

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2005-504084

(P2005-504084A)

(43) 公表日 平成17年2月10日(2005.2.10)

(51) Int. Cl.⁷

C07C 237/42

A01N 37/22

A01N 43/56

C07D 231/14

C07D 401/04

F I

C07C 237/42

A01N 37/22

A01N 43/56

C07D 231/14

C07D 401/04

テーマコード (参考)

4C063

4H006

4H011

審査請求 有 予備審査請求 有 (全 507 頁)

(21) 出願番号 特願2003-530071 (P2003-530071)
 (86) (22) 出願日 平成14年9月17日 (2002.9.17)
 (85) 翻訳文提出日 平成16年3月19日 (2004.3.19)
 (86) 国際出願番号 PCT/US2002/029468
 (87) 国際公開番号 W02003/026415
 (87) 国際公開日 平成15年4月3日 (2003.4.3)
 (31) 優先権主張番号 60/324, 083
 (32) 優先日 平成13年9月21日 (2001.9.21)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(71) 出願人 390023674
 イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・
 アンド・カンパニー
 E. I. DU PONT DE NEMO
 URS AND COMPANY
 アメリカ合衆国、デラウェア州、ウィルミ
 ントン、マーケット・ストリート 100
 7
 (74) 代理人 100060782
 弁理士 小田島 平吉
 (72) 発明者 ラーム, ジョージ・フィリップ
 アメリカ合衆国デラウェア州19808ウ
 イルミントン・フェアヒルドドライブ148

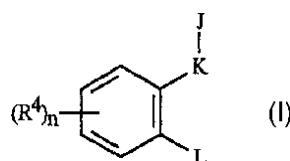
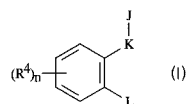
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺虫性ジアミド

(57) 【要約】

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

【化1】



(式中、

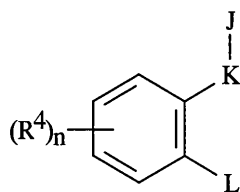
Jはフェニル環、ナフチル環系、5員環もしくは6員環
 の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の
 芳香族縮合複素二環系であり、ここで各環または環系は
 1～4個のR₅で場合により置換されていてもよく、
 Kは—C(=A)NR₂—または—NR₂C(=A)—
 であり、
 Lは—NR₂C(=B)—R₃または—NR₁SO²—
 R₃であり、
 AおよびBは独立してOまたはSであり、

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

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

【化 1】



I

10

(式中、

Jはフェニル環、ナフチル環系、5員環もしくは6員環の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の芳香族縮合複素二環系であり、ここで各環または環系は場合により1～4個のR⁵で置換されていてもよく、

20

Kは—C(=A)NR²—または—NR²C(=A)—であり、

Lは—NR¹C(=B)—R³または—NR¹SO₂—R³であり、

AおよびBは独立してOまたはSであり、

R¹はHであるか、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ジアルキルアミノ及びC₃～C₆シクロアルキルアミノよりなる群から選択される1またはそれ以上の置換基で各々置換されていてもよい、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニルまたはC₃～C₆シクロアルキルであるか、あるいは

30

R¹はC₂～C₆アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコキシカルボニル、C₂～C₆アルキルアミノカルボニルまたはC₃～C₈ジアルキルアミノカルボニルであり、

R²はH、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄アルキルアミノ、C₂～C₈ジアルキルアミノ、C₃～C₆シクロアルキルアミノ、C₂～C₆アルコキシカルボニルまたはC₂～C₆アルキルカルボニルであり、

R³は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、C₂～C₆アルコキシカルボニル、C₂～C₆アルキルカルボニル、C₃～C₆トリアルキルシリル、フェニル、フェノキシ、5員環もしくは6員環の複素芳香環（フェニル、フェノキシおよび5員環もしくは6員環の複素芳香環の各々は場合によりR⁶から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）よりなる群から選択される1個またはそれ以上の置換基で各々置換されていてもよい、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニルまたはC₃～C₆シクロアルキル；C₁～C₄アルコキシ；C₁～C₄アルキルアミノ；C₂～C₈ジアルキルアミノ；C₁～C₄アルコキシ（C₁～C₄アルキル）アミノ；C₃～C₆シクロアルキルアミノ；C₂～C₆アルコキシカルボニルまたはC₂～C₆アルキルカルボニルであるか、あるいは

40

R¹およびR³は、それらが結合している—NC(=B)—または—NSO₂—部分と一緒に、2～6個の炭素原子と場合によりさらに1個の窒素、硫黄または酸素原子を含んでなる環を形成することができ、該環は場合によりC₁～C₂アルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁～C₂アルコキシからなる群より選択される1～4個の置換基で置換

50

されていてもよく、

各 R^4 は独立して 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、 $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリル、または場合により R^6 から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよいフェニル環であり、

10

各 R^5 は独立して $C_1 \sim C_6$ 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、 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るか、または

20

各 R^5 は独立してフェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシ、5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環または 8 員環、9 員環もしくは 10 員環の芳香族縮合複素二環系であり、フェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシ、複素芳香環および芳香族縮合複素二環系の各々は場合により R^6 から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよく、あるいは

2 個の R^5 基は隣接する炭素原子と結合している場合には一緒になって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ または $-OCF_2CF_2O-$ であることができ、

各 R^6 は独立して $C_1 \sim C_4$ 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あり、

30

n は 1、2、3 または 4 であり、

ただし、 L は $-NHC(=O)-$ 以外であり、そして R^3 は 1 個もしくはそれ以上のフッ素部分で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル以外である)

で示される、そのすべての幾何異性体および立体異性体、 N -オキシドまたは農業的に適する塩を含む化合物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。

40

【請求項 2】

K が $-C(=A)NR^2-$ であり、 A と B がいずれも O である、請求項 1 に記載の方法。

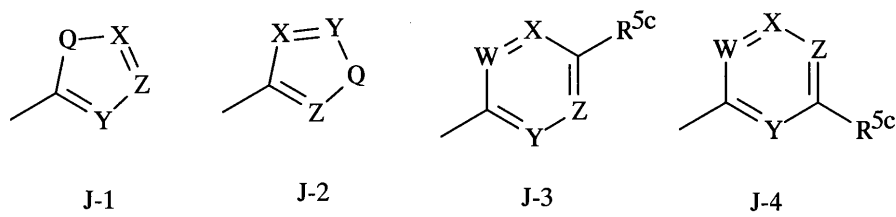
【請求項 3】

K が $-NR^2C(=A)-$ であり、 A と B がいずれも O である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

J がフェニル環であるか、 $J-1$ 、 $J-2$ 、 $J-3$ 、 $J-4$

【化 2】



10

よりなる群から選択される 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であり、各 J 環は場合により 1～3 個の R^5 で置換されていてもよく、

Q が O、S または NR^{5c} であり、

W、X、Y および Z が独立して N または CR^{5c} (ただし、J-3 および J-4 では、W、X、Y または Z のうちの少なくとも 1 つが N である) であり、

R^1 および R^2 がそれぞれ独立して 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、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルであり、

R^3 が場合によりハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニルよりなる群から選択される 1 個またはそれ以上の置換基で各々置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ 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、

各 R^4 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、NO₂、 $C_1 \sim C_4$ 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、

各 R^5 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、NO₂、 $C_1 \sim C_4$ 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または $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルであるか、または

各 R^5 が独立してフェニル環、ベンジル環、または 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であり、各環が場合により R^6 から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよく、あるいは

2 個の R^5 基は隣接する炭素原子と結合している場合には一緒になって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ または $-OCF_2CF_2O-$ であることができ、

R^{5c} が H または R^5 であり、

各 R^6 が独立して $C_1 \sim C_4$ 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、NO₂、 $C_1 \sim C_4$ 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あり、

n が 1 または 2 である、

50

請求項 2 または請求項 3 に記載の方法。

【請求項 5】

各 R^5 が R^{5a} または R^{5b} であり、
 J が R^{5a} で置換され、場合により 1 ～ 2 個の R^{5b} で置換されていてもよく、
 R^1 および R^2 がそれぞれ独立して、H または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、
 R^3 が場合によりハロゲン、CN、 OCH_3 または $S(O)_pCH_3$ で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、
 R^{5a} 基が K に対するオルト位で J に結合され、
 R^{5a} および R^{5b} が各々独立して $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル；あるいは各環が場合により R^6 から独立して選択される置換基 1 ～ 3 個で置換されていてもよい、フェニル環、ベンジル環、または 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であり、
 各 R^6 が独立してハロゲン、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 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり、
 p が 0、1 または 2 である、
 請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

J がフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンである、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 7】

R^1 および R^2 が各々 H であり、
 1 個の R^4 が $C_1 \sim C_3$ アルキル、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ 、ハロゲンよりなる群から選択され、任意の 2 番目の R^4 がハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルよりなる群から選択される、請求項 6 に記載の方法。

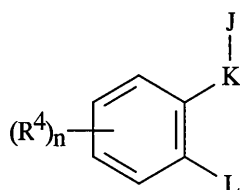
【請求項 8】

J が $J-1$ であり、
 Q が NR^{5a} であり、
 X が N または CH であり、
 Y が CH であり、
 Z が CR^{5b} であり、
 R^{5a} がハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシよりなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基で置換されたフェニル環または 2-ピリジル環であり、
 R^{5b} がハロゲンまたは CF_3 である、
 請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

式 I

【化 3】



I

10

(式中、

Jはフェニル環、ナフチル環系、5員環もしくは6員環の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の芳香族縮合複素二環系であり、ここで各環または環系は1個の R^5 ^aで置換され、場合により1~3個の R^5 ^bで置換されていてもよく、

Kは $-C(=A)NR^2-$ または $-NR^2C(=A)-$ であり、

Lは $-NR^1C(=B)-R^3$ または $-NR^1SO_2-R^3$ であり、

AおよびBは独立してOまたはSであり、

R^1 はHまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

20

R^2 はHまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

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

各 R^4 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または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

R^5 ^aおよび R^5 ^bは各々独立して $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル；あるいはフェニル環、ベンジル環、または5員環もしくは6員環の複素芳香環（フェニル、ベンジルおよび複素芳香環の各々が、場合により R^6 から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）であり、

30

R^5 ^aはKに対するオルト位でJに結合され、

各 R^6 は独立してハロゲン、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 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり、

40

nは1、2、3または4であり、

pは0、1または2であり、

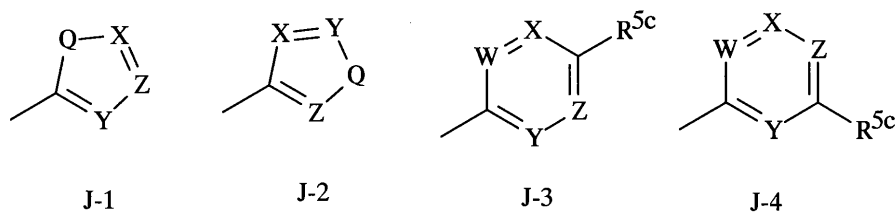
ただし、Lは $-NH C(=O)-$ 以外であり、 R^3 は1またはそれ以上のフッ素部分で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル以外である）

で示される、そのすべての幾何異性体および立体異性体、N-オキシドまたは農業的に適した塩を含む化合物。

【請求項10】

Jがフェニル環であるか、J-1、J-2、J-3、J-4

【化 4】



10

よりなる群から選択される 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であって、各 J 環は R^{5a} で置換され、場合により 1 ~ 2 個の R^{5b} で置換されていてもよく、Q が O、S または NR^{5c} であり、

W、X、Y および Z が独立して N または CR^{5c} (ただし、J-3 および J-4 では、W、X、Y または Z のうちの少なくとも 1 つが N である) であり、

R^1 および R^2 が各々独立して H または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

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

各 R^4 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または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

R^{5a} が K に対するオルト位で J に結合され、

R^{5a} および R^{5b} が各々独立して $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルである；あるいは各環が場合により R^6 から独立して選択される置換基 1 ~ 3 個で置換されていてもよい、フェニル環、ベンジル環、または 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であり、

