表 6 5】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	20

【 0 2 7 5 】

【表 6 6】

表 24



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H

【 0 2 7 6 】

【表 6 7】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	10
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	20
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	30
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	40
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	

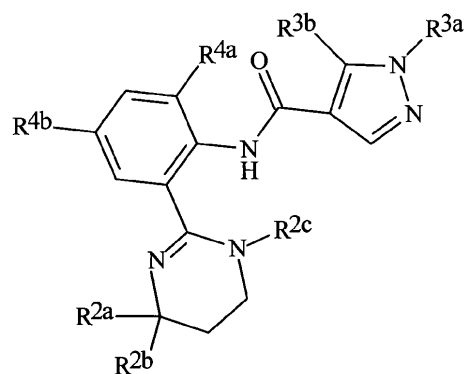
【表 6 8】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	10
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	20
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	30
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40

【 0 2 7 8 】

【表 6 9】

表 25



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CHF ₂	Ph	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl

【 0 2 7 9 】

【表 7 0】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	20
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	30
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	40
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	

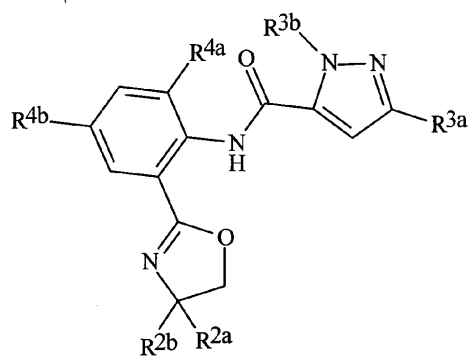
【表 7 1】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	10
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	20

【 0 2 8 1 】

【表 7 2】

表 26



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H

【 0 2 8 2 】

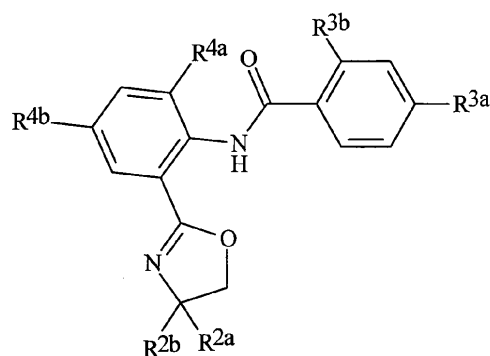
【表 7 3】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

【 0 2 8 3 】

【表 7 4】

表 27



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H

【表 7 5】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

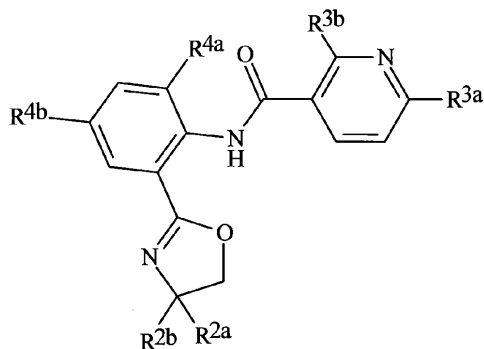
10

【 0 2 8 5 】

20

【表 7 6】

表 28



30

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

40

【 0 2 8 6 】

50

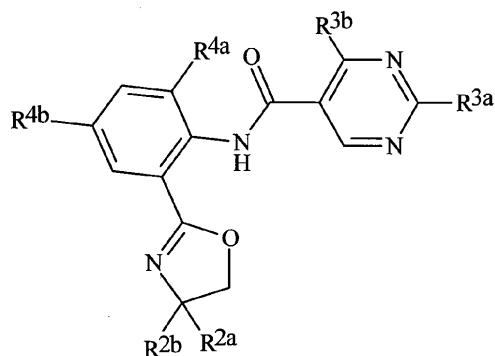
【表 7 7】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl	10
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	20
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl	
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	30
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl	
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 2 8 7 】

【表 7 8】

表 29



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H

【 0 2 8 8 】

【表 7 9】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

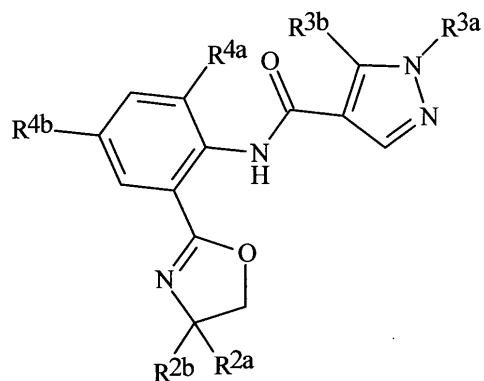
10

【 0 2 8 9 】

20

【表 8 0】

表 30



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
H	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H

【 0 2 9 0 】

【表 8 1】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
H	Me	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
H	Me	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl

【 0 2 9 1 】

10

20

30

40

50

【表 8 2】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	H
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
Me	Me	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
Me	Me	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	H
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

10

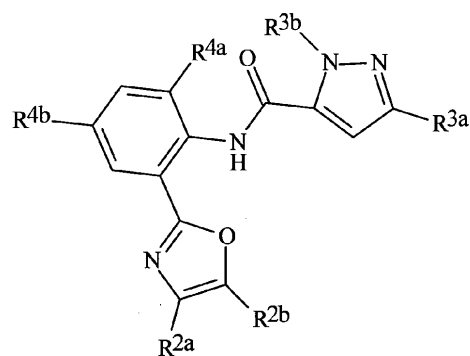
20

30

【 0 2 9 2 】

【表 8 3】

表 31



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H

【 0 2 9 3 】

【表 8 4】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

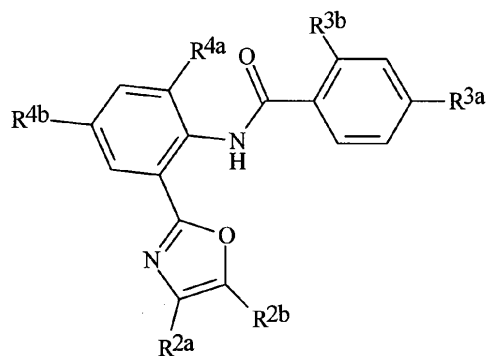
10

【 0 2 9 4 】

20

【表 8 5】

表 32



30

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

40

【 0 2 9 5 】

50

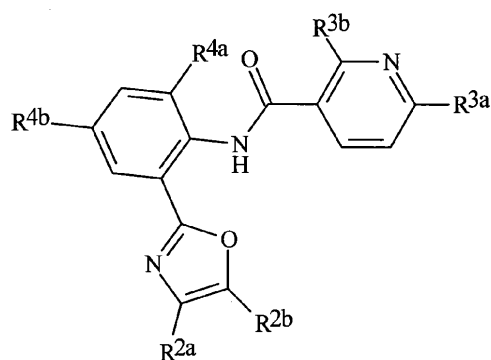
【表 8 6】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl	10
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	20
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl	
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	30
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl	
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 2 9 6 】

【表 8 7】

表 33



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H

【 0 2 9 7 】

【表 8 8】

R2a	R2b	R3a	R3b	R4a	R4b	R2a	R2b	R3a	R3b	R4a	R4b
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

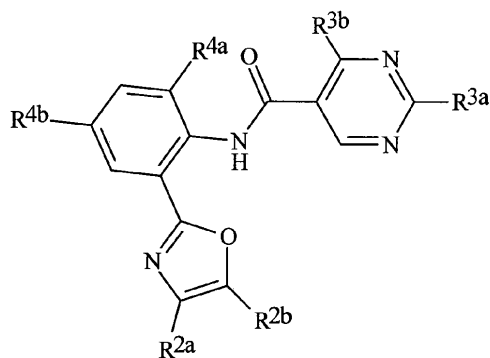
10

【 0 2 9 8 】

20

【表 8 9】

表 34



30

R2a	R2b	R3a	R3b	R4a	R4b	R2a	R2b	R3a	R3b	R4a	R4b
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CF ₃	Et	Me	Br	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

40

【 0 2 9 9 】

50

【表 9 0】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	CF ₃	Et	Me	Br	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

10

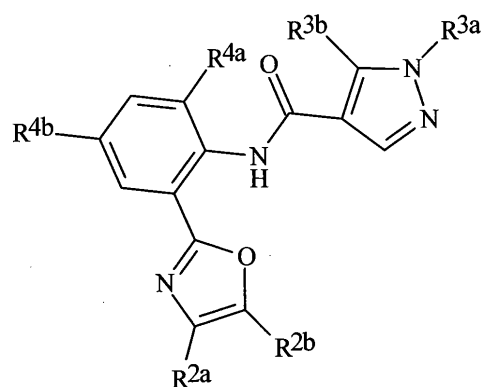
20

30

【 0 3 0 0 】

【表 9 1】

表 35



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
H	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
H	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

【 0 3 0 1 】

【表 9 2】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	H	
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	10
Me	H	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br	
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	20
H	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br	
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl	30
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	H	
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br	
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-ClPh	Me	Br	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	

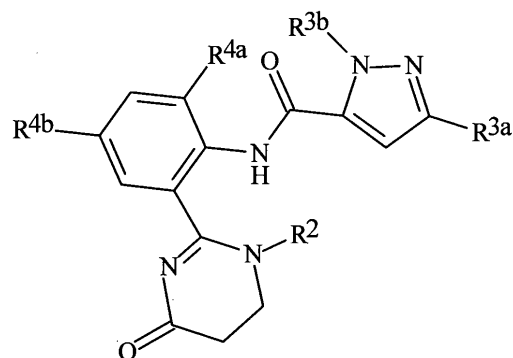
【表 9 3】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Me	CH ₂ CF ₃	Me	Me	Cl
Me	Me	CH ₂ CF ₃	Et	Me	Br
Me	Me	CH ₂ CF ₃	Ph	Me	Cl
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	H
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Cl
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Cl	H
Me	Me	CHF ₂	2-ClPh	Me	Br
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Me	CHF ₂	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

【 0 3 0 3 】

【表 9 4】

表 36



R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	CF ₃	Et	Me	Br	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br

【 0 3 0 4 】

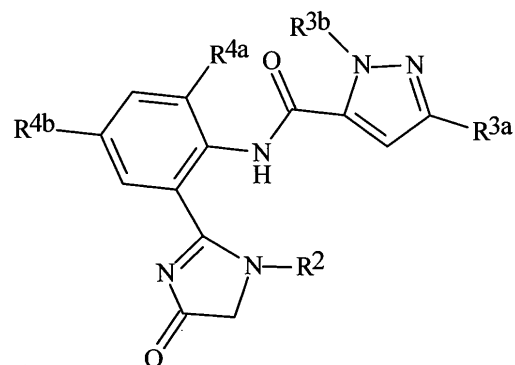
【表 9 5】

R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

【 0 3 0 5 】

【表 9 6】

表 37

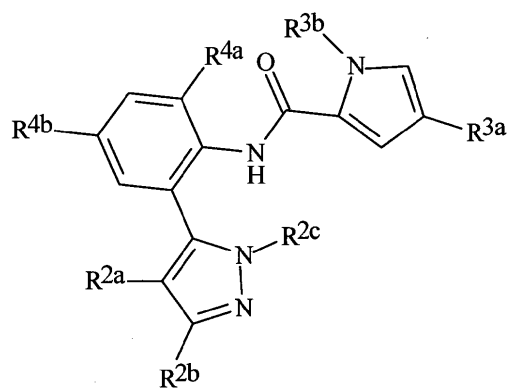


R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{2a}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	CF ₃	Me	Me	Cl	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	CF ₃	Et	Me	Br	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	CF ₃	Ph	Me	Cl	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	Br	2-ClPh	Cl	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	Br	2-ClPh	Me	Cl	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
H	Br	2-ClPh	Cl	Cl	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	CF ₃	Ph	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
Me	Br	2-ClPh	Cl	H	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	Br	2-ClPh	Me	Cl	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	Cl
Me	Br	2-ClPh	Cl	Cl	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	Cl	2-ClPh	Me	Cl	Me	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl

【 0 3 0 6 】

【表 97】

表 38



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H

【表 9 8】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	10
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	20
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	30
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	40
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	

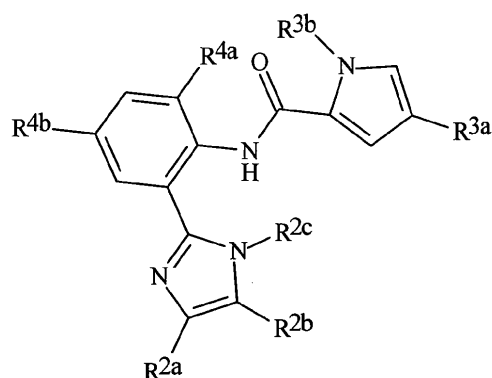
【表 9 9】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	10
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	20
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 3 0 9 】

【表 1 0 0】

表 39



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H

30

40

50

【 0 3 1 0 】

【表 1 0 1】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	10
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	20
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	30
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	40
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	50

【 0 3 1 1 】

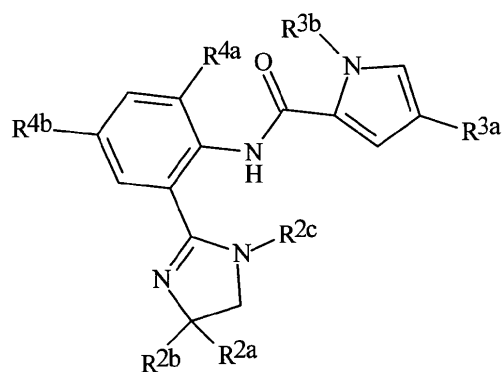
【表 1 0 2】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	10
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	20
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	30
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 3 1 2 】

【表 1 0 3】

表 40



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br

【 0 3 1 3】

【表 1 0 4】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	10
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	20
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	30
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	40
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	

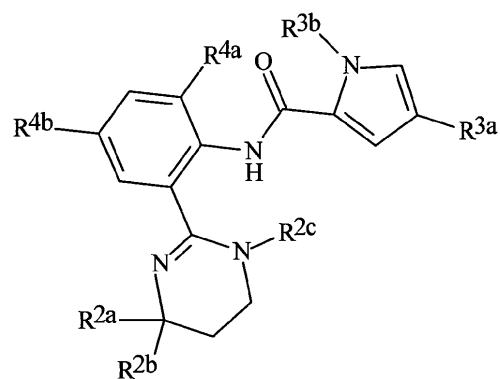
【表 1 0 5】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	10
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	20
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【 0 3 1 5】

【表 1 0 6】

表 41



R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H
H	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H
H	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br
H	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl
H	H	H	CF ₃	Et	Me	Br

【 0 3 1 6 】

10

20

30

【表 1 0 7】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	10
H	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	20
Me	H	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	H	H	CF ₃	Et	Me	Br	
Me	H	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	30
Me	H	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	H	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	H	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	40
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
H	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
H	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	
H	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	

【 0 3 1 7 】

【表 108】

R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
H	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
H	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	H	10
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	CF ₃	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	
Me	Me	H	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	CF ₃	Me	Me	Cl	
Me	Me	H	CF ₃	Et	Me	Br	20
Me	Me	H	CF ₃	Ph	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Cl	2-ClPh	Me	Cl	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	Me	H	Cl	3-Cl-2-ピリジル	Me	Br	
Me	Me	H	Br	2-ClPh	Cl	H	
Me	Me	H	Br	3-Cl-2-ピリジル	Cl	H	30
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	2-ClPh	Me	Cl	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
Me	H	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	CF ₃	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	40
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	H	
H	Me	Me	Br	3-Cl-2-ピリジル	Me	Cl	

【0318】

製剤／用途

本発明の化合物は一般に、少なくとも1種の液体希釈剤、固体希釈剤または界面活性剤を含んでなる、農業的に適する担体と共に製剤または配合物として使用されるだろう。その製剤または配合物の成分は、活性成分の物理的性質、用途の様式、および土壌型、水分および温度などの環境要因と合致するように選択される。有用な製剤としては、溶液（乳剤を含む）、懸濁液、乳濁液（マイクロエマルジョンおよび／またはサスポエマルジョン

を含む)等の溶液など、場合により濃縮してゲルにすることができる液体が挙げられる。有用な製剤としてはさらに、微粉、粉末、顆粒、ペレット、タブレット、フィルムなどの水分散性(「水和性」)または水溶性である固体が挙げられる。活性成分は(マイクロ)カプセル化することができ、さらに懸濁または固形製剤に形成することができる;あるいは、活性成分の全製剤形態をカプセル化(または「オーバーコーティング」)することができる。カプセル化によって、活性成分の放出を制御または遅延することができる。噴霧製剤は適切な媒体中で希釈され、1ヘクタール当たり約百~数百リットルの噴霧体積で使用される。高濃度の配合物は主に、更なる製剤のための中間体として使用される。

【0319】

その製剤は通常、合計100重量%となる以下のおよその範囲内で有効量の活性成分、希釈剤および界面活性剤を含有するだろう。

【0320】

【表109】

	重量%		
	活性原料	希釈剤	界面活性剤
水分散性および水溶性の粒体、 タブレットおよび粉末	5-90	0-94	1-15
懸濁液、乳化液、溶液 (乳化可能なコンセントレートを含む)	5-50	40-95	0-15
粉剤	1-25	70-99	0-5
粒体およびペレット	0.01-99	5-99.99	0-15
高濃度組成物	90-99	0-10	0-2

【0321】

通常の固体希釈剤は、Watkinsら, Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jerseyに記述されている。通常の液体希釈剤は、Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950に記述されている。McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey、ならびにSisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964には、界面活性剤および推奨される用途が示されている。すべての製剤が、泡、固化、腐食、細菌増殖等を低減するための少量の添加剤、または粘度を増大するための増粘剤を含有し得る。

【0322】

界面活性剤としては、例えばポリエトキシ化アルコール、ポリエトキシ化アルキルフェノール、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ジアルキルスルホスクシネート、アルキルスルフェート、アルキルベンゼンスルホネート、有機シリコン、N, N-ジアルキルタウリン塩、リグニンスルホネート、ナフタレンスルホネートホルムアルデヒド凝縮物、ポリカルボキシレート、およびポリオキシエチレン/ポリオキシプロピレンブロック共重合が挙げられる。固体希釈剤には、例えば粘土、例えばベントナイト、モントモリロ

ナイト、アタパルジャイトおよびカオリン、デンプン、糖、シリカ、タルク、ケイ藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、および硫酸ナトリウムが含まれる。液体希釈剤には例えば、水、N，N－ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N－アルキルピロリドン、エチレングリコール、ポリプロピレングリコール、パラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、オリーブ油、ヒマシ油、アマニ油、キリ油、ゴマ油、トウモロコシ油、ラッカセイ油、綿実油、ダイズ油、ナタネ油およびココナツ油、脂肪酸エステル、ケトン、例えばシクロヘキサノン、2－ヘプタノン、イソホロンおよび4－ヒドロキシ－4－メチル－2－ペンタノン、およびアルコール、例えばメタノール、シクロヘキサノール、デカノールおよびテトラヒドロフルフリルアルコールが含まれる。

10

【0323】

乳剤を含む溶液は、成分を単に混合することにより調製することができる。配合し、通常ハンマーミルまたは流体エネルギーミルなどで粉碎することによって、微粉剤および粉剤を調製することができる。懸濁剤は通常、湿式粉碎によって調製される；例えば、米国特許第3，060，084号を参照のこと。顆粒剤およびペレットは、予め形成された顆粒状担体上に活性物質を吹き付けることによって、または凝集技術によって調製することができる。Browning, “Agglomeration”, Chemical Engineering, December 4, 1967, pp147-148, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pp8-57、および以下

20

および国際公開第91/13546号を参照のこと。ペレットは、米国特許第4,172,714号に記載のように調製することができる。水分散性および水溶性顆粒剤は、米国特許第4,144,050号、同第3,920,442号およびDE3,246,493号に記載のように調製することができる。錠剤は、米国特許第5,180,587号、同第5,232,701号および同第5,208,030号に記載のように調製することができる。フィルムは、GB2,095,558号および米国特許第3,299,566号に記載のように調製することができる。

【0324】

製剤の技術分野に関する更なる情報については、T. S. Woods, “The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture” in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133を参照のこと。米国特許第3,235,361号の6欄16行～7欄19行および実施例10～41；米国特許第3,309,192号の5欄43行～7欄62行および実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138～140、162～164、166、167および169～182；米国特許第2,891,855号の3欄