R^{5c} が H または R^{5b} 置換基のうちのひとつであり、

各 R^6 が独立してハロゲン、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 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり、

n が 1 または 2 である、

請求項 9 に記載の化合物。

40

【請求項 11】

J がフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

R^1 および R^2 が各々 H であり、

1 個の R^4 が $C_1 \sim C_3$ アルキル、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ 、ハロゲンよりなる群から選択され、任意の 2 番目の R^4 がハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルよりなる群から選択される、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

J が J-1 であり、

50

QがNR^{5a}であり、
 XがNまたはCHであり、
 YがCHであり、
 ZがCR^{5b}であり、
 R^{5a}がハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキルまたはC₁～C₄ハロアルコキシよりなる群から選択される1個または2個の置換基で置換されたフェニル環または2-ピリジル環であり、
 R^{5b}がハロゲンまたはCF₃である、
 請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

10

生物学的に有効な量の請求項1に記載の式Iの化合物、そのN-オキシドまたはその農業的に適した塩と、
 界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤よりなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分と、
 を含んでなる、無脊椎有害生物を防除するための組成物。

【請求項15】

少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤を有効量でさらに含んでなる、請求項14に記載の組成物。

【請求項16】

少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤が、ピレスロイド、カルバメート、ネオニコチノイド、神経ナトリウムチャンネル遮断剤、殺虫性大環状ラクトン、γ-アミノ酪酸(GABA)拮抗剤、殺虫性尿素及び幼若ホルモンミミックよりなる群から選択される、請求項15に記載の組成物。

20

【請求項17】

アバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、アミドフルメト、エパーメクチン、アザジラクチン、アジノホス-メチル、ピフェントリン、ビンフェナゼート、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、エンドスルファン、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、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルシトリネート、エ-フルバリネート、フルフェノクスロン、フェノホス、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、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メソミル、メソプレン、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、オキサミル、パラチオン、パラチオン-メチル、ペルメトリン、フォレート、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、スルプロホス、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、チオスルタッパ-ナトリウム、トラロメトリン、トリクロルホンおよびトリフルムロン、アルジカルブ、オキサミル、フェナミホス、アミトラズ、キノメチオネート、クロルベンジレート、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、酸化フェンブタズ、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、テブフェンピラドならびに、aizawaiおよびkurstakiの種を含むバチルス・チューリングゲンシス、バチルス・チューリングゲンシスのδ内毒素、バキュロウイルスおよび昆虫病原性細菌、ウイルスおよび真菌などの生物剤よりなる群から選択される、少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤をさらに含んでなる、請求項14に記載の組成物。

30

40

【請求項18】

50

シペルメトリン、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、トラロメトリン、フェノチカルブ、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、クロチアニジン、イミダクロプリド、チアクロプリド、インドキサカルブ、スピノサド、アバメクチン、エパーメクチン、エマメクチン、エンドスルファン、エチプロール、フィプロニル、フルフェノクスロン、トリフルムロン、ジオフェノラン、ピリプロキシフェン、ピメトロジン、アミトラズ、バチルス・チューリングエンシス、バチルス・チューリングエンシスのδ内毒素、食虫性真菌よりなる群から選択される、少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤をさらに含んでなる、請求項14に記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

10

【技術分野】

【0001】

本発明は、特定のジアミド、そのN-オキシド、農業的に適した塩および組成物、ならびに農業環境と非農業環境の両方において無脊椎有害生物を防除するためのその使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

栽培効率を高める上で節足動物などの無脊椎有害生物を防除することは極めて重要である。栽培中の農作物や貯蔵してある農作物に無脊椎有害生物の被害がおよぶと、生産性が大幅に低下することで消費者の負担金額が大きくなる可能性がある。また、森林樹木、温室作物、観葉植物、幼苗、貯蔵食品、繊維製品、家畜類、家庭用品、公衆衛生、動物の衛生において無脊椎有害生物を防除することも重要である。こうした目的で多くの生成物が市販されているが、なお一層効果的で低コストである、毒性が低い、環境面での安全性が高い、あるいは作用形態の異なる新たな化合物に対する需要が依然としてある。

20

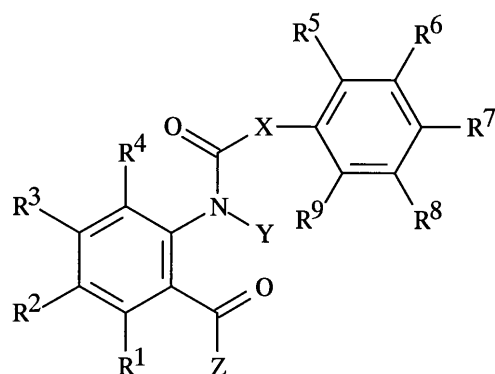
【0003】

特許文献1には、式 i

【0004】

【化1】

30



i

40

【0005】

(式中、特に、

Xは直接結合であり、

YはHまたはC₁～C₆アルキルであり、

Zは、NH₂、NH(C₁～C₃アルキル)またはN(C₁～C₃アルキル)₂であり、

R¹～R⁹は独立してH、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、フェニル、ヒドロキシ、C₁

50

～C₆ アルコキシまたはC₁～C₇ アシルオキシである) のN-アシルアントラニル酸誘導体が殺虫剤として開示されている。

【0006】

特許文献2には、殺虫剤としての特定のN-フルオロアルカノイル-*o*-フェニレンジアミンが開示されている。

【0007】

【特許文献1】

NL 9202078号明細書

【特許文献2】

米国特許第3,907,892号明細書

10

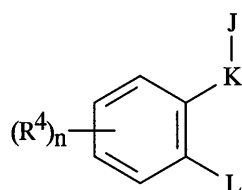
【発明の開示】

【0008】

本発明には、式I

【0009】

【化2】



20

I

【0010】

(式中

Jはフェニル環、ナフチル環系、5員環もしくは6員環の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の芳香族縮合複素二環系であり、ここで各環または環系は1～4個のR⁵で場合により置換されていてもよく、

30

Kは-C(=A)NR²-または-NR²C(=A)-であり、

Lは-NR¹C(=B)-R³または-NR¹SO₂-R³であり、

AおよびBは独立してOまたはSであり、

R¹は、Hであるか、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、C₃～C₆ シクロアルキルアミノよりなる群から選択される1またはそれ以上の置換基で各々場合により置換されていてもよい、C₁～C₆ アルキル、C₂～C₆ アルケニル、C₂～C₆ アルキニルまたはC₃～C₆ シクロアルキルであるか、または

40

R¹は、C₂～C₆ アルキルカルボニル、C₂～C₆ アルコキシカルボニル、C₂～C₆ アルキルアミノカルボニルまたはC₃～C₈ ジアルキルアミノカルボニルであり、

R²は、H、C₁～C₆ アルキル、C₂～C₆ アルケニル、C₂～C₆ アルキニル、C₃～C₆ シクロアルキル、C₁～C₄ アルコキシ、C₁～C₄ アルキルアミノ、C₂～C₈ ジアルキルアミノ、C₃～C₆ シクロアルキルアミノ、C₂～C₆ アルコキシカルボニルまたはC₂～C₆ アルキルカルボニルであり、

R³は、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、C₂～C₆ アルコキシカルボニル、C₂～C₆ アルキルカルボニル、

50

C₃ ~ C₆ トリアルキルシリル、フェニル、フェノキシ、5員環もしくは6員環の複素芳香環（フェニル、フェノキシおよび5員環もしくは6員環の複素芳香環の各々が、R⁶ から独立して選択される1~3個の置換基で場合により置換されていてもよい）よりなる群から選択される1またはそれ以上の置換基で各々置換されていてもよい、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニルまたはC₃ ~ C₆ シクロアルキル；C₁ ~ C₄ アルコキシ；C₁ ~ C₄ アルキルアミノ；C₂ ~ C₈ ジアルキルアミノ；C₁ ~ C₄ アルコキシ（C₁ ~ C₄ アルキル）アミノ；C₃ ~ C₆ シクロアルキルアミノ；C₂ ~ C₆ アルコキシカルボニルまたはC₂ ~ C₆ アルキルカルボニルであるか、R¹ およびR³ は、それらが結合している—NC(=B)—または—NSO₂—部分と一緒に、2~6個の炭素原子と場合によりさらに1個の窒素、硫黄または酸素原子を含んでなる環を形成することができ、該環は場合によりC₁ ~ C₂ アルキル、ハロゲン、CN、NO₂、C₁ ~ C₂ アルコキシからなる群より選択される1~4個の置換基で場合により置換されていてもよく、

各R⁴ は独立してH、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₃ ~ C₆ シクロアルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルキニル、C₃ ~ C₆ ハロシクロアルキル、ハロゲン、CN、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、C₃ ~ C₆ トリアルキルシリルまたはR⁶ から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよいフェニル環であり、

各R⁵ は独立して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、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、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であるか、または

各R⁵ は独立してフェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシ、5員環もしくは6員環の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の芳香族縮合複素二環系であり、フェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシ、複素芳香環および芳香族縮合複素二環系の各々が、R⁶ から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、あるいは

2個のR⁵ 基は隣接する炭素原子と結合している場合には一緒になって—OCF₂O—、—CF₂CF₂O—または—OCF₂CF₂O—であることができ、

各R⁶ は独立して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、C₃ ~ C₆ (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、2、3または4であり、ただし、Lは—NHC(=O)—以外であり、そしてR³ は1個もしくはそれ以上のフッ素部分で置換されたC₁ ~ C₆ アルキル以外である（す

10

20

30

40

50

すべての幾何異性体および立体異性体を含むで示される) そのN-オキシドおよび農業的に適した塩を含む化合物が関与する。

【0011】

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農業的に適した塩(本願明細書に記載の組成物としてなど)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が得られる。

【0012】

また、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農業的に適した塩と、界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤よりなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分と、を含んでなる無脊椎有害生物を防除するための組成物を提供するものである。 10

【0013】

また、本発明は、生物学的に有効な量の式Iの化合物と、そのN-オキシドまたはその農業的に適した塩と、有効量の少なくとも1種の生物学的に活性な化合物または薬剤と、を含んでなる組成物を提供するものである。

【0014】

また、本発明は、式Iの化合物であって、
 各 R^5 が R^{5a} または R^{5b} であり、
 Jはフェニル環、ナフチル環系、5員環もしくは6員環の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の芳香族縮合複素二環系であり、ここで各環または環系は R^{5a} で置換され、場合により1~3個の R^{5b} で置換されていてもよく、
 Kは $-C(=A)NR^2-$ または $-NR^2C(=A)-$ であり、
 Lは $-NR^1C(=B)-R^3$ または $-NR^1SO_2-R^3$ であり、
 AおよびBは独立してOまたはSであり、
 R^1 はHまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、
 R^2 はHまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、
 R^3 がハロゲン、CN、 OCH_3 または $S(O)_pCH_3$ で場合により置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、
 R^{5a} および R^{5b} は各々独立して $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル;またはフェニル環、ベンジル環、あるいは5員環もしくは6員環の複素芳香環(フェニル、ベンジルおよび複素芳香環の各々が、 R^6 から独立して選択される1~3個の置換基で場合により置換されていてもよい)であり、
 R^{5a} はKに対するオルト位でJに結合され、
 各 R^6 は独立してハロゲン、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 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり、
 pは0、1または2であり、ただし、Lは $-NH C(=O)-$ 以外であり、 R^3 は1またはそれ以上のフッ素部分で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル以外である)で示される、(すべての幾何異性体および立体異性体を含んでなる)そのN-オキシドまたは農業的に適する塩を含む式Iの化合物を提供する。 20 30 40

【発明の詳細】

【0015】

上記の詳説において、「アルキル」という用語を単独で使用する場合または「アルキルチオ」または「ハロアルキル」などの複合語で使用する場合、この用語には、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルあるいは、さまざまなブチル異性体、ペンチル異性体またはヘキシル異性体などの直鎖または分枝状のアルキルを含む。「アルケニル」には、1 50