30

66行～5欄17行および実施例1～4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp81-96；Hanceら, Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989を参照のこと。

40

【0325】

以下の実施例において、パーセンテージはすべて重量によるものであり、すべての製剤は従来の方法で調製される。化合物番号はインデックス表Aにおける化合物を示す。

【0326】

【表 1 1 0】

実施例A湿潤性粉末

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

10

【0 3 2 7】

【表 1 1 1】

実施例B粒体

化合物1	10.0%
アタパルジャイト粒体(低揮発分、0.71/0.30mm、U.S.S No.25～50シーブ)	90.0%

20

【0 3 2 8】

【表 1 1 2】

実施例C押出ペレット

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

30

【0 3 2 9】

【表 1 1 3】

実施例D乳化可能なコンセントレート

化合物1	20.0%
油溶性スルホネートとポリオキシエチレンエーテルのブレンド	10.0%
イソホロン	70.0%

40

【0 3 3 0】

【表 1 1 4】

実施例E粒体

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

10

【0 3 3 1】

本発明の化合物は、好ましい代謝および／または土壌残留パターンによって特徴付けられ、かつ農業上または非農業上の無脊椎有害生物の領域を制御する活性を示す。（この明細書の文脈では、「無脊椎有害生物防除」とは、供給を著しく低減する、または無脊椎有害生物によって生じる他の損傷もしくは損害の原因となる、無脊椎有害生物の発生（枯損量を含む）を抑制することを意味する；関連する表現は同様に定義される）この明細書において参照すると、「無脊椎有害生物」という用語には、有害生物として経済上重要な、節足動物、腹足類動物、および線虫が含まれる。「節足動物」という用語には、昆虫、ダニ、クモ、サソリ、ムカデ類、ヤスデ類、ワラジムシおよび結合類が含まれる。「腹足類」という用語には、カタツムリ、ナメクジおよび他の柄眼類が含まれる。「線虫」という用語には、蠕虫類、例えば回虫、心糸状虫、および植食性線虫（*Nematoda*）、吸虫類（*Tematoda*）、鉤頭虫類および条虫類（*Cestoda*）が含まれる。当業者であれば、すべての化合物がすべての有害生物に対して均等に有効ではないことは理解されよう。本発明の化合物は、経済上重要な農業上および非農業上の有害生物に対して活性を示す。「農業上」という用語は、食料および繊維などの農作物の生産を指し、禾穀類（例えば、コムギ、ムギ、オオムギ、ライムギ、イネ、トウモロコシ）、ダイズ、野菜（例えば、レタス、キャベツ、トマト、マメ）、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウ、ワタ、および高木に実る果実（例えば、ナシ状果、石果、柑橘類果実）を含む。「非農業上」という用語は、他の園芸（例えば、森林、温室、田畑で栽培しない苗または観賞植物）、公衆衛生（ヒト）および動物衛生、家庭内および商業構造、家庭用および保存されている生産物の用途または有害生物を指す。無脊椎有害生物防除の領域および経済的重要性の理由から、無脊椎有害生物を防除することによる、綿、トウモロコシ、ダイズ、イネ、野菜、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウおよび高木に実る果実（*tree fruit*）の保護（無脊椎有害生物によって生じる損傷または損害から）が、本発明の好ましい実施形態である。農業上または非農業上の有害生物には、鱗翅目（*Lepidoptera*）の幼虫、例えばヨトウムシ（*armyworm*）、ネキリムシ（*cutworm*）、シャクトリムシ（*looper*）、およびヤガ科タバコガ亜科（*heliothine*）（例えば、フォールアーミーワーム（*fall armyworm*）（*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith）、シロイチモジヨトウ（*beet armyworm*）（*Spodoptera exigua* Huebner）、タマナヤガ（*black cutworm*）（*Agrotis ipsilon* Hufnagel）、イラクサキンウババ（*cabbage looper*）（*Trichoplusia ni* Huebner）、オオタバコガの幼虫（*tobacco budworm*）（*Heliothis virescens* Fabricius））；穿孔動物（*borer*）、ツツミノガ科（*casebearer*）、チョウ・ガの類の幼虫（*webworm*）、コーンワーム（*coneworm*）、アオムシ（*cabbageworm*）およびメイガ科の幼虫（*skeletonizer*）（例えば、アワノメイガ（*European corn borer*）（*Ostrinia nubilalis* Huebner）、ネ

20

30

40

50

ーブルオレンジワーム (navel orangeworm) (*Amyelois transitella* Walker)、ハムシモドキの幼虫 (corn root webworm) (*Crambus caliginosellus* Clemens)、クロオビクロノメイガ (sod webworm) (*Herpetogramma licarsialis* Walker) ; ハマキムシ (leafroller)、青虫 (budworm)、シードワーム (seed worm)、およびハマキガ (*Tortricidae*) 科のフルーツワーム (fruit worm) (例えば、コドリング (*codling moth*) (*Cydia pomonella* Linnaeus)、メハマキガ科のガ (grape berry moth) (*Endopiza viteana* Clemens)、ナシヒメシンクイ (oriental fruit moth) (*Grapholita molesta* Busck) ; および他の多くの経済的に重要な鱗翅類 (*lepidoptera*) (例えば、コナガ (*diamondback moth*) (*Plutella xylostella* Linnaeus)、ワタキバガの幼虫 (pink bollworm) (*Pectinophora gossypiella* Saunders)、マイマイガ (gypsy moth) (*Lymantria dispar* Linnaeus) ; チャバネゴキブリ科 (*Blattellidae*) およびゴキブリ科 (*Blattidae*) のゴキブリ類を含むゴキブリ亜目 (*Blattodea*) の若虫および成虫 (例えば、コバネゴキブリ (oriental cockroach) (*Blatta orientalis* Linnaeus)、アジアゴキブリ (Asian cockroach) (*Blattella asahina* Mizukubo)、チャバネゴキブリ (German cockroach) (*Blattella germanica* Linnaeus)、チャオビゴキブリ (brownbanded cockroach) (*Supella longipalpa* Fabricius)、ワモンゴキブリ (American cockroach) (*Periplaneta americana* Linnaeus)、トビイロゴキブリ (brown cockroach) (*Periplaneta brunnea* Burmeister)、マデラゴキブリ (Madeira cockroach) (*Leucophaea maderae* Fabricius) ; ヒゲナガゾウムシ科 (*Anthribidae*)、マメゾウムシ科 (*Bruchidae*) およびゾウムシ科 (*Curculionidae*) のゾウムシを含む鞘翅目 (*Coleoptera*) の葉面接触幼虫および成虫 (例えば、メキシコワタノミゾウムシ (boll weevil) (*Anthonomus grandis* Boheman)、イネミズゾウムシ (rice water weevil) (*Lissorhopterus oryzophilus* Kuschel)、グラナリアコクゾウムシ (granary weevil) (*Sitophilus granarius* Linnaeus)、コクゾウムシ (rice weevil) (*Sitophilus oryzae* Linnaeus) ; ノミハムシ (flea beetle)、ハムシ科キュウリヒゲナガハムシ属および近縁属 (*Chrysomelidae*) の甲虫 (cucumber beetle)、ルートワーム (rootworm)、ハムシ (leaf beetle)、ジャガイモハムシ (potato beetle)、およびハムシ科 (*Chrysomelidae*) の葉もぐり虫 (leafminer) (例えば、コロラドハムシ (Colorado potato beetle) (*Leptinotarsa decemlineata* Say)、ウリハムシ (western corn rootworm) (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte) ; コガネムシ科 (*Scarabaeidae*) のコガネムシ (chager) および他の虫 (例えば、マメコガネ (Japanese beetle) (*Popillia japonica* Newman) およびコフキコガネの一種 (European chafer) (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky) ; カツオブシムシ科 (*Dermestidae*) のカツオブシムシ (carpet beetle) ; コメツキムシ科 (*Elateridae*) のコメツキムシの幼虫 (wireworm) ; キクイムシ科 (*Scor*

lytidae) のククイム (bark beetle) およびコミムシダマシ科 (Tenebrionidae) のコクヌストモドキ (flour beetle) が含まれる。さらに、農業上および非農業上の有害生物としては：クギヌキハサミムシ科 (Forficulidae) のハサミムシ (earwig) を含む革翅目 (Dermaptera) の成虫および幼虫 (例えば、オウシュウクギヌキハサミムシ (European earwig) (*Forficula auricularia* Linnaeus)、黒色ハサミムシ (black earwig) (*Chelisoches morio* Fabricius))；半翅目 (Hemiptera) および同翅目 (Homoptera) の成虫および幼虫、例えばメクラカメムシ科 (Miridae) のメクラカメムシ (plant bug)、セミ科 (Cicadidae) のセミ (cicadas)、オオヨコバイ科 (Cicadellidae) のヨコバイ (leafhopper) (例えば、ヒメヨコバイ (*Empoasca* spp.))、ビワハゴロモ上科 (Fulgoroidea) およびウンカ科 (Delphacidae) のウンカ (planthopper)、ツノゼミ科 (Membracidae) のツノゼミ (treehopper)、キジラミ科 (Psyllidae) のキジラミ (psyllid)、コナジラミ科 (Aleyrodidae) のコナジラミ (whitefly)、アリマキ科 (Aphididae) のアブラムシ (aphid)、ネアブラムシ亜科 (Phylloxeridae) ネアブラムシ属の昆虫 (phylloxera)、コナカイガラムシ科 (Pseudococcidae) のイボタムシ (mealybug)、カタカイガラムシ科 (Coccidae)、マルカイガラムシ科 (Diaspididae) およびワラジカイガラムシ亜科 (Margarodidae) のカイガラムシ (scale)、グンバイムシ科 (Tingidae) のグンバイムシ (lace bug)、カメムシ科 (Pentatomidae) のカメムシ (stink bug)、ナガカメムシ科 (Lygaeidae) のコバネナガカメムシ (cinch bug) (例えば、*Blissus* spp.) および他のシードバグ (seed bug)、アワフキムシ科 (Cercopidae) のアワフキムシ (spittlebug)、ヘリカメムシ科 (Coreidae) の各種カメムシ (squash bug)、およびホシカメムシ科 (Pyrrhocoridae) のツツガムシ (red bug) およびホシカメムシ (cotton stainer) が挙げられる。ダニ目 (Acarina) (ダニ類) の成虫および幼虫、例えばハダニ科 (Tetranychidae) のハダニ (spider mite) (例えば、リンゴハダニ (European red mite) (*Panonychus ulmi* Koch)、ナミハダニ (two spotted spider mite) (*Tetranychus urticae* Koch)、マクダニエルダニ (McDaniel mite) (*Tetranychus mcdanieli* McGregor))、ヒメハダニ科 (Tenuipalpidae) のフラットマイト (flat mite) (例えば、柑橘類フラットマイト (citrus flat mite) (*Brevipalpus lewisi* McGregor))、フシダニ科 (Eriophyidae) のサビダニ (rust mite) およびバッドマイト (bud mite)、他の葉面摂食ダニおよびヒトおよび動物の健康において重要なダニ、つまりヒョウヒダニ類 (Epidemoptidae) のチリダニ類 (dust mite)、ニキビダニ科 (Demodicidae) のニキビダニ (follicle mite)、ニクダニ類 (Glycyphagidae) のグレインマイト (grain mite)、マダニ科 (Ixodidae) のマダニ (tick) (例えば、鹿ダニ (deer tick) (*Ixodes scapularis* Say)、オーストラリア麻痺ダニ (Australian paralysis tick) (*Ixodes holocyclus* Neumann)、アメリカイヌカクマダニ (American dog tick) (*Dermacentor variabilis* Say)、アメリカアムブリオマ (lone star tick) (*Amblyomma americanum* Linnaeus)、キュウセンヒゼンダニ属 (Psoroptidae)、シラミダニ類 (Pyemotidae)、およびヒゼンダニ科 (Sarcoptidae) の疥癬虫 (scab mite

10

20

30

40

50

) およびヒゼンダニ (itch mite) ; バッタ (grasshopper) 、ワタ
 リバッタ類 (locust) およびコオロギ (cricket) を含む直翅目 (Orth
 optera) の成虫および幼虫 (例えば、トビバッタ (migratory gras
 shopper) (例えば、*Melanoplus sanguinipes* Fabr
 icius、*M. differentialis* Thomas) 、アメリカバッタ (*A*
merican grasshopper) (例えば、*Schistocerca am*
ericana Drury) 、エジプトツチイナゴ (*desert locust*) (
Schistocerca gregaria Forskal) 、渡りバッタ (*mig*
ratory locust) (*Locusta migratoria* Linnae
 us) 、イエコオロギ (*house cricket*) (*Acheta domesti*
 cus Linnaeus) 、ケラ (*mole cricket*) (*Gryllotal*
pa spp.)) ; 双翅目の成虫および幼虫、例えば葉もぐり虫 (*leaf mine*
r) 、ミジ (*midge*) 、ミバエ (*fruit fly*) (*Tephritidae*)
 、キモグリバエ科の小バエ (*frit fly*) (例えば、*Oscinella frit*
t Linnaeus) 、土壌のウジ (*soil maggot*) 、イエバエ (*hous*
e fly) (例えば、*Musca domestica* Linnaeus) 、小イエ
 バエ (*lesser house fly*) (例えば、*Fannia canicula*
ris Linnaeus、*F. femoralis* Stein) 、サシバエ (*sta*
ble fly) (例えば、*Stomoxys calcitrans* Linnaeu
 s) 、フェイスフライ (*face fly*) 、ツノサシバエ (*horn fly*) 、クロ
 バエ (*blow fly*) (例えば、*Chrysomya* spp. 、*Phormia*
 spp.) 、および他の環縫類、アブ (*horse fly*) (例えば、*Tabanus*
 spp.) 、ウマバエ (*bot fly*) (例えば、*Gastrophilus* sp
 p. 、*Oestrus* spp.) 、ウシバエ (*cattle grub*) (例えば、*Hypoderma*
 spp.) 、シカバエ (*deer fly*) (例えば、*Chryso*
ps spp.) 、ヒツジシラミバエ (*ked*) (例えば、*Melophagus ov*
inus Linnaeus) および他の短角類 (*Brachycera*) 、蚊 (*mos*
quitoe) (例えば、*Aedes* spp. 、*Anopheles* spp. 、*Cu*
lex spp.) 、ブユ (*black fly*) (例えば、*Prosimulium*
 spp. 、*Simulium* spp.) 、ヌカカ類 (*biting midge*) 、ス
 ナバエ (*sand fly*) 、クロバネキノコバエ科のハエ (*sciarid*) 、および
 他の糸角類 (*Nematocera*) ; 総翅目 (*Thysanoptera*) の成虫およ
 び幼虫、例えばネギアザミウマ (*onion thrip*) (*Thrips tabac*
i Lindeman) および他の葉綿摂食アザミウマ ; 膜翅目 (*Hymenopter*
a) の害虫、例えばアリ (例えば、アカオオアリ (*red carpenter ant*
) (*Camponotus ferrugineus* Fabricius) 、クロオオ
 アリ (*black carpenter ant*) (*Camponotus penns*
ylvanicus De Geer) 、イエヒメアリ (*Pharaoh ant*) (*M*
onomorium pharaonis Linnaeus) 、チビヒアリ (*litt*
le fire ant) (*Wasmannia auropunctata* Roge
 r) 、ヒアリ (*fire ant*) (*Solenopsis geminata* Fab
 ricius) 、アカヒアリ (*red imported fire ant*) (*Sol*
enopsis invicta Buren) 、アルゼンチンアリ (*Argentin*
e ant) (*Iridomyrmex humilis* Mayr) 、アシナガキアリ
 (*crazy ant*) (*Paratrechina longicornis* Lat
 reille) 、トビイロシワアリ (*pavement ant*) (*Tetramori*
um caespitum Linnaeus) 、ヒメトビイロケアリ (*cornfie*
ld ant) (*Lasius alienus* Foerster) 、臭いのあるイエ
 アリ (*odorous house ant*) (*Tapinoma sessile* S
 ay)) 、ハチ (クマバチ (*carpenter bee*) を含む) 、オオクマバチ (*h*

ornet)、スズメバチ(yellow jacket)およびスズメバチ(wasp)
) ; イースタンサブタレニアンシロアリ(eastern subterranean
 termite)(Reticulitermes flavipes Kollar)、ウェスタンサブタレニアンシロアリ(western subterranean t
 ermite)(Reticulitermes hesperus Banks)、イエシロアリ(Formosan subterranean termite)(Cop
 totermes formosanus Shiraki)、ウェスト・インディアン
 ・ドライウッドシロアリ(West Indian drywood termite)
 (Incisitermes immigrans Snyder)および経済上重要な
 10 他のシロアリ; 総尾目(Thysanura)の害虫、例えばシミ(silverfis
 h)(Lepisma saccharina Linnaeus)およびマダラシミ(f
 irebrat)(Thermobia domestica Packard); 食
 毛目(Mallophaga)の害虫、例えばアタマジラミ(head louse)(
 Pediculus humanus capitis De Geer)、コロモジラ
 ミ(body louse)((Pediculus humanus humanus
 Linnaeus)、ニワトリハジラミ(chicken body louse)(
 Menacanthus stramineus Nitszch)、イヌハジラミ(d
 og biting louse)(Trichodectes canis De G
 eer)、フラッフシラミ(fluff louse)(Goniocotes gal
 linae De Geer)、ヒツジハジラミ(sheep body louse)
 20 (Bovicola ovis Schrank)、ウシジラミ(short-nose
 d cattle louse)(Haematopinus eurysternus
 Nitzsch)、ウシホソジラミ(long-nosed cattle lous
 e)(Linognathus vituli Linnaeus)および、ヒトおよび
 動物を攻撃する他の吸血および咬む寄生シラミ; ノミ目(Siphonoptera)の
 害虫、例えばケオプスネズミノミ(oriental rat flea)(Xenop
 sylla cheopis Rothschild)、ネコノミ(cat flea)
 (Ctenocephalides felis Bouche)、イヌノミ(dog
 flea)(Ctenocephalides canis Curtis)、ニワトリ
 ノミ(hen flea)(Ceratophyllus gallinae Schr
 ank)、ニワトリフトノミ(sticktight flea)(Echidnoph
 aga gallinacea Westwood)、ヒトノミ(human flea)
 30 (Pulex irritans Linnaeus)および動物および鳥を悩ます他
 のノミもまた含まれる。対象として含まれるその他の節足動物有害生物には: 真正クモ目
 (Araneae)のクモ、例えばイトグモ(brown recluse spide
 r)(Loxosceles reclusa Gertsch&Mulaik)および
 クロゴケグモ(black widow spider)(Latrodectus m
 actans Fabricius)、およびゲジ目(Scutigeromorpha
)のムカデ類(centipede)、例えば蚰蜒(house centipede)
 40 (Scutigera coleoptrata Linnaeus)が含まれる。本発
 明の化合物は、線虫類(Nematoda)、条虫類(Cestoda)、吸虫類(Tr
 ematoda)、および鉤頭虫類(Acanthocephala)のメンバー、例え
 ば経済上重要な円虫類(Strongylida)、カイチュウ目(Ascaridid
 a)、蟯虫科(Oxyurida)、カンセンチュウ目(Rhabditida)、セン
 ビセンチュウ目(Spirurida)、およびエノプルス目(Enoplida)のメ
 ンバー、例えば限定されないが、経済上重要な農業害虫(つまり、キタネコブセンチュウ
 (Meloidogyne)属の根瘤線虫(root knot nematode)、
 ネグサレセンチュウ(Trichodorus)属のセンチュウ(lesion nem
 atode)、ネグサレセンチュウ属のスタビールートセンチュウ(stubby ro
 ot nematode)等)、動物およびヒト衛生害虫(つまり、経済上重要なすべて

10

20

30

40

50

の吸虫類、条虫類、および回虫、例えばウマに寄生する普通円虫 (*Strongylus vulgaris*)、イヌに寄生するイヌ回虫 (*Toxocara canis*)、ヒツジに寄生する捻転胃虫 (*Haemonchus contortus*)、イヌに寄生するイヌ糸状虫 (*Dirofilaria immitis* Leidy)、ウマに寄生する葉状条虫 (*Anoplocephala perfoliata*)、反芻動物に寄生する肝蛭 (*Fasciola hepatica* Linnaeus) 等) に対しても活性を有する。