ープロペニル、2-プロペニルならびに、さまざまなブテニル異性体、ペンテニル異性体およびヘキセニル異性体などの直鎖または分枝状のアルケンを含む。また、「アルケニル」には、1, 2-プロパジエニルや2, 4-ヘキサジエニルなどのポリエンも含む。「アルキニル」には、1-プロピニル、2-プロピニルならびに、さまざまなブチニル異性体、ペンチニル異性体およびヘキシニル異性体などの直鎖または分枝状のアルキンを含む。また、「アルキニル」には、2, 5-ヘキサジイニルなどの複数の三重結合で構成される部分を含み得ることもある。「アルコキシ」には、たとえば、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ならびに、さまざまなブトキシ異性体、ペントキシ異性体およびヘキシルオキシ異性体を含む。「アルコキシアルキル」とは、アルキルをアルコキシ置換したものを示す。「アルコキシアルキル」の一例として、 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ があげられる。「アルキルチオ」には、メチルチオ、エチルチオならびに、さまざまなプロピルチオ異性体、ブチルチオ異性体、ペンチルチオ異性体およびヘキシルチオ異性体などの分枝または直鎖状のアルキルチオ部分を含む。「シクロアルキル」としては、たとえば、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などがあげられる。

10

【0016】

「複素環」または「複素環系」という用語は、少なくとも1個の環原子が炭素ではなく、窒素と酸素と硫黄とよりなる群から独立して選択されるヘテロ原子が1～4個含まれる環または環系を示す（ただし、各複素環は4未満の窒素数、2未満の酸素数、2未満の硫黄数を含むものとする）。複素環は、利用できる炭素または窒素上の水素を入れ替えることで、前記炭素または窒素のうちのいずれでも結合可能なものである。「芳香族環系」という用語は、多環系が芳香族である（ここで、芳香族とは、その環系についてヒュッケル則が満たされることを示す）完全不飽和炭素環および複素環を示す。「複素芳香環」という用語は、少なくとも1個の環原子が炭素ではなく、窒素と酸素と硫黄とよりなる群から独立して選択されるヘテロ原子が1～4個含まれる完全（fully）芳香環を示す（ただし、各複素環は4未満の窒素数、2未満の酸素数、2未満の硫黄数を含むものとする（ここで、芳香族とはヒュッケル則が満たされることを示す））。複素環は、利用できる炭素または窒素上の水素を入れ替えることで、前記炭素または窒素のうちのいずれでも結合可能なものである。「芳香族複素環系」という用語には、完全芳香族複素環ならびに多環系の少なくとも1個の環が芳香族である複素環を含む（ここで、芳香族とはヒュッケル則が満たされることを示す）。「縮合複素二環系」という用語には、上述したように少なくとも1個の環原子が炭素ではなく、芳香族であっても芳香族でなくてもよい縮合環2個で構成される環系を含む。

20

30

【0017】

「ハロゲン」という用語を単独で使用する場合または「ハロアルキル」などの複合語で使用する場合、この用語には、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を含む。さらに、「ハロアルキル」などの複合語で用いられるときは、同一であっても異なってもよいハロゲン原子で前記アルキルが部分的にまたは完全に場合により置換されていてもよい。「ハロアルキル」の一例として、 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 および CF_3CCl_2 があげられる。「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」、「ハロアルコキシ」などの用語は、「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」の例には、 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ がある。「ハロアルキニル」の例には、 $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ および $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ がある。「ハロアルコキシ」の例には、 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ がある。

40

【0018】

置換基の炭素原子の総数については「 $\text{C}_i\sim\text{C}_j$ 」接頭辞で示すが、この場合の i および j は1から8の数字である。たとえば、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキルスルホニルであれば、これはメチルスルホニルからプロピルスルホニルまでを示す。 C_2 アルコキシアルキルは CH_3

50

OCH_2 を示し、 C_3 アルコキシアルキルは、 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ または $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ など示し、 C_4 アルコキシアルキルであれば合計で 4 個の炭素原子を含むアルコキシ基で置換されたアルキル基のさまざまな異性体を示し、その一例として、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ や $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ があげられる。上記の詳説では、式 1 の化合物が複素環を含む場合、利用できる炭素または窒素上の水素が入れ替わることで、すべての置換基が前記炭素または窒素によってこの環に結合されている。

【0019】

たとえば R^3 など、ひとつの基に水素であってもよい置換基を含む場合、この置換基を水素として扱えば、これは前記基が未置換であるのと等しいとみなされる。

10

【0020】

この発明の化合物は 1 またはそれ以上の立体異性体として存在できるものである。さまざまな立体異性体として、鏡像異性体、ジアステレオマー、回転異性体および幾何異性体があげられる。当業者であれば、ある立体異性体を他の立体異性体（単数または複数）に比して富化したり、他の立体異性体（単数または複数）から分離すると、その立体異性体の方が他の立体異性体よりも活性が高くなる場合があるおよび／または優れた効果を発揮する場合がある点は理解できよう。また、当業者であれば、前記立体異性体をどのようにして分離、富化および／または選択的に調製するかも知っているであろう。したがって、本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個々の立体異性体あるいは光学的に活性な形態として存在し得るものである。

20

【0021】

本発明は、式 I から選択される化合物、その N-オキシドおよび農業的に適した塩を含む。当業者であれば、窒素には酸化物への酸化にあたって利用できる不対電子が必要であるため、含窒素複素環であればどれでも N-オキシドを形成できるわけではないことは理解できよう。N-オキシドを形成できる含窒素複素環がどれであるかは、当業者であれば分かるであろう。また、第 3 級アミンは N-オキシドを形成できる点も当業者であれば分かるであろう。複素環および第 3 級アミンの N-オキシドを調製するための合成方法は、当業者間で極めてよく知られており、一例として、過酢酸および m-クロロ過安息香酸 (MCPBA) などの過酸、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、ジメチジオキシラン (dimethyldioxirane) などのジオキシランで、複素環および第 3 級アミンを酸化する方法があげられる。これらの N-オキシドの調製方法については、幅広い説明や概説が文献に記載されており、たとえば、T. L. ギルクリスト (Gilchrist) の Comprehensive Organic Synthesis、第 7 巻、第 748～750 ページ、S. V. レイ (Ley) 編、ペルガモン・プレス (Pergamon Press)；M. ティスラー (Tisler) および B. スタノヴニク (Stanovnik) の Comprehensive Heterocyclic Chemistry、第 3 巻、第 18～19 ページ、A. J. ボールトン (Boulton) および A. マキロップ (McKillop) 編、ペルガモン・プレス (Pergamon Press)；M. R. グリメット (Grimmett) および B. R. T. キーン (Keene) の Advances in Heterocyclic Chemistry、第 43 巻、第 139～151 ページ、A. R. カトリツキー (Katritzky) 編、アカデミック・プレス (Academic Press)；M. ティスラー (Tisler) および B. スタノヴニク (Stanovnik) の Advances in Heterocyclic Chemistry、第 9 巻、第 285～291 ページ、A. R. カトリツキー (Katritzky) および A. J. ボールトン (Boulton) 編、アカデミック・プレス (Academic Press)、G. W. H. チーズマン (Cheeseman) および E. S. G. ウェルスティウク (Werstiuk) の Advances in Heterocyclic Chemistry、第 22 巻、第 390～392 ページ、A. R. カトリツキー (Katritzky) および A. J. ボールトン (Boulton) 編

30

40

50

、アカデミック・プレス (Academic Press) を参照のこと。

【0022】

本発明の化合物の塩は、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などの無機酸または有機酸の酸付加塩を含む。

【0023】

活性が高いおよび／または合成が容易であることから好ましい方法には、以下のものがある。

好ましいもの 1。K が $-C(=A)NR^2-$ であり、A と B がいずれも O である式 I の化合物を含む方法。

10

【0024】

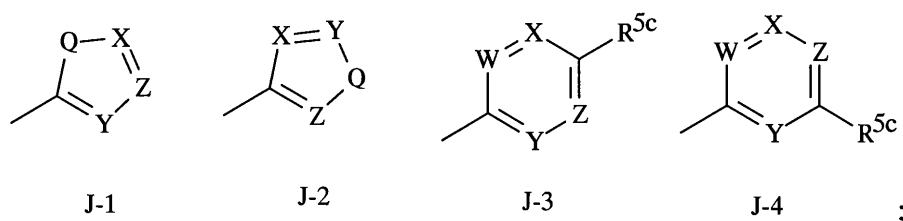
好ましいもの 2。K が $-NR^2C(=A)-$ であり、A と B がいずれも O である式 I の化合物を含んでなる方法。

【0025】

好ましいもの 3。J がフェニル環であるか、J-1、J-2、J-3、J-4

【0026】

【化 3】



20

【0027】

よりなる群から選択される 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であり、各 J 環が 1～3 個の R^5 で置換されていてもよく、

Q が O、S または NR^{5c} であり、

30

W、X、Y および Z が独立して N または CR^{5c} (ただし、J-3 および J-4 では、W、X、Y または Z のうちの少なくとも 1 つが N である) であり、

R^1 および R^2 が独立して 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、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルであり、

R^3 がハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニルよりなる群から選択される 1 またはそれ以上の置換基で各々場合により置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ 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、

各 R^4 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、NO₂、 $C_1 \sim C_4$ 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、

40

各 R^5 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、NO₂、 $C_1 \sim C_4$ 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または $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルであるか、または

50

各 R^5 が独立してフェニル環、ベンジル環、あるいは5員環もしくは6員環の複素芳香環であり、各環が R^6 から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく、2個の R^5 基は隣接する炭素原子と結合している場合には一緒になって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ または $-OCF_2CF_2O-$ であることができ、
 R^{5c} がHまたは R^5 であり、

各 R^6 が独立して $C_1 \sim C_4$ 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あり、

10

nが1または2である、好ましいもの1または好ましいもの2の方法。

【0028】

好ましいもの4。各 R^5 が R^{5a} または R^{5b} であり、
 Jが R^{5a} で置換され、1から2個の R^{5b} で置換されていてもよく、
 R^1 および R^2 が独立してHまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、
 R^3 がハロゲン、CN、 OCH_3 または $S(O)_pCH_3$ で場合により置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

20

R^{5a} 基がKに対するオルト位でJに結合され、
 R^{5a} および R^{5b} が各々独立して $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル；または各環が R^6 から独立して選択される置換基1～3個で場合により置換されていてもよい、フェニル環、ベンジル環、あるいは5員環もしくは6員環の複素芳香環であり、

30

各 R^6 が独立してハロゲン、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 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり、
 pが0、1または2である、好ましいもの3の方法。

【0029】

好ましいもの5。Jがフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンである、好ましいもの4の方法。

【0030】

好ましいもの6。 R^1 および R^2 が各々Hであり、
 1個の R^4 が $C_1 \sim C_3$ アルキル、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ 、ハロゲンよりなる群から選択され、任意の2番目の R^4 がハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルよりなる群から選択される、好ましいもの5の方法。

40

【0031】

好ましいもの7。JがJ-1であり、
 Qが NR^{5a} であり、
 XがNまたはCHであり、
 YがCHであり、
 Zが CR^{5b} であり、
 R^{5a} がハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 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

50

アルコキシよりなる群から選択される 1 個または 2 個の置換基で置換されたフェニル環または 2-ピリジル環であり、

R^{5b} がハロゲンまたは CF_3 である、好ましいもの 6 の方法。

【0032】

本発明の方法は、無脊椎有害生物またはその環境を、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式 I の化合物、その N-オキシドまたはその農業的に適した塩と、生物学的に有効な量の少なくとも 1 種の追加の化合物または薬剤とを含む組成物に接触させることを伴う実施形態を含む。

【0033】

また、本発明は、生物学的に有効な量の式 I の化合物、その N-オキシドまたは農業的に適した塩と、界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤のうちの少なくとも 1 種と、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ものである。本発明の好ましい組成物は、上記の好ましい方法の化合物を含んでなるものである。

【0034】

また、本発明は、そのすべての幾何異性体および立体異性体、N-オキシドまたは農業的に適した塩を含む、上記にて定義したような特定の式 I の化合物にも関するものである。活性が高いおよび／または合成が容易であることから好ましい本発明の化合物は以下のとおりである。