【0332】

本発明の化合物は、鱗翅目 (*Lepidoptera*) の害虫 (ヤガの幼虫 (*Alabama argillacea* Huebner)、果樹ハマキムシ (*Archips argyrospila* Walker)、セイヨウハマキ (*A. rosana* Linnaeus) およびその他のハマキ (*Archips*) 種、ニカメイチュウ (*Chilo suppressalis* Walker)、コブノメイガ (*Cnaphalocrossis medinalis* Guenee)、ハムシモドキの幼虫 (*Crambus caliginosellus* Clemens)、シバツトガ (*Crambus terrellus* Zincken)、コドリノガ (*Cydia pomonella* Linnaeus)、ミスジアオリング (*Earias insulana* Boisduval)、クサオビリング (*Earias vittella* Fabricius)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera* Huebner)、オオタバコガの幼虫 (*Helicoverpa zea* Boddie)、オオタバコガの幼虫 (*Heliothis virescens* Fabricius)、クロオビクロノメイガ (*Herpetogramma licarsisalis* Walker)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana* Denis & Schiffermueller)、ワタアカミムシガ (*Pectinophora gossypiella* Saunders)、ミカンコハモグリ (*Phyllocnistis citrella* Stainton)、オオモンシロチョウ (*Pieris brassicae* Linnaeus)、モンシロチョウ (*Pieris rapae* Linnaeus)、コナガ (*Plutella xylostella* Linnaeus)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua* Huebner)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura* Fabricius)、ヨトウガの一種 (*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith)、イラクサキンウワバ (*Trichoplusia ni* Huebner) およびキバガの一種 (*Tuta absoluta* Meyrick)) に対して特に高い活性を示す。本発明の化合物は、同翅目 (*Homoptera*) のメンバー、例えば：エンドウヒゲナガアブラムシ (*Acyrtosiphon pisum* Harris)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora* Koch)、マメクロアブラムシ (*Aphis fabae* Scopoli)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii* Glover)、リンゴアブラムシ (*Aphis pomi* De Geer)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola* Patch)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani* Kaltenbach)、イチゴケナガアブラムシ (*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell)、ロシアコムギアブラムシ (*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko)、バラリンゴアブラムシ (*Dysaphis plantaginea* Paaserini)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum* Hausmann)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni* Geoffroy)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi* Kaltenbach)、穀類につくアブラムシ (*Metopolophium dirhodum* Walker)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae* Thomas)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae* Sulzer)、レタスアブラムシ (*Nasonovia ribisnigri*

Mosley)、コブアブラムシ (*Pemphigus* spp.)、トウモロコシア
 ブラムシ (*Rhopalosiphum maidis* Fitch)、ムギクビレアブ
 ラムシ (*Rhopalosiphum padi* Linnaeus)、ムギミドリアブ
 ラムシ (*Schizaphis graminum* Rondani)、ムギヒゲナガア
 ブラムシ (*Sitobion avenae* Fabricius)、マダラアルファル
 ファアブラムシ (*Therioaphis maculata* Buckton)、コミ
 カンアブラムシ (*Toxoptera aurantii* Boyer de Fons
 colombe) およびミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricid*
a Kirkaldy)、カサアブラムシ (*Adelges* spp.)、ペカンネアブ
 ラムシ (*Phylloxera devastatrix* Pergande)、タバコ
 コナジラミ (*Bemisia tabaci* Gennadius)、シルバーリーフコ
 ナジラミ (*Bemisia argentifolii* Bellows & Perr
 ing)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri* Ashmead)
 およびオンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum* W
 estwood)、ジャガイモヒメヨコバイ (*Empoasca fabae* Harr
 is)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus* Falle
 n)、フタテンヨコバイ (*Macrolestes quadrilineatus* F
 orbes)、ツماغロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps* Uh
 ler)、クロスジツماغロヨコバイ (*Nephotettix nigropictu*
s Stal)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens* Stal)
 、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis* Ashmead)、セジ
 ロウンカ (*Sogatella furcifera* Horvath)、イネウンカ (*Sog*
atodes orizicola Muir)、シロリンゴヨコバイ (*Typh*
locyba pomaria McAtee)、チマダラヒメヨコバイ (*Erythr*
oneoura spp.)、十七年ゼミ (*Magcicada septendeci*
m Linnaeus)、イセリヤカイガラムシ (*Icerya purchasi* M
 askell)、サンホゼカイガラムシ (*Quadraspidiotus perni*
ciosus Comstock)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus*
citri Risso)、他のコナカイガラムシ (*Pseudococcus* sp.)、ヨー
 ロッパナシキジラミ (*Cacopsylla pyricola* Foer
 ster)、カキキジラミ (*Trioza diospyri* Ashmead) に対し
 て商業上有意な活性もまた有する。これらの化合物は、半翅目 (Hemiptera) の
 メンバー：例えばアオクサカメムシ (*Acrosternum hilare* Say)
 、ヘリカメムシの一種 (*Anasa tristis* De Geer)、コバネナガカ
 メの一種 (*Blissus leucopterus leucopterus* Say)、コットンレースバグ (*Corythuca gossypii* Fabricius)
 、トマトバグ (*Cyrtopeltis modesta* Distant)、アカホ
 シカメムシ (*Dysdercus suturellus* Herrich-Schae
 ffer)、茶色のカメムシの一種 (*Euchistus servus* Say)、イ
 ッテンカメムシ (*Euchistus variolarius* Palisot de
 Beauvois)、ヒメマダラカメムシ (*Graptosthetus* spp.)
 、マツノミヘリカメムシ (*Leptoglossus corculus* Say)、ミ
 ドリメクラガメ (*Lygus lineolaris* Palisot de Beau
 vois)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula* Linnaeus)
 、イネカメムシ (*Oebalus pugnax* Fabricius)、ナガカメム
 シの一種 (*Oncopeltus fasciatus* Dallas)、ワタノミハム
 シ (*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter) に対しても
 活性を有する。本発明の化合物によって防除される他の昆虫の種類には、総翅目 (Thy
 sanoptera) (例えば、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella*
occidentalis Pergande)、ミカンアザミウマ (*Scirtho*

10

20

30

40

50

thrips citri Moulton)、ダイズアザミウマ (Sericothrips variabilis Beach) およびネギアザミウマ (Thrips tabaci Lindeman)) ; および鞘翅目 (Coleoptera) (例えば、コロラドハムシ (Leptinotarsa decemlineata Say)、インゲンテントウ (Epilachna varivestis Mulsant) およびアグリオテス (Agriotes) 属、アトウス (Athous) 属またはリモニウス (Limonius) 属のコメツキムシの幼虫が含まれる。

【0333】

本発明の化合物は、殺虫剤、殺菌剤、抗線虫薬、殺ダニ剤、成長調整剤、例えば発根刺激物質、化学不妊剤、情報化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激物質、他の生物活性化合物または昆虫病原性細菌、ウイルスまたは菌類を含む1種または複数種の他の生物活性化合物または生物活性薬剤と混合し、より広範な範囲の農業での有用性を付与する多成分農薬を形成することもできる。このように本発明の化合物はさらに、生物学的に有効な量の少なくとも1種の更なる生物活性化合物または薬剤を含んでなることができる。それらと配合することができる、かかる生物活性化合物または薬剤の例としては：殺虫剤、例えばアバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホスメチル、ピフェントリン、ビンフェナザート (b i n f e n a z a t e)、ブプロフェジン、カルボフラン、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クロマフェノジド、クロチアニジン、シフルトリン、β-シフルトリン、シハロトリン、λ-シハロトリン、シベルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ダイアジノン、ジフルベンズロン、ジメトエート、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルフアン、エスフェンバレレート、エチプロール、フェノチカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンプロキシメート (f e n p r o x i m a t e)、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルシスリネート、フルフェネリム、タウフルバリネート、フルフェノクスロン、フォノフォス、ハロフェノジド、ヘキサフルムロン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、イソフェンフォス、ルフェヌロン、マラチオン、メタアルデヒド、メタミドフォス、メチダチオン、メトミル、メトプレン、メトキシクロル、モノクロトホス、メトキシフェノジド、ニチアジン、ノバルロン、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パラチオンメチル、ベルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ピリミカーブ、プロフェノホス、ピメトロジン、ピリダリル、ピリプロキシフェン、ロテノン、スピノサド、スピロメシフィン、サルプロス、テブフェノジド、テフルベンズロン、テフルトリン、テルブホス、テトラクロルビンホス、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタプーナトリウム (t h i o s u l t a p - s o d i u m)、トラロメトリン、トリクロルホンおよびトリフルムロン；殺菌剤、例えばアシベンゾラル、アゾキシストロビン、ベノミル、プラスチシジン-S、ボルドー混合物 (3塩基性硫酸銅)、ブロムコナゾール、カルプロパミド、カプタフォル、カプタン、カルベンダジム、クロロネブ、クロロタロニル、オキシ塩化銅、銅塩、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、(S)-3, 5-ジクロロ-N-(3-クロロ-1-エチル-1-メチル-2-オキソプロピル)-4-メチルベンズアミド (R H 7 2 8 1)、ジクロシメト (S-2 9 0 0)、ジクロメジン、ジクロラン、ジフェノコナゾール、(S)-3, 5-ジヒドロ-5-メチル-2-(メチルチオ)-5-フェニル-3-(フェニルアミノ)-4H-イミダゾール-4-オン (R P 4 0 7 2 1 3)、ジメトモルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、ドジン、エジフェンフォス、エポキシコナゾール、ファモキサドン、フェナミドン、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンカラミド (S Z X 0 7 2 2)、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンチンアセテート、フェンチンヒドロキシド、フルアジナム、フルジオキソニル、フルメトオーバー (f l u m e t o v e r) (R P A 4 0 3 3 9 7)、フルクインコナゾール、フルシラゾール、フルトラニル、フルトリアフォル、フォルペト、ホセチル-アルミニウム、フララキシル、フラメタピル (S-8 2 6 5 8)、ヘキサコナゾール、イブ

10

20

30

40

50

コナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イソプロチオラン、カスガマイシン、クレソキシムメチル、マンコゼブ、マネブ、メフェノキサム、メプロニル、メタラキシル、メトコナゾール、メトミノストロビン／フェノミノストロビン（SSF-126）、ミクロブタニル、ネオオーアソジン（メタンアルソン酸第二鉄）、オキサジキシル、ペンコナゾール、ペンシクロン、プロベナゾール、プロクロラツ、プロパモカルブ、プロピコナゾール、ピリフェノクス、ピラクロストロビン、ピリメタニル、ピロキロン、キノキシフェン、スピロキサミン、硫黄、テブコナゾール、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、チオファネートメチル、チラム、チアジニル、トリアジメホン、トリアジメノール、トリシクラゾール、トリフロキシストロビン、トリチコナゾール、バリダマイシンおよびピンククロゾリン；抗線虫薬、例えばアルジカルブ、オキサミル、クロチアゾベン／ベンクロチアズおよびフェナミホス；殺菌剤、例えばストレプトマイシン；殺ダニ剤、例えばアミドフルメト、アミトラツ、チノメチオナト、クロロベンジレート、シヘキサチン、ジコホル、ジエノクロル、エトキサゾール、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、ヘキシチアゾクス、プロパルギット、ピリダベンおよびテブフェンピラド；および生物剤、例えばアイザワイ（aizawai）系とクルスターキ（kurstaki）系を含むバチルス・チューリンゲンシス菌（*Bacillus thuringiensis*）、バチルス・チューリンゲンシス菌の δ -内毒素、バキュロウイルス、および昆虫病原性細菌、ウイルスおよび菌類が挙げられる。本発明の化合物およびそれらの組成物は、遺伝学的に形質転換された植物に適用し、無脊椎有害生物に対して毒性があるタンパク質を発現することができる（バチルス・チューリンゲンシス菌毒素など）。外因的に適用された発明の無脊椎有害生物防除化合物の効果は、発現した毒性タンパク質と相乗的であることが可能である。

10

20

【0334】

これらの農作物保護剤の一般的な参考文献としては、The Pesticide Manual, 12th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2000が挙げられる。

【0335】

本発明の化合物と混合するための好ましい殺虫剤および殺ダニ剤には、ピレスロイド、例えばシベルメトリン、シハロトリン、シフルトリンおよび β -シフルトリン、エスフェンバレレート、フェンバレレートおよびトラロメトリン；カルバメート、例えばフェノチオカルブ、メトミル、オキサミルおよびチオジカルブ；ネオニコチノイド、例えばクロチアニジン、イミダクロプリドおよびチアクロプリド；ニューロンナトリウムチャンネルブロッカー、例えばインドキサカルブ；殺虫性大環状ラクトン、例えばスピノサド、アバメクチン、アベルメクチンおよびエマメクチン； γ -アミノ酪酸（GABA）拮抗薬、例えばエンドスルファン、エチプロールおよびフィプロニル；殺虫性尿素、例えばフルフェノクスロンおよびトリフルムロン；擬態幼虫ホルモン、例えばジオフェノランおよびピリプロキシフェン；ピメトロジン；およびアミトラズが含まれる。本発明の化合物と混合するのに好ましい生物剤には、バチルス・チューリンゲンシス菌およびバチルス・チューリンゲンシス菌の δ -内毒素ならびに自然発生および遺伝子改変されたウイルス殺虫剤、例えばバキュロウイルス科（*Baculoviridae*）のメンバーならびに食虫性菌類が含まれる。

30

40

【0336】

最も好ましい混合物には、本発明の化合物とシハロトリンとの混合物；本発明の化合物と β -シフルトリンとの混合物；本発明の化合物とエスフェンバレレートとの混合物；本発明の化合物とメトミルとの混合物；本発明の化合物とイミダクロプリドとの混合物；本発明の化合物とチアクロプリドとの混合物；本発明の化合物とインドキサカルブとの混合物；本発明の化合物とアバメクチンとの混合物；本発明の化合物とエンドスルファンとの混合物；本発明の化合物とエチプロールとの混合物；本発明の化合物とフィプロニルとの混合物；本発明の化合物とフルフェノクスロンとの混合物；本発明の化合物とピリプロキ

50

シフェンとの混合物；本発明の化合物とピメトロジンとの混合物；本発明の化合物とアミトラズとの混合物；本発明の化合物とバチルス・チューリンジェンシス菌との混合物および本発明の化合物とバチルス・チューリンジェンシス菌の δ -内毒素との混合物が含まれる。

【0337】

特定の場合には、異なる作用様式であるが、同様の防除範囲を有する他の無脊椎有害生物防除化合物または薬剤が特に、耐性管理に特に有利であるだろう。このように、本発明の組成物はさらに、異なる作用様式であるが、同様の防除範囲を有する、生物学的に有効な量の少なくとも1種の更なる無脊椎有害生物防除化合物を含んでなることができる。植物保護化合物（例えば、タンパク質）を発現させるために遺伝子改変された植物またはその植物の場所を生物学的に有効な量の本発明の化合物と接触させることによって、広範な範囲の植物保護が提供され、かつそれは耐性管理に有利であるだろう。

10

【0338】

農業上および非農業上の発生場所を含む有害生物の環境に対して、保護すべき領域に対して、または防除すべき有害生物に直接、1種もしくは複数の本発明の化合物を有効量で適用することによって、無脊椎有害生物が農業用途および非農業用途において防除される。このように、本発明はさらに、農業および／または非農業用途において無脊椎有害生物を防除する方法であって、生物学的に有効な量の本発明の1種または複数種の化合物と、または少なくとも1種のかかる化合物を含有する組成物、または少なくとも1種のかかる化合物と有効量の少なくとも1種の更なる生物活性化合物もしくは薬剤を含有する組成物と、無脊椎有害生物またはその環境とを接触させることを含んでなる方法を含んでなる。本発明の化合物および有効量の少なくとも1種の更なる生物活性化合物もしくは薬剤を含んでなる適切な組成物の例には、更なる生物活性化合物もしくは薬剤が、本発明の化合物と同一顆粒上に存在するか、または本発明の化合物と別の顆粒上に存在する、顆粒状組成物が含まれる。

20

【0339】

好ましい接触方法は、噴霧による方法である。あるいは、本発明の化合物を含有する顆粒状組成物は、植物の葉または土壤に適用することができる。本発明の化合物はまた、土壤に、苗箱の処理または移植苗のくぼみに、液状配合物として土壤を浸して適用される、顆粒状配合物として適用される本発明の化合物を含有する組成物を植物と接触させることによる、植物による取り込みを介して有効に送達される。化合物はまた、本発明の化合物を含有する組成物を発生場所に局所的に適用することによって効果的である。他の接触方法として、直接噴霧および残留噴霧、空中噴霧、ゲル、種子コーティング、マイクロカプセル化、浸透性取り込み、餌、耳標、ボーラス、噴霧器、燻蒸剤、エアゾール、微粉剤および多くの他のものによる本発明の化合物または組成物の適用が挙げられる。本発明の化合物はまた、無脊椎有害生物防除装置を製造するために使用される材料（例えば、昆虫綱）中に含浸させてもよい。

30

【0340】

本発明の化合物は、無脊椎有害生物によって摂取される餌の中に、またはわな等の装置内に組み込むことができる。活性成分を0.01～5%、水分保持剤（1種または複数種）を0.05～10%、野菜粉を40～99%含有する顆粒剤または餌が、非常に低い施用量で、特に直接接触ではなく摂取により致死性である活性成分の用量で、土壤の昆虫を防除するのに有効である。

40

【0341】

本発明の化合物は純粋状態で適用することができるが、ほとんどの場合、適切な担体、希釈剤、および界面活性剤と共に、1種または複数種の化合物を含有する製剤、あるいは企図される最終用途に応じて食物と併用して適用されるだろう。好ましい適用方法は、化合物の水分散液または精製油溶液を噴霧することを含む。噴霧オイル、噴霧オイル濃縮物、展着剤、アジュバント、他の溶媒、および協力剤、例えばピペロニルブトキシドと組み合わせると、化合物の効力が高められる場合が多い。

50

【0342】

有効な防除に必要とされる施用量（つまり、「生物学的に有効な量」）は、防除する無脊椎有害生物の種類、有害生物の生活環、ライフステージ、そのサイズ、場所、時期、宿主作物または宿主動物、摂食行動、交尾行動、周囲湿度、温度等の因子に応じて異なるだろう。通常的环境下では、活性成分約0.01～2kg/ヘクタールの施用量が、農業生態系において有害生物を防除するのに十分である場合もあるが、0.0001kg/ヘクタールという少量でも十分な場合もあるし、あるいは8kg/ヘクタールという高い施用量が必要とされる場合もある。非農業用途に関しては、有効な施用量は、約1.0～50mg/平方メートルと様々であるが、0.1mg/平方メートルという少量で十分な場合もあるし、あるいは150mg/平方メートルという高い施用量が必要とされる場合もある。当業者であれば、所望のレベルの無脊椎有害生物防除に必要な生物学的に有効な量を容易に決定することができる。

10

【0343】

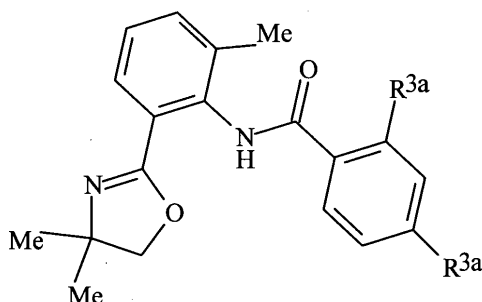
以下の試験によって、特定の有害生物に対する本発明の化合物の防除有効性が実証されている。「防除有効性」とは、有意に摂食を低減する無脊椎有害生物発生の抑制（死亡率を含む）を表す。しかしながら、本発明の化合物によって得られる有害生物防除の保護は、これらの種類に限定されない。化合物の詳細については、インデックス表AからFを参照のこと。以下の略語が以下のインデックス表で使用されている：Meはメチルである。「Ex」という略語は「実施例」を表し、化合物が調製される実施例を示す数が続く。