【0035】

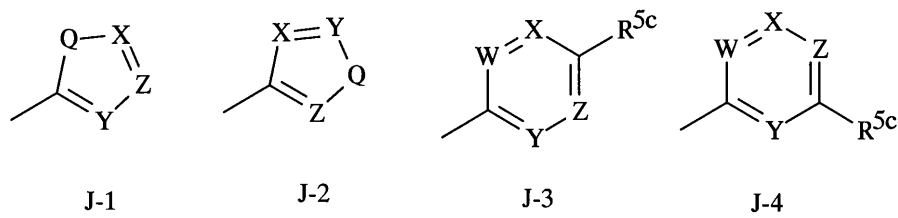
好ましいもの A。

20

J がフェニル環であるか、J-1、J-2、J-3、J-4

【0036】

【化 4】



30

【0037】

よりなる群から選択される 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環、各 J 環置換 R^{5a} が 1 から 2 個の R^{5b} で置換または任意に置換され、

Q が O、S または NR^{5c} であり、

W、X、Y および Z が独立して N または CR^{5c} (ただし、J-3 および J-4 では、W、X、Y または Z のうちの少なくとも 1 つが N である) であり、

R^1 および R^2 が各々独立して H または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

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

40

各 R^4 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または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

R^{5a} が K に対するオルト位で J に結合され、

R^{5a} および R^{5b} が各々独立して $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_1 \sim$

50

C₄ ハロアルキルチオ、C₁ ~ C₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁ ~ C₄ ハロアルキルスルホニル、C₂ ~ C₄ アルコキシカルボニルまたは C₃ ~ C₈ ジアルキルアミノカルボニルである；または各環が、R⁶ から独立して選択される置換基1~3個で場合により置換されていてよい、フェニル環、ベンジル環、あるいは5員環もしくは6員環の複素芳香環であり、

R^{5c} がHまたはR^{5a} であり、

各R⁶ が独立してハロゲン、CN、NO₂、C₁ ~ C₄ アルキル、C₂ ~ C₄ アルケニル、C₂ ~ C₄ アルキニル、C₃ ~ C₆ シクロアルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₁ ~ C₄ アルコキシまたはC₁ ~ C₄ ハロアルコキシであり、

nが1または2であり、

pが0、1または2である、式Iの化合物。

10

【0038】

好ましいものB。Jがフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンである、好ましいものAの化合物。

【0039】

好ましいものC。R¹ およびR² が各々Hであり、

1個のR⁴ がC₁ ~ C₃ アルキル、CF₃、OCF₃、OCHF₂、S(O)_pCF₃、S(O)_pCHF₂、ハロゲンよりなる群から選択され、任意の2番目のR⁴ がハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルよりなる群から選択される、好ましいものBの化合物。

20

【0040】

好ましいものD。

JがJ-1であり、

QがNR^{5a} であり、

XがNまたはCHであり、

YがCHであり、

ZがCR^{5b} であり、

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

30

R^{5b} がハロゲンまたはCF₃ である、好ましいものCの化合物。

【0041】

上述したように、Jはフェニル環、ナフチル環系、5員環もしくは6員環の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の芳香族縮合複素二環系であり、ここで各環または環系は1~4個のR⁵ で場合により置換されていてよい。これらのJ基に関して用いる「場合により置換されていてよい」という表現は、未置換の基または、未置換の類似体を持つ無脊椎有害生物防除活性を示さない非水素置換基を少なくとも1個有する基を示す。1~4個のR⁵ で場合により置換されていてよいフェニルの一例に、添付書類1のU-1 (R^v はR⁵ またはHであり、rは1~4の整数である) に示す環がある。1~4個のR⁵ で場合により置換されていてよいナフチル基の一例を添付書類1においてU-8 40 5 (R^v はR⁵ またはHであり、rは1~4の整数である) で示す。1~4個のR⁵ で場合により置換されていてよい5員環もしくは6員環の複素芳香環の一例には、添付書類1に示す環U-2~U-53 (R^v はR⁵ またはHであり、rは1~4の整数である) がある。上記のJ-1~J-4も5員環もしくは6員環の複素芳香環を示していることに注意されたい。U-2~U-20はJ-1の一例であり、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の例であることに注意されたい。1~4個のR⁵ で場合により置換されていてよい、8員環、9員環または10員環の芳香族縮合複素二環系の一例には、添付書類1に示すU-54~U-84 (R^v はR⁵ またはHであり、rは1~4の整数である) がある。

【0042】

50

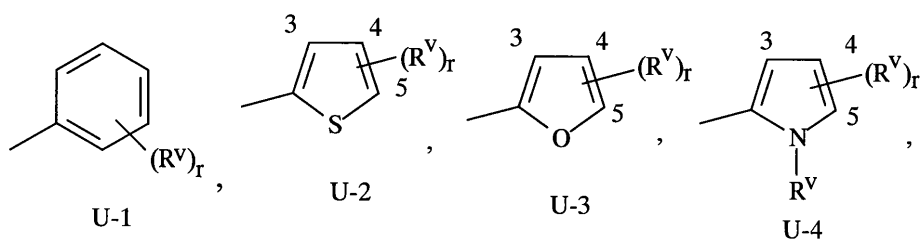
なお、構造U-1～U-85では R^v 基を示してあるが、これらの基は任意で存在しない R^5 と等価なHであってもよい点に注意されたい。 R^v が原子に結合した場合のHであれば、前記原子が未置換なのと同じである点に注意されたい。原子価を満たすのに置換が必要な窒素原子はHまたは R^v で置換される。U基の中には、4個未満の R^v 基でしか置換できないものがある（U-14、U-15、U-18～U-21、U-32～U-34などは1個の R^v でしか置換できない）点に注意されたい。（ R^v ）_rとU基との間の結合点を浮いた状態で示してある場合、（ R^v ）_rはU基の利用できる炭素原子のいずれに対しても結合可能である点に注意されたい。U基の結合点を浮いた状態で示してある場合、このU基は、式Iの残りの部分に対して水素原子を入れ替えることでU基の利用可能な炭素のいずれによっても結合可能である点にも注意されたい。

10

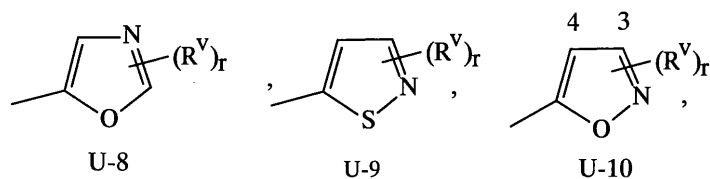
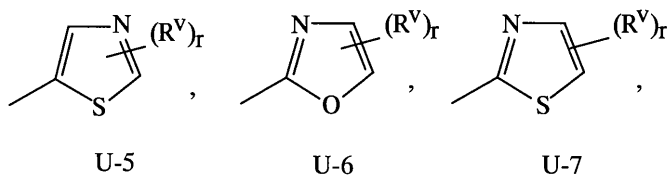
【0043】

【化5】

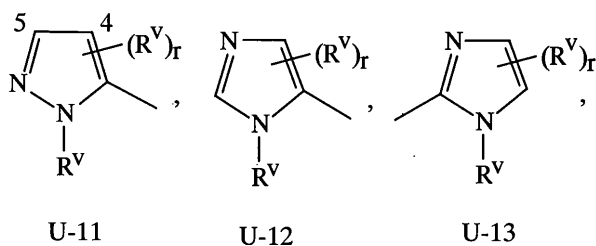
提示1



20



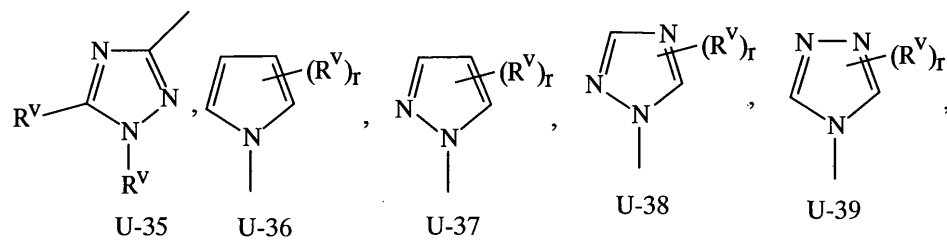
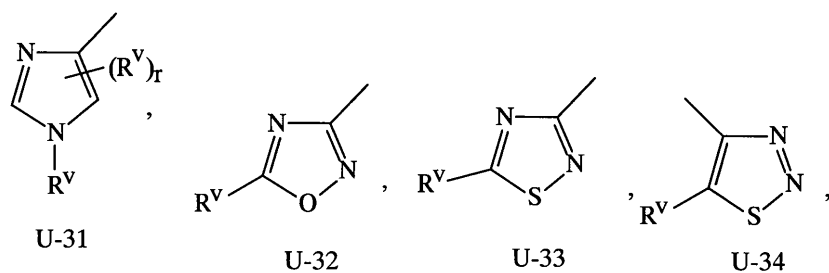
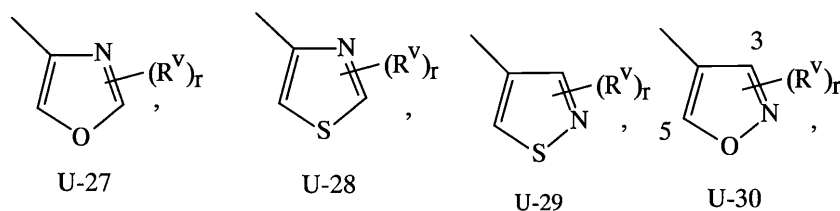
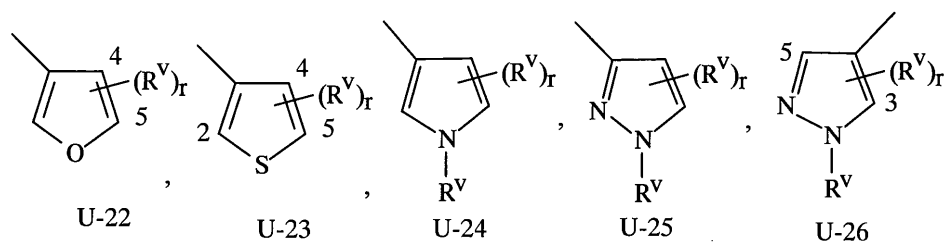
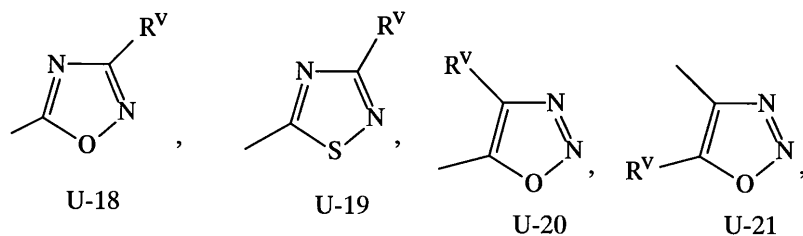
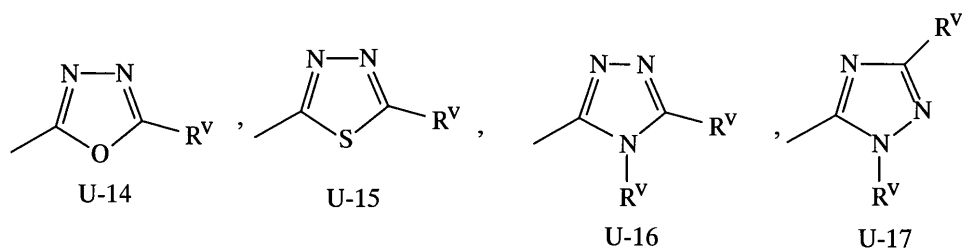
30