20

【0344】

【表115】

索引表 A



30

化合物	R ^{3a}	R ^{3b}	融点(°C)
1	H	CF ₃	200-203
2	H	OCF ₃	oil*
3	Me	Br	122-125
4	Me	CF ₃	174-178

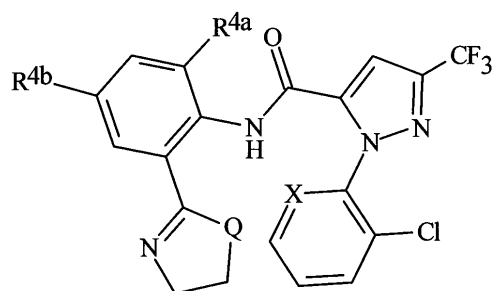
* 索引表Fの¹H NMR データを参照

40

【0345】

【表 1 1 6】

索引表 B



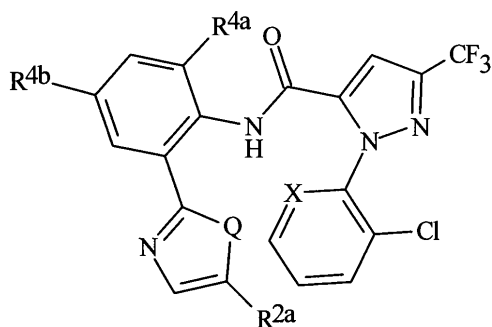
化合物	Q	R ^{4a}	R ^{4b}	X	融点(°C)
5 (実施例 4)	NH	Cl	Cl	N	*
6 (実施例 5)	NMe	Me	H	CH	244-246
7	O	Me	H	N	217-220
8	NMe	Me	H	N	*
9	NMe	Me	Br	N	*
10 (実施例 7)	NMe	Me	Br	CH	*
11 (実施例 1)	NH	Me	Br	N	*

* 索引表Fの ¹H NMR データを参照

【 0 3 4 6 】

【表 1 1 7】

索引表 C

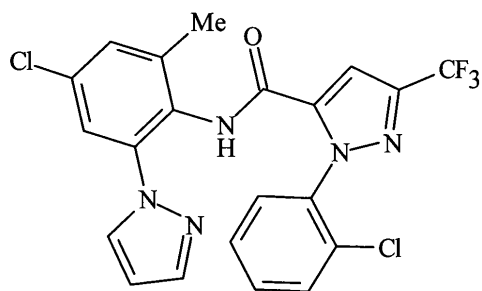


化合物	Q	R ^{2a}	R ^{4a}	R ^{4b}	X	融点(°C)
12	NMe	H	Me	H	N	*
13 (実施例 2)	NH	H	Me	H	N	224-226
14 (実施例 6)	NMe	H	Me	H	CH	*
15 (実施例 3)	NH	Br	Me	H	N	*

* 索引表Fの ¹H NMR データを参照

【 0 3 4 7 】

【表 1 1 8】

索引表 D

10

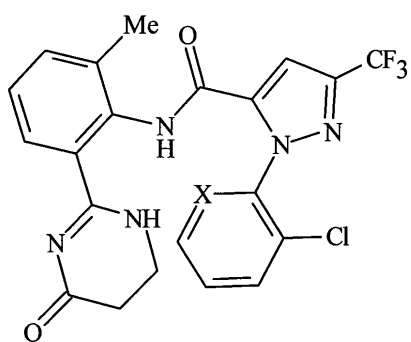
化合物	融点(℃)
16	87-89

【 0 3 4 8】

【表 1 1 9】

索引表 E

20



30

化合物	X	融点(℃)
17 (実施例 8)	N	*

* 索引表Fの ^1H NMR データを参照

【 0 3 4 9】

【表 1 2 0】

索引表 F

化合物	¹ H NMR のデータ (特に指示がないかぎり CDCl ₃ 溶液) ^a
5	δ 7.30 (d,1H), 7.23 (d,1H), 6.8 (bs,2H), 4.7-4.6 (bs,1H), 3.77 (bs,4H).
8	δ 8.5 (dd,1H), 7.9 (dd,1H), 7.4 (dd,1H), 7.29 (s,1H), 7.2-7.1 (m,3H), 3.87 (t,2H), 3.43 (t,2H), 2.69 (s,3H), 2.14 (s, 3H).
9	δ 8.5 (dd,1H), 7.9 (dd,1H), 7.5 (dd,1H), 7.4 (m,2H), 7.30 (s,1H), 3.79 (s,4H), 2.20 (s,3H).
10	δ 8.02 (s,1H), 7.7-7.6 (d,1H), 7.5-7.4 (m,4H), 7.3 (d,1H), 4.0-3.8 (bm,4H), 2.94 (s,3H), 2.34 (s,3H).
11	δ 8.5 (dd,1H), 7.9 (dd,1H), 7.5 (dd,1H), 7.4 (m,2H), 7.30 (s,1H), 3.79 (s,4H), 2.20 (s,3H).
12	δ 10.7 (s,1H), 8.5 (dd,1H), 7.9-7.8 (dd,1H), 7.4 (m,1H), 7.3-7.2 (m,3H), 7.2 (d,1H), 7.0-6.9 (d,1H), 3.67 (s,3H), 2.27 (s,3H).
14	δ 10.5 (bs,1H), 7.5 (m,1H), 7.4 (m,3H), 7.3-7.2 (m,4H), 7.13 (d,1H), 6.95 (d,1H), 3.65 (s,3H), 2.26 (s,3H).
15	δ 10.7 (s,1H), 8.5 (dd,1H), 7.9-7.8 (dd,1H), 7.4 (m,1H), 7.3-7.2 (m,3H), 7.2 (d,1H), 7.0-6.9 (d,1H), 3.67 (s,3H), 2.27 (s,3H).
17	δ 11.3 (bs,1H), 8.5 (dd,1H), 7.9 (dd,1H), 7.5-7.4 (m,1H), 7.4-7.2 (m,3H), 7.18 (s,1H), 3.85 (t,3H), 2.54 (t,2H), 2.23 (s,3H).

^a ¹H NMR スペクトルは、テトラメチルシランからダウンフィールドへの ppm である。カップリングは、(s) — 一重項、(d) — 二重項、(t) — 三重項、(q) — 四重項、(m) — 多重項、(dd) — 二重項の二重項、(dt) — 三重項の二重項、(brs) — ブロード一重項によって指示される。

【0 3 5 0】

本発明の生物学的実施例

試験 A

コナガ (*Plutella xylostella*) の防除の評価では、試験ユニットは、12 ~ 14 日目のラディッシュ植物を中に有する小さな開放容器からなる。コアサンプラーを用いて、これに昆虫の食餌 1 片上の幼虫 10 ~ 15 匹を予めたからせて、その上で成長する多くの幼虫を有する硬くなった昆虫の食餌のシートからプラグを除去し、幼虫および食餌を含有するそのプラグを試験ユニットに移す。食餌のプラグが乾燥するにしたがって、幼虫が試験用植物上に移動する。

【0 3 5 1】

別段の指定がない限り、アセトン 10 % と、水 90 % と、アルキルアリールポリオキシエチレン、遊離脂肪酸、グリコールおよびイソプロパノールを含有する X-77 (登録商標) スプレッダー (Spreader) ローフォーム・フォーミュラ (Low-Foam Formula) 非イオン界面活性剤 (ラブランド・インダストリーズ社 (Loveland Industries, Inc.)) 300 ppm と、を含有する溶液を用いて、試験化合物を配合した。配合した化合物を、各試験ユニットの上部より 1.27 cm (0.5 インチ) 上に位置付けられる 1/8 J J 特注本体を有する SUJ 2 噴霧器ノズル (スプレイング・システムズ社 (Spraying Systems Co.)) を通して液体 1 ml で適用した。このスクリーンにおけるすべての実験化合物を 250 ppm (または未満) で噴霧し、3 回繰り返した。配合した試験化合物を噴霧した後、各試験ユニットを 1 時間乾燥させ、次いで黒色の網を張った蓋を上にした。試験ユニットを 25 °C および相対湿度 70 % のグロースチャンバ内で 6 日間保持した。植物の摂食被害を目視評価した。

【0 3 5 2】

試験した化合物の中で、以下の化合物：1*、2*、3、4*、5*、6、7*、8、10*、11*、12*、13*、14*、15* および 17* が、優れたレベルの植物保護 (摂食被害 20 % 以下) を提供した。

【0 3 5 3】

10

20

30

40

50

試験 B

フォールアーミーワーム (*Spodoptera frugiperda*) の防除の評価では、試験ユニットは、4～5日目のコーン (トウモロコシ) 植物を中に有する小さな開放容器からなる。試験 A について記載のように、コアサンプラーを用いて、これに昆虫の食餌 1 片上の生後 1 日の幼虫 10～15 匹を予めたからせた。

【0354】

試験 A について記載のように、試験化合物を配合し、250 ppm (または以下) で噴霧した。施用を 3 回繰り返した。噴霧後、試験 A に記載のように試験ユニットをグロースチャンバ内で保持し、目視で評価した。

【0355】

試験した化合物の中で、以下の化合物：7*、10、12*、13*、14* および 17* が、優れたレベルの植物保護 (摂食被害 20% 以下) を提供した。

【0356】

試験 C

オオタバコガの幼虫 (*Heliothis virescens*) の防除の評価については、試験ユニットは、6～7日目のワタの木 (cotton plant) を中に有する小さな開放容器からなる。試験 A について記載のように、コアサンプラーを用いて、これに昆虫の食餌 1 片上の生後 2 日の幼虫 8 匹を予めたからせた。

【0357】

試験 A について記載のように、試験化合物を配合し、250 ppm (または以下) で噴霧した。施用を 3 回繰り返した。噴霧後、試験 A に記載のように試験ユニットをグロースチャンバ内で保持し、目視で評価した。

【0358】

試験した化合物の中で、以下の化合物：7*、10*、11*、12*、13、14* および 17* が、優れたレベルの植物保護 (摂食被害 20% 以下) を提供した。

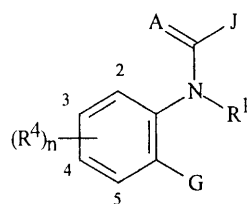
* 50 ppm で試験した。

なお、本発明の特徴または主な態様は次のとおりである。

1.

式 I :

【化 6 2】



I

(式中、A は O または S であり；

G は C (=O)、SO または S(O)₂ からなる群から独立して選択される 1 つまたは 2 つの環員を場合により含む、5 員もしくは 6 員芳香族複素環または 5 員もしくは 6 員非芳香族複素環であり、各環は場合により 1～4 つの R² で置換され；

J は J-5、J-6、J-7、J-8、J-9 および J-10 からなる群から選択されるピラゾールまたはピロール環であり、各環は R³ で置換され、そして場合により R⁶ および R⁷ で置換され；

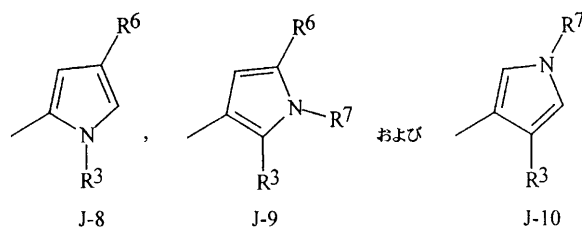
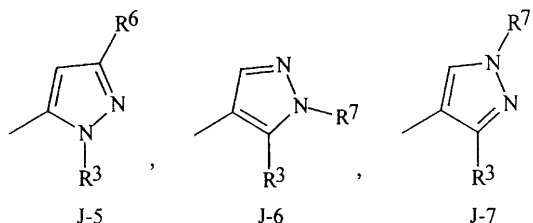
10

20

30

40

【化 6 3】



R^1 はH；または $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、それぞれが場合によりハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノおよび $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノからなる群から独立して選択される1つまたは複数の置換基で置換され；あるいは

R^1 は $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたはC(=A)Jであり；

R^2 または R^3 はそれぞれ独立してH、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、CO₂H、CONH₂、NO₂、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであり；あるいは

R^2 または R^3 はそれぞれ独立してフェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシまたは5員もしくは6員芳香族複素環、ナフチル環系、または芳香族もしくは非芳香族8員、9員もしくは10員複素二環式縮合環系であって、各環または環系が R^5 から独立して選択される1～3つの置換基で置換され；

R^4 はそれぞれ独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、NO₂、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、または $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであり；あるいは

R^4 はそれぞれ独立してフェニル、ベンジルまたはフェノキシ環であり、各環は R^5 から独立して選択される1～3つの置換基で置換され；

R^5 はそれぞれ独立してH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキ

ニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ、 $C_4 \sim C_7$ (アルキル) シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリルであり；

R^6 はそれぞれ独立して H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオであり；

R^7 は H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルまたは $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルであり；

n は1～4の整数である)

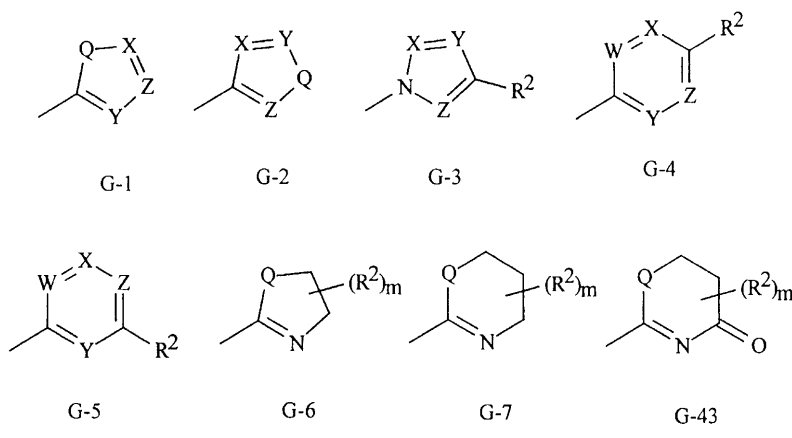
の化合物、およびそのN-オキシドおよびその塩。

2.

AはOであり；

GはG-1、G-2、G-3、G-4、G-5、G-6、G-7およびG-43からなる群から選択され、各Gは1～4つの R^2 で場合により置換され

【化64】



QはO、Sまたは NR^2 であり；

W、X、YおよびZは独立してNまたは CR^2 であり、ただし、G-4およびG-5においてはW、X、YもしくはZの少なくとも1つがNであり；

Q^1 はO、Sまたは NR^3 であり；

W^1 、 X^1 、 Y^1 および Z^1 は独立してNまたは CR^3 であり、ただし、J-3およびJ-4においては W^1 、 X^1 、 Y^1 もしくは Z^1 の少なくとも1つがNであり；

R^3 はそれぞれ独立して H 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルであり；あるいは

R^3 はそれぞれ独立してフェニル、ベンジルまたは5員もしくは6員芳香族複素環であり、各環が R^5 から独立して選択される1～3つの置換基で置換され；

1つの R^4 基はフェニル環の2位または5位のいずれかで式Iの残部に結合し、かつ前記 R^4 が $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィ

ニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり；

m は0～4の整数である、

前記第1項に記載の化合物。

3.

R^1 はHまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルであり；

R^3 基がそれぞれ独立してH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル；またはフェニル、ベンジル、または5員もしくは6員芳香族複素環であり、各環がハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシで場合により置換され；

n は1または2である、

前記第2項に記載の化合物。

4.

R^1 はHであり；

1つの R^4 が $NR^1C(=A)$ J部分に対してオルトのフェニル環の2位で式Iの残部に結合し且つ $C_1 \sim C_3$ アルキル、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ およびハロゲンからなる群から選択され、場合により第2の R^4 が $NR^1C(=A)$ J部分に対してパラのフェニル環の4位で結合し且つハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからなる群から選択され；

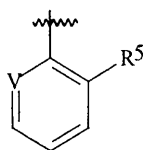
p は0、1または2である、

前記第3項に記載の化合物。

5.

R^3 はH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、または

【化65】



；

であり；

V はN、CH、CF、CCl、CBrまたはCIであり；

R^5 はそれぞれ独立してH、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオである、前記第4項に記載の化合物。

6.

V はNである前記第5項に記載の化合物。

7.

V はCH、CF、CClまたはCBrである前記第5項に記載の化合物。

8.

R^5 はH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲンまたはCNであり；

R^6 はH、 CH_3 、 CF_3 、 OCH_2CF_3 、 $OCHF_2$ またはハロゲンであり；

R^7 は CH_2CF_3 、 CHF_2 または CF_3 である、

前記第6または7項に記載の化合物。

9.

R³で置換され、そして場合によりR⁶で置換されるJがJ-5であり；R⁵はClまたはBrであり；R⁶はハロゲン、OCH₂CF₃、OCHF₂またはCF₃である、前記第8項に記載の化合物。

10.

R³で置換され、そして場合によりR⁷で置換されるJがJ-6であり；R⁹はClまたはBrであり；R⁷はCH₂CF₃、CHF₂またはCF₃である、前記第8項に記載の化合物。

11.

R³で置換され、そして場合によりR⁷で置換されるJがJ-7であり；R⁹はClまたはBrであり；R⁷はCH₂CF₃、CHF₂またはCF₃である、前記第8項に記載の化合物。

10

12.

R³で置換され、そして場合によりR⁶で置換されるJがJ-8であり；R⁵はClまたはBrであり；R⁶はハロゲン、OCH₂CF₃、OCHF₂またはCF₃である、前記第8項に記載の化合物。

13.

R³で置換され、そして場合によりR⁶およびR⁷で置換されるJがJ-9であり；R⁵はClまたはBrであり；R⁶はハロゲン、OCH₂CF₃、OCHF₂またはCF₃であり；R⁷はCH₂CF₃、CHF₂またはCF₃である、前記第8項に記載の化合物。

14.

R³で置換され、そして場合によりR⁷で置換されるJがJ-10であり；R⁹はClまたはBrであり；R⁷はCH₂CF₃、CHF₂またはCF₃である、前記第8項に記載の化合物。

20

15.

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2-(1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

1-(2-クロロメチル-N-[2-メチル-6-(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

30

1-(2-クロロフェニル)-N-[2-(4,5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2-(4,5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

N-[4-ブromo-2-(4,5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-1-(2-クロロフェニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

N-[4-ブromo-2-(4,5-ジヒドロ-1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

40

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2-(4,5-ジヒドロ-2-オキサゾリル)-6-メチルフェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、および

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2,4-ジクロロ-6-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドからなる群から選択される、前記第1項に記載の化合物。

16.

50

生物学的に有効な量の前記第 1 項に記載の化合物、その N－オキシドまたはその適切な塩と無脊椎有害生物またはその環境を接触させることを含んでなる無脊椎有害生物の防除方法。

1 7.

無脊椎有害生物を防除するための少なくとも 1 種の更なる化合物または薬剤を適用することをさらに含んでなる前記第 1 6 項に記載の方法。

1 8.

生物学的に有効な量の前記第 1 項に記載の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の更なる成分を含んでなる、無脊椎有害生物を防除するための組成物。

1 9.

無脊椎有害生物を防除するための少なくとも 1 種の更なる化合物または薬剤をさらに含んでなる、前記第 1 8 項に記載の組成物。

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
A O 1 N 43/76 (2006.01) A O 1 N 43/76
A O 1 P 1/00 (2006.01) A O 1 P 1/00

(72)発明者 クラーク, デイビッド・アラン
アメリカ合衆国ペンシルベニア州19350ランデンバーグ・ストーニーリτζジロード109
(72)発明者 ファインケルスタイン, ブルース・ローレンス
アメリカ合衆国デラウェア州19711ニューアーク・アウスパイスサークル26
(72)発明者 ラーム, ジョージ・ファイリツプ
アメリカ合衆国デラウェア州19808ウイルミントン・フエアヒルドライブ148
(72)発明者 セルビー, トーマス・ポール
アメリカ合衆国デラウェア州19808ウイルミントン・ハンターコート116
(72)発明者 ステイブンソン, トーマス・マーティン
アメリカ合衆国デラウェア州19702ニューアーク・イロコイスコート103

審査官 大宅 郁治

(56)参考文献 国際公開第01/049664 (WO, A1)
特開平08-092223 (JP, A)
特表平07-501549 (JP, A)
国際公開第01/053259 (WO, A1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C07D
A01N
CA/REGISTRY(STN)