40

【0044】

【化6】



【 0 0 4 5 】

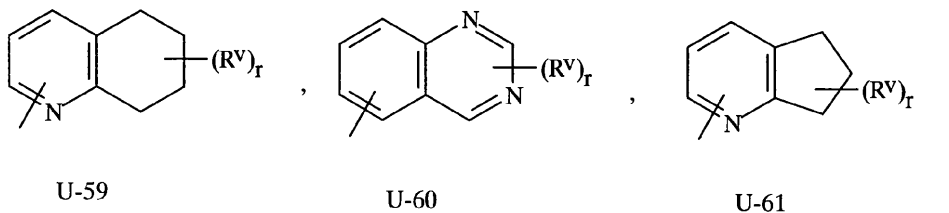
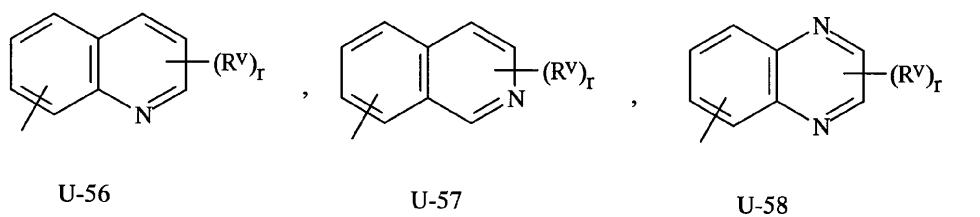
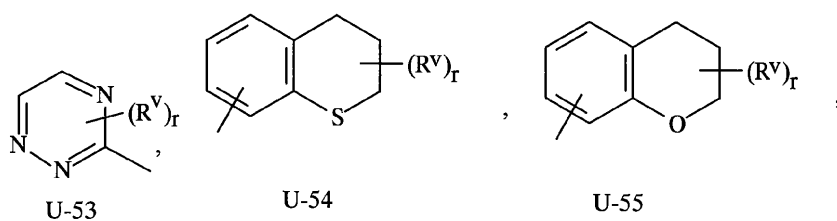
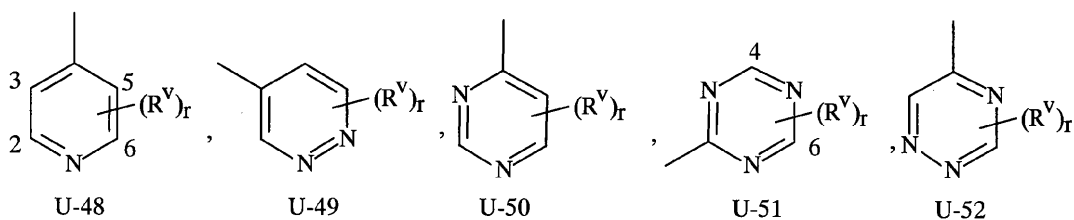
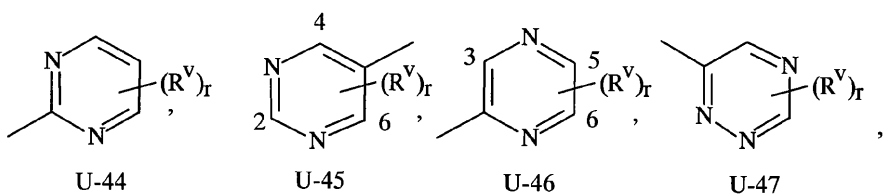
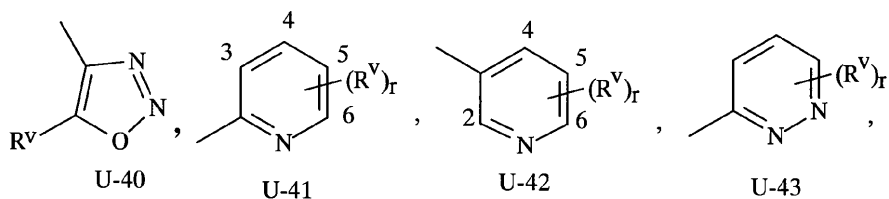
【 化 7 】

10

20

30

40



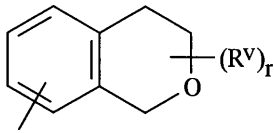
【 0 0 4 6 】
【 化 8 】

10

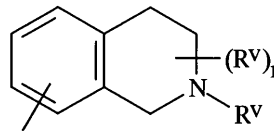
20

30

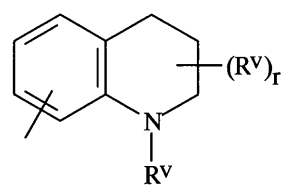
40



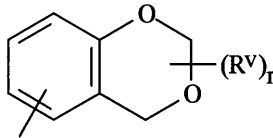
U-62



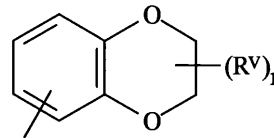
U-63



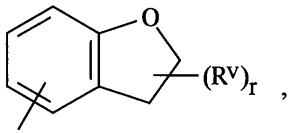
U-64



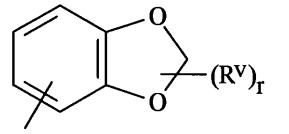
U-65



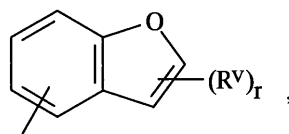
U-66



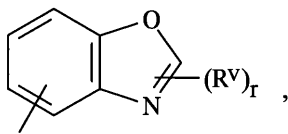
U-67



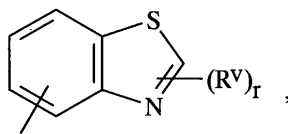
U-68



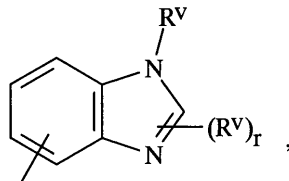
U-69



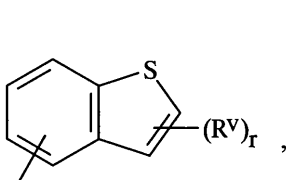
U-70



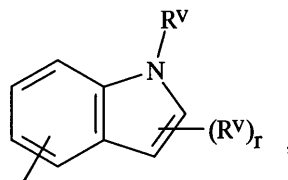
U-71



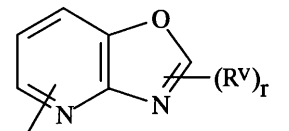
U-72



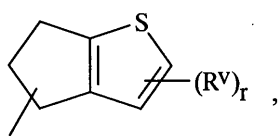
U-73



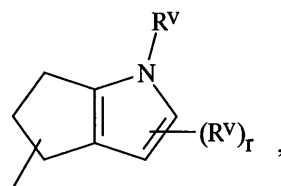
U-74



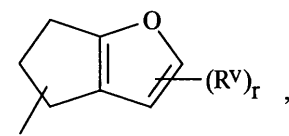
U-75



U-76



U-77



U-78

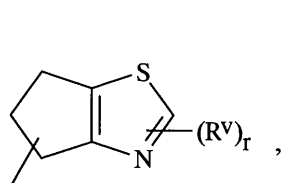
10

20

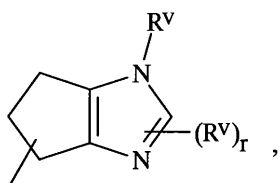
30

40

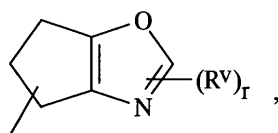
50



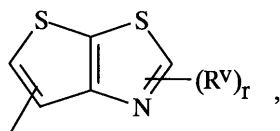
U-79



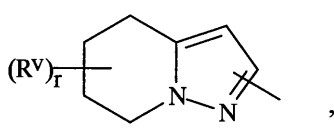
U-80



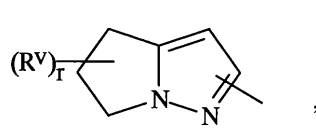
U-81



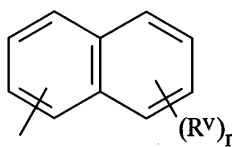
U-82



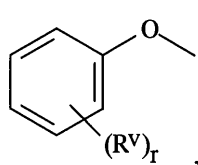
U-83



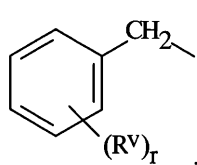
U-84



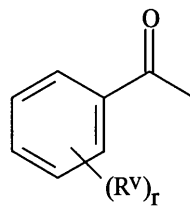
U-85



U-86



U-87



U-88

10

20

【0048】

上述したように、 R^3 については（特に）、各環が R^6 から独立して選択される置換基1～3個で場合により置換されていてもよい、フェニル環、フェノキシまたは5員環もしくは6員環の複素芳香環よりなる群から選択される1またはそれ以上の置換基で各々場合により置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ 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； $C_1 \sim C_4$ アルコキシ； $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ； $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ； $C_1 \sim C_4$ アルコキシ（ $C_1 \sim C_4$ アルキ）ルアミノ； $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ； $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルとすることができる。 R^3 の置換基環の例としては、このような環が R^v ではなく R^6 から独立して選択される置換基1～3個で場合により置換されていてもよい場合を除き、添付書類1に示すU-1～U-53およびU-86で示すような環があげられる。

30

【0049】

上述したように、各 R^5 については独立して（特に）、各環が R^6 から独立して選択される置換基1～3個で場合により置換されていてもよい、フェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシ、5員環もしくは6員環の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の芳香族縮合複素二環系とすることが可能である。このような R^5 基の例として、このような環が R^v ではなく R^6 から独立して選択される置換基1～3個で場合により置換されていてもよい場合を除き、添付書類1に示すU-1～U-88で示すような環または環系があげられる。

40

【0050】

式Iの化合物については、スキーム1～34で説明するような以下の方法およびそのバリエーションのうちの1またはそれ以上を用いて調製することが可能である。式Iの化合物と下記の式2～57における $R^1 \sim R^6$ 、J、K、Lおよびnの定義は、特に明記しない限り上記の発明の開示で定義したとおりである。式Ia～Ie、2a、5a-e、13a

50

－e および 49 a－b の化合物は、式 I、2、5、13 および 49 の化合物のさまざまな部分集合である。

【0051】

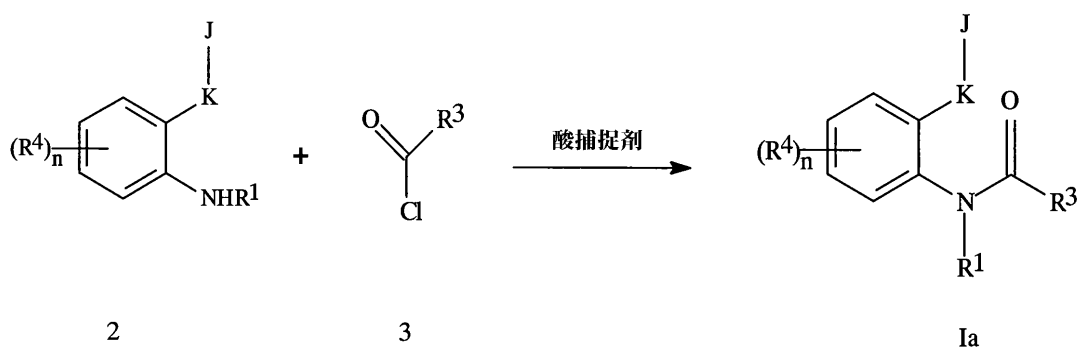
式 I の化合物は、スキーム 1 に示すように酸捕捉剤の存在下にて式 2 のアミンと式 3 の酸クロリドとのカップリングを行い、式 I a の化合物を得ることによって調製可能なものである。一般的な酸捕捉剤としては、トリエチルアミン、N，N－ジイソプロピルエチルアミン、ピリジンなどのアミン塩基があげられ、他の捕捉剤としては、水酸化ナトリウムや水酸化カリウムなどの水酸化物および炭酸ナトリウムや炭酸カリウムなどの炭酸塩があげられる。特定の条件では、ポリマー固定化 N，N－ジイソプロピルエチルアミンやポリマー固定化 4－（ジメチル）アミノピリジンなどのポリマー支持酸捕捉剤を使用すると有用な場合がある。カップリングについては、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好適な不活性溶媒中で実施し、式 I a のアニリドを得ることが可能である。

10

【0052】

【化 10】

スキーム 1



20

【0053】

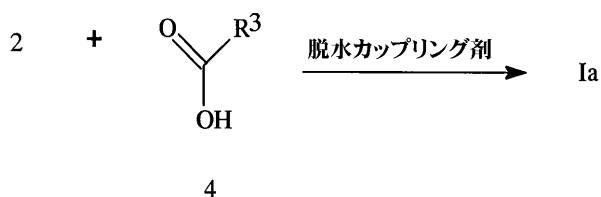
スキーム 2 に示すように、式 I a の化合物を調製するための別の手順では、1，3－ジシクロヘキシルカルボジイミド（DCC）などの脱水剤の存在下で、式 2 のアミンと式 4 の酸とのカップリングを行う。ここでもポリマー固定化 1，3－シクロヘキシルカルボジイミドなどのポリマー支持試薬が有用である。スキーム 1 および 2 の合成手順は、式 I の化合物を調製するのに役立つ方法の代表的な例である。このタイプの反応には非常に多くの合成に関する文献がある。

30

【0054】

【化 11】

スキーム 2



40

【0055】

周知の多くの方法で式 4 の酸から式 3 の酸クロリドを調製できることも当業者であれば分

50

かるであろう。たとえば、式 3 の酸クロリドは、触媒量の N, N-ジメチルホルムアミドの存在下にて、トルエンまたはジクロロメタンなどの不活性溶媒中でカルボン酸 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で、式 4 のカルボン酸から容易に生成されるものである。

【0056】

式 2 a のアミンは一般に、スキーム 3 に示すようにニトロ基を接触水素化することで、式 5 の対応するニトロ化合物から得られるものである。一般的な手順では、酸化炭素または酸化プラチナ上のパラジウムなどの金属触媒の存在下にて、エタノールやイソプロパノールなどのヒドロキシル溶媒中で水素を用いる還元を行う。また、酢酸中で亜鉛を用いる還元によってこれを調製することも可能である。これらの手順に関しては化学文献が豊富である。アルキル、置換アルキルなどの R¹ 置換基は通常、一般に好ましい方法であるアミンの還元アルキル化によってこの段階で導入可能なものである。シアノボロ水素化ナトリウムなどの還元剤の存在下でアニリン 2 a とアルデヒドとを組み合わせ、式 2 の化合物（式中、R¹ 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）を生成するのが普通に用いられている手順である。

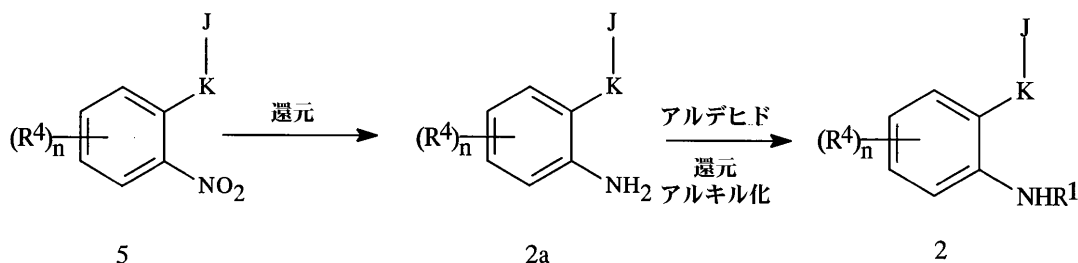
10

【0057】

【化 1 2】

スキーム 3

20



【0058】

30

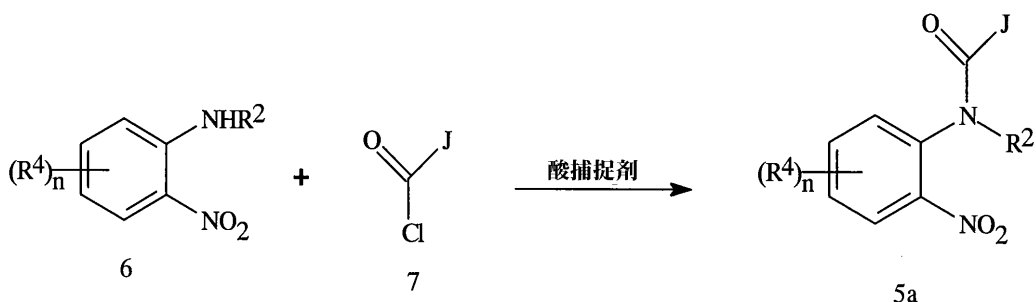
スキーム 4 に示すように、スキーム 1 で説明したものと類似の方法を用いて、式 6 のアミンと式 7 の酸クロリドとの反応によって式 5 a のニトロベンゼンを調製することが可能である。

【0059】

【化 1 3】

スキーム 4

40



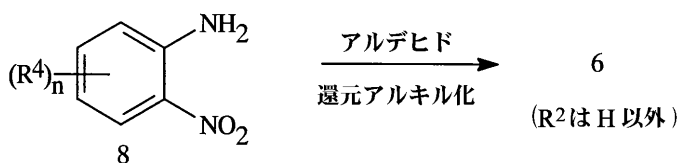
【0060】

スキーム 5 に示すように、スキーム 3 で説明したものと類似の方法を用いて、式 8 の第 1 級アミンの還元アルキル化によって式 6 のアミン（R² は H 以外である）を調製することが可能である。

50

【 0 0 6 1 】

【 化 1 4 】

スキーム 5

10

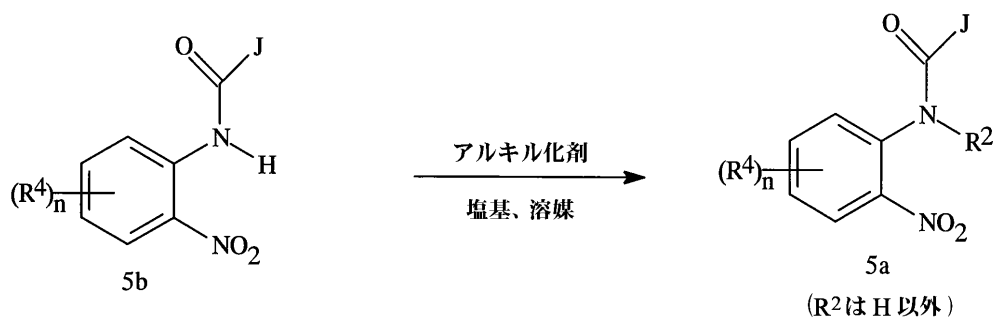
【 0 0 6 2 】

スキーム 6 は、テトラヒドロフランまたは N，N－ジメチルホルムアミド（DMF）などの不活性溶媒中にて、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で、ハロゲン化アルキルなどの好適なアルキル化剤を用いて式 5 b の化合物をアルキル化し、式 5 a のアニリド（式中、R² は水素以外である）を得られることを示している。この手順は特に、R² がアルキル、アルケニルまたはアルキニルである式 5 a の化合物を調製する場合に適用可能である。

【 0 0 6 3 】

【 化 1 5 】

20

スキーム 6

30

【 0 0 6 4 】

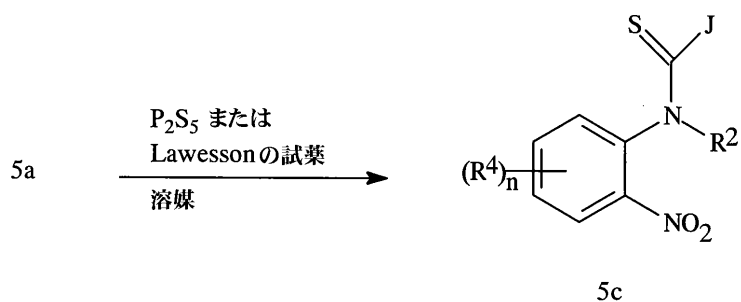
式 5 c のチオアニリドを調製する方法の概要をスキーム 7 に示す。式 5 a のアニリド（R² は、H、アルキルなど）と五硫化リンまたは Lawesson 試薬（すなわち 2，4－ビス（4－メトキシフェニル）－1，3－ジチア－2，4－ジホスフェタン－2，4－ジスルフィド）とを、ピリジンなどの好適な溶媒中にて室温または加熱下で反応させると、式 5 c のチオアニリドが得られる。

【 0 0 6 5 】

【 化 1 6 】

40

スキーム 7



10

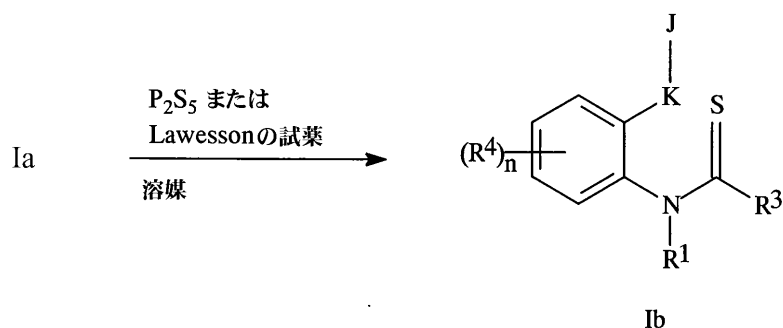
【0066】

また、スキーム 8 に示す方法を用いて、式 I a の対応するアニリドから式 I b のチオアニリドを調製することもできる。

【0067】

【化 17】

スキーム 8



20

30

【0068】

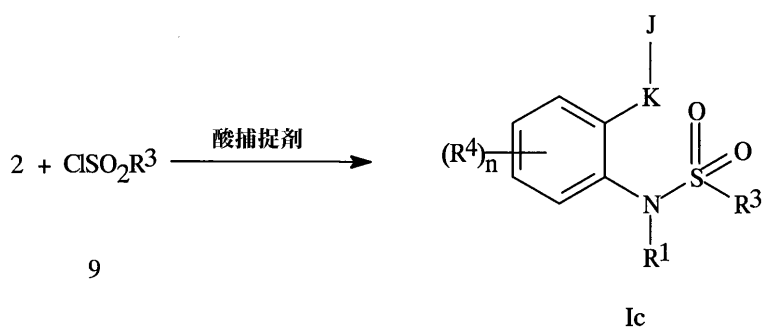
酸捕捉剤の存在下にて式 2 のアミンと式 9 の塩化スルホニルとを反応させることで、式 I c の化合物を調製することが可能である。一般的な酸捕捉剤としては、トリエチルアミン、N, N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジンなどのアミン塩基があげられ、他の捕捉剤としては、水酸化ナトリウムや水酸化カリウムなどの水酸化物および炭酸ナトリウムや炭酸カリウムなどの炭酸塩があげられる。特定の条件では、ポリマー固定化 N, N-ジイソプロピルエチルアミンやポリマー固定化 4-（ジメチル）アミノピリジンなどのポリマー支持酸捕捉剤を使用すると有用な場合がある。

【0069】

【化 18】

40

スキーム 9



10

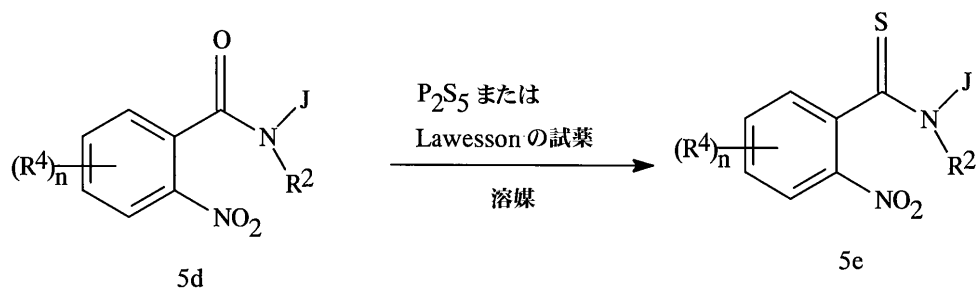
【0070】

式 5 e のチオアミドは、スキーム 7 で説明したものと同様の方法によって、式 5 d の対応するアミドから調製可能なものである。

【0071】

【化 19】

スキーム 10



20

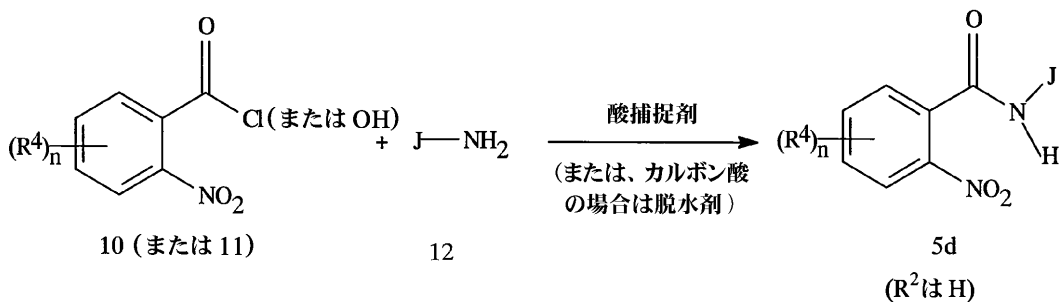
【0072】

スキーム 1 および 2 に記載のものと類似の方法によって、それぞれ式 10 の酸クロリドまたは式 11 のカルボン酸から式 5 d のアミド（式中、 R^2 は H である）を調製することが可能である。

【0073】

【化 20】

スキーム 11



40

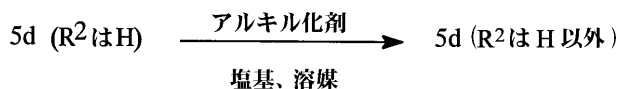
【0074】

式 5 d のアミド（式中、 R^2 は H 以外である）を、スキーム 6 に示したものと類似の方法によって、式 5 d の対応するアミドから調製することが可能である。

50

【 0 0 7 5 】

【 化 2 1 】

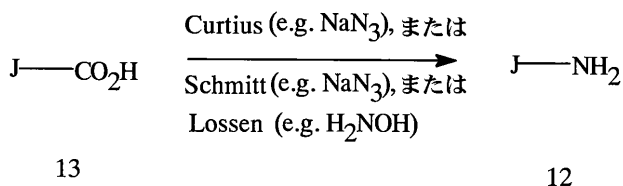
スキーム 12

【 0 0 7 6 】

Curtius、SchmittまたはLossenの条件を使用して、式13のカルボン酸（または対応する酸クロリド誘導体）から式12のアミンを調製することが可能である。これらの名前の反応に関しては文献に十分な説明がある。代表的ないくつかの反応条件については、R. C. ラロック (Larock)、Comprehensive Organic Transformations、1989、VCHパブリッシャーズ (Publishers)、第431～2ページを参照のこと。

【 0 0 7 7 】

【 化 2 2 】

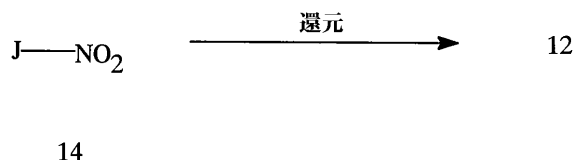
スキーム 13

【 0 0 7 8 】

式14の適当なニトロ化合物をスキーム3に示したものと同様の方法で還元し、式12のアミンを調製することも可能である。

【 0 0 7 9 】

【 化 2 3 】

スキーム 14

【 0 0 8 0 】

式13aの安息香酸（Jは場合により置換されていてもよいフェニルである）は、その調製手順が従来技術において周知であるのが普通のものである。本発明の安息香酸の特に有用な部分集合に式13aの2-メチル-4-パーフルオロアルキル安息香酸（1個のR⁵が、CF₃、C₂F₅、C₃F₇などである）がある。これらの化合物の合成に関してはスキーム15～19で概要を説明する。式13aの安息香酸は、式15のベンズニトリルから加水分解によって調製できるものである。使用する条件には、アルカリ金属水酸化物またはアルコキシド（水酸化カリウムまたは水酸化ナトリウムなど）などの塩基を、水、

10

20

30

40

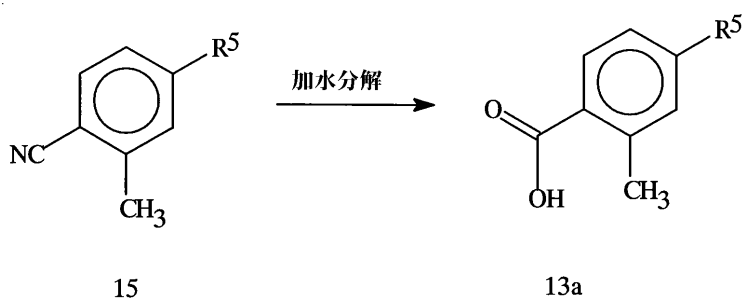
50

エタノールまたはエチレングリコールなどの溶媒中で使用することが含まれる場合がある（J. Chem. Soc. 1948、1025など）。あるいは、水（Org. Synth. 1955、Coll 第3巻、557など）などの好適な溶媒中にて、硫酸またはリン酸などの酸などを使用して加水分解を行ってもよい。条件をどのようにするかは反応条件に対するR⁵の安定性次第であり、この転換を達成するには高温を使用するのが普通である。

【0081】

【化24】

スキーム 15



10

20

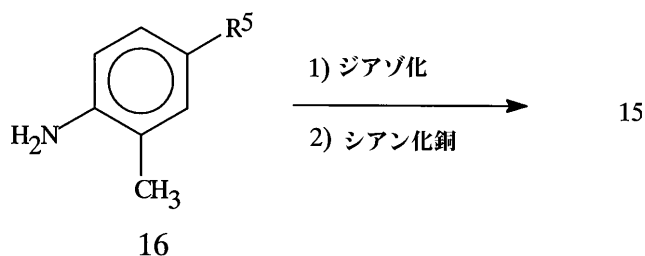
【0082】

ジアゾ化と中間体であるジアゾニウム塩をシアン化銅塩で処理する従来のシーケンスを用いて、式16のアニンから式15のニトリルを調製することが可能である（J. Amer. Chem. Soc. 1902、24、1035など）。

【0083】

【化25】

スキーム 16



30

【0084】

式16のアニリンは式17の化合物から調製できる。この転換は、ラネーニッケルを用いる周知の手順で達成できる（Org. Synth. Coll. Vol VI、581）。あるいは、水素の存在下にてパラジウムなどの好適な触媒を用いることで、同じ転換を行うことができる。この反応は、トルエンなどであるがこれに限定されるものではない好適な有機溶媒中にて、10²から10⁵ kPaの圧力で行われるのが普通である。この転換を達成するには、80～110℃の高温が必要になるのが普通である。当業者であれば把握できるであろうとおり、チオエーテル部分に関しては多数の化学修飾が可能であり、必要に応じてこれを用いて上記の転換を簡単にしてもよい。

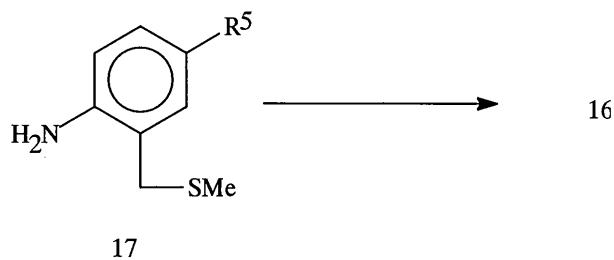
40

【0085】

【化26】

50

スキーム 17



10

【0086】

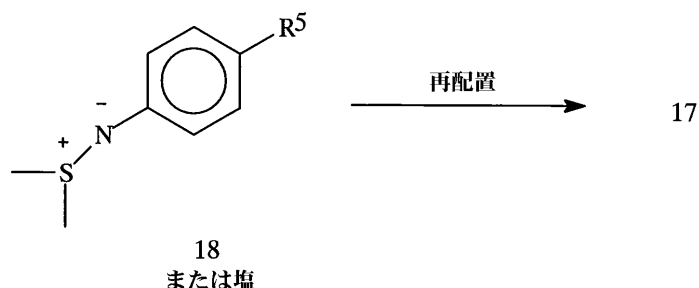
式17の化合物については式18のイミノスルフランから調製することができる。この転換は、トリエチルアミン (Org. Synth. Coll. Vol. VI、581など) またはナトリウムメトキシドなどの好適な塩基の存在下で、メタノールまたは水などのプロトン性溶媒中やジクロロメタンまたはトルエンなどの非プロトン性溶媒中にて達成でき、あるいはプロトン性溶媒、プロトン性溶媒、塩基との組み合わせで行うようにしてもよい。反応を行う温度は通常、40～110℃の範囲である。当業者であれば把握できるであろうとおり、塩酸塩、硫酸塩または硫酸水素塩などであるがこれに限定されるものではない、式18の化合物の好適な塩を用いてもよい（ただし、まず最初に適切な量の塩基を使用して遊離塩基18を生成する）。これについては、別のステップで行ってもよいし、あるいは式18の化合物を式17の化合物に転換するステップの一環として行ってもよい。

20

【0087】

【化27】

スキーム 18



30

【0088】

式18の化合物は、硫化ジメチルとN-クロロスクシンイミド (Org. Synth. Coll. Vol. VI、581など)、塩素またはN-クロロベンゾトリアゾールなどであるがこれに限定されるものではない好適な塩素化剤との反応によって、式19のアニンから調製できる。あるいは、式19のアニンを、酢酸無水物、トリフルオロ酢酸無水物、トリフルオロメタンスルホン酸無水物、シクロヘキシルカルボジイミド、三酸化硫黄または五酸化リンなどの薬剤での処理によって「活性化」させたジメチルスルホキシドで処理してもよい。この反応については、ジクロロメタンまたはジメチルスルホキシドなどの好適な有機溶媒中で行う。反応を行うのは-70℃から25℃の温度であり、最適な温度は使用する溶媒と試薬とに依存する。

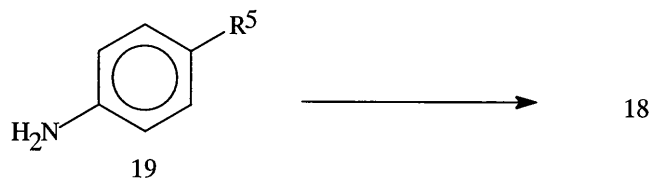
40

【0089】

50

【化 28】

スキーム 19



10

【0090】

Jが場合により置換されていてもよい複素環に等しい複素環酸 (heterocyclic acid) 13を、スキーム20～25に概要を示す手順で調製することが可能である。チオフエン、フラン、ピリジン、ピリミジン、トリアゾール、イミダゾール、ピラゾール、チアゾール、オキサゾール、イソチアゾール、チアジアゾール、オキサジアゾール、トリアジン、ピラジン、ピリダジンおよびイソオキサゾールをはじめとする、さまざまな複素環酸に関する一般的な参考文献や特化した参考文献の両方を、以下の概説書から見出すことができる：Rodd's Chemistry of Chemistry of Carbon Compounds、第IVa巻から第IVl巻、S. コフフェイ (Coffey) 編、エルゼビア・サイエンティフィック・パブリッシング (Elsevier Scientific Publishing)、ニューヨーク、1973；Comprehensive Heterocyclic Chemistry、第1～7巻、A. R. カトリツキー (Katritzky) およびC. W. リーズ (Rees) 編、ペルガモン・プレス (Pergamon Press)、ニューヨーク、1984；Comprehensive Heterocyclic Chemistry II、第1～9巻、A. R. カトリツキー (Katritzky)、C. W. リーズ (Rees) およびE. F. スクライベン (Scriven) 編、ペルガモン・プレス (Pergamon Press)、ニューヨーク、1996；The Chemistry of Heterocyclic Compoundsシリーズ、E. C. テイラー (Taylor) 編、ウィレイ (Wiley)、ニューヨーク。本発明の特に有用な複素環酸としては、

20

30

【0091】

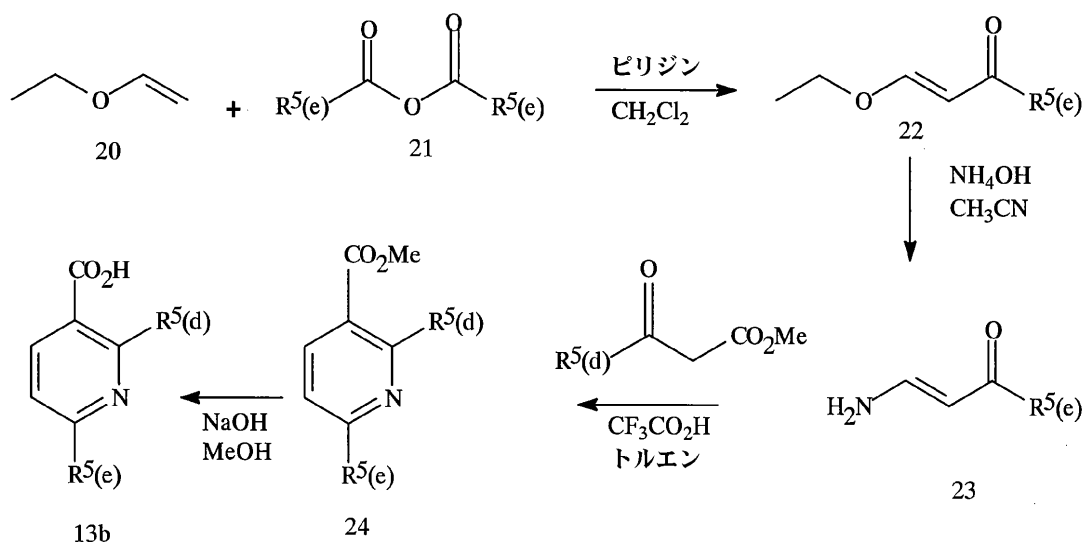
式13bの代表的なピリジン酸の合成をスキーム20に示す。この手順では、式23の4-アミノブテノンとβ-ケトエステルとからピリジンを得る周知の合成法を用いる。置換基R⁵ (d) およびR⁵ (e) はアルキルやハロアルキルなどを含む。この方法に対する中心的な参考資料については、Synthesis、1999、(7)、1216～1222およびHeterocycles、1997、46、129～132を参照のこと。

【0092】

40

【化 29】

スキーム 20



10

20

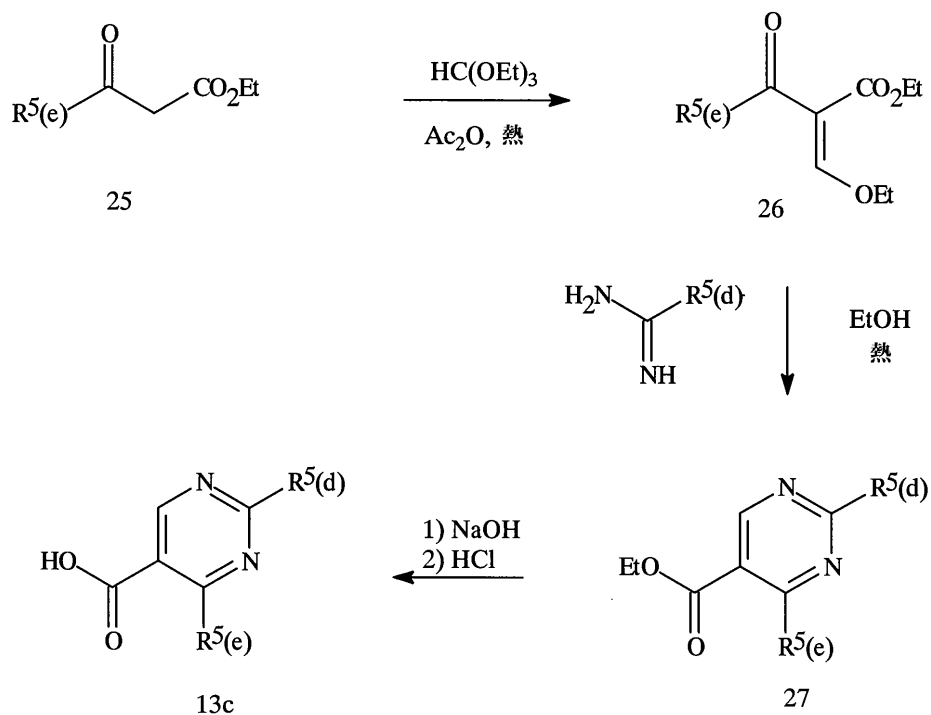
【0093】

式13cの代表的なピリミジン酸の合成をスキーム21に示す。この手順では、式26のビニリデン-β-ケトエステルとアミジンとからピリミジンを得る周知の合成法を用いる。置換基 $R^5(d)$ および $R^5(e)$ はアルキルやハロアルキルなどを含む。この方法に対する中心的な参考文献については、Bull. Soc. Chim. Fr.、1987、(2)、318～324を参照のこと。

【0094】

【化30】

スキーム 21



30

40

【0095】

50

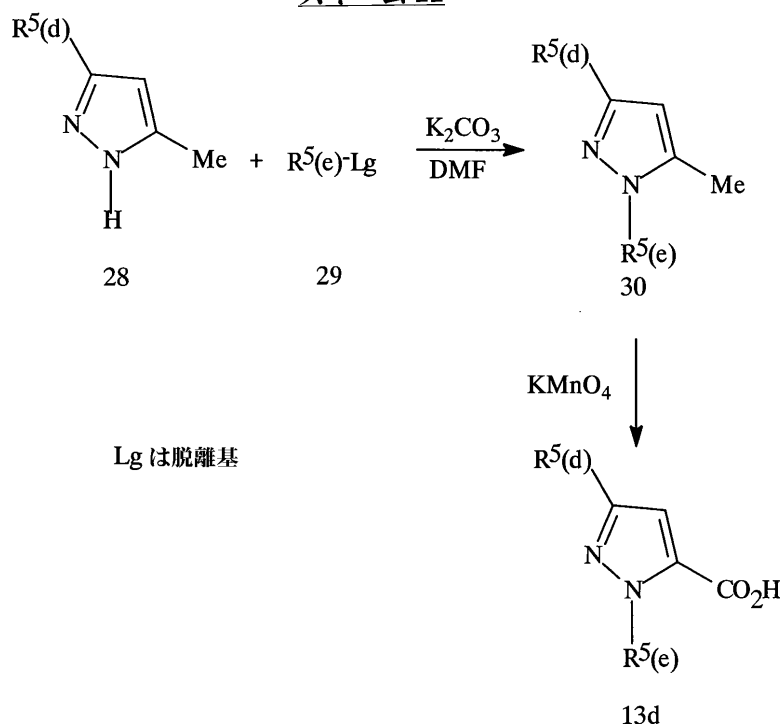
式 1 3 d の代表的なピラゾール酸の合成をスキーム 2 2 ～ 2 5 に示す。スキーム 2 2 における 1 3 d の合成では、重要なステップとして、式 2 8 のピラゾールをアルキル化して $R^5(e)$ 置換基の導入を行う。アルキル化剤 $R^5(e)-Lg$ (式中、 Lg は、 C_1 、 B 、 r 、 I などの脱離基、 p -トルエンスルホネートまたはメタンスルホネートなどのスルホン酸塩、あるいは $-OSO_2R^5(e)$ などの硫酸塩である) は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ 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、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ 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；各環または環系が、場合により置換されていてもよい、フェニル、ベンジル、ベンゾイル、5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環または 8 員環、9 員環もしくは 10 員環の芳香族縮合複素二環系などの $R^5(e)$ 基を含む。メチル基が酸化されるとピラゾールカルボン酸が得られる。なお一層好ましい $R^5(d)$ 基の中にはハロアルキルが含まれる。

10

【0096】

【化31】

スキーム 22



20

30

【0097】

ピラゾール酸の中には、重要なステップ (スキーム 2 3) として式 3 2 のピラゾールをメタレーションならびにカルボキシル化して調製できるものがある。スキーム 2 2 と同様の方法すなわち、 $R^5(e)$ アルキル化剤でのアルキル化によって $R^5(e)$ 基を導入する。代表的な $R^5(d)$ 基としては、シアノおよびハロアルキルなどを含む。

40

【0098】

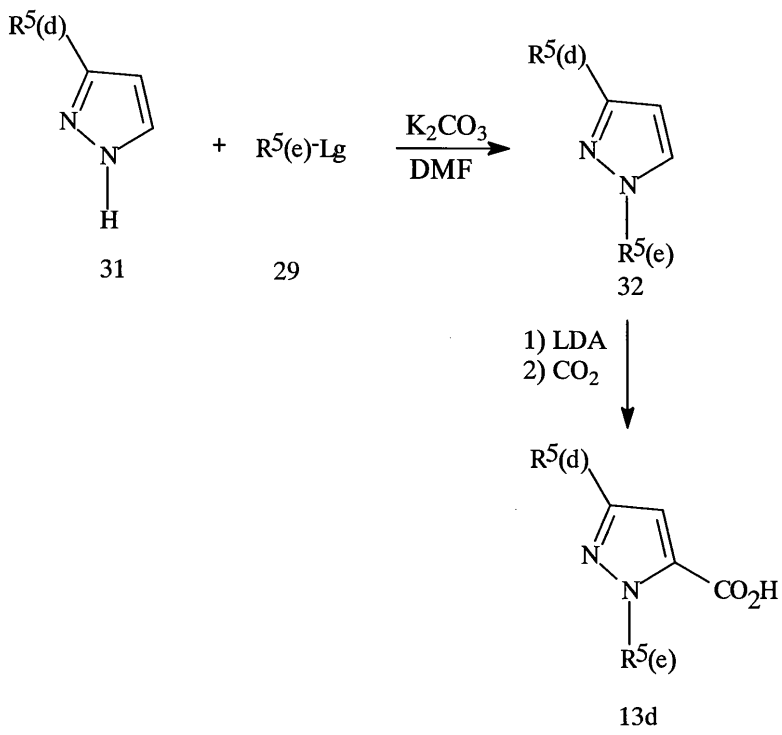
場合により置換されていてもよいフェニルヒドラジン 3 3 とピルビン酸塩 3 4 との反応によって、式 1 3 d の他のピラゾールを調製し、ピラゾールエステル 3 5 を得ることが可能である (スキーム 2 4)。エステルを加水分解するとピラゾール酸 1 3 d が得られる。この手順は、 $R^5(e)$ が場合により置換されていてもよいフェニルであり、 $R^5(d)$ がハロアルキルである化合物を調製する上で特に有用である。

【0099】

【化32】

50

スキーム 23



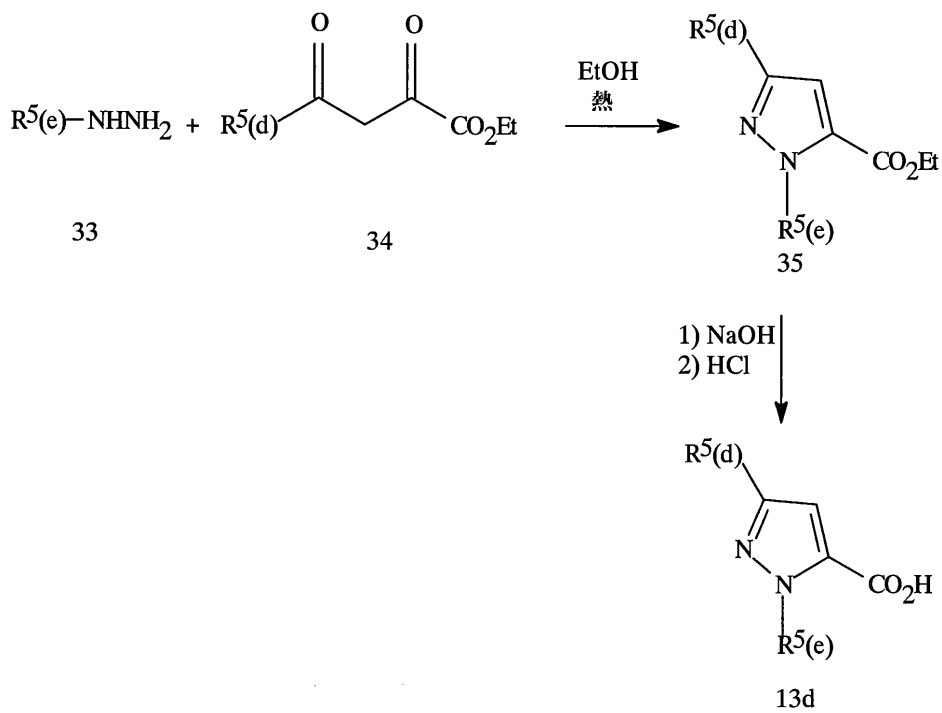
10

20

【 0 1 0 0 】

【 化 3 3 】

スキーム 24



30

40

【 0 1 0 1 】

50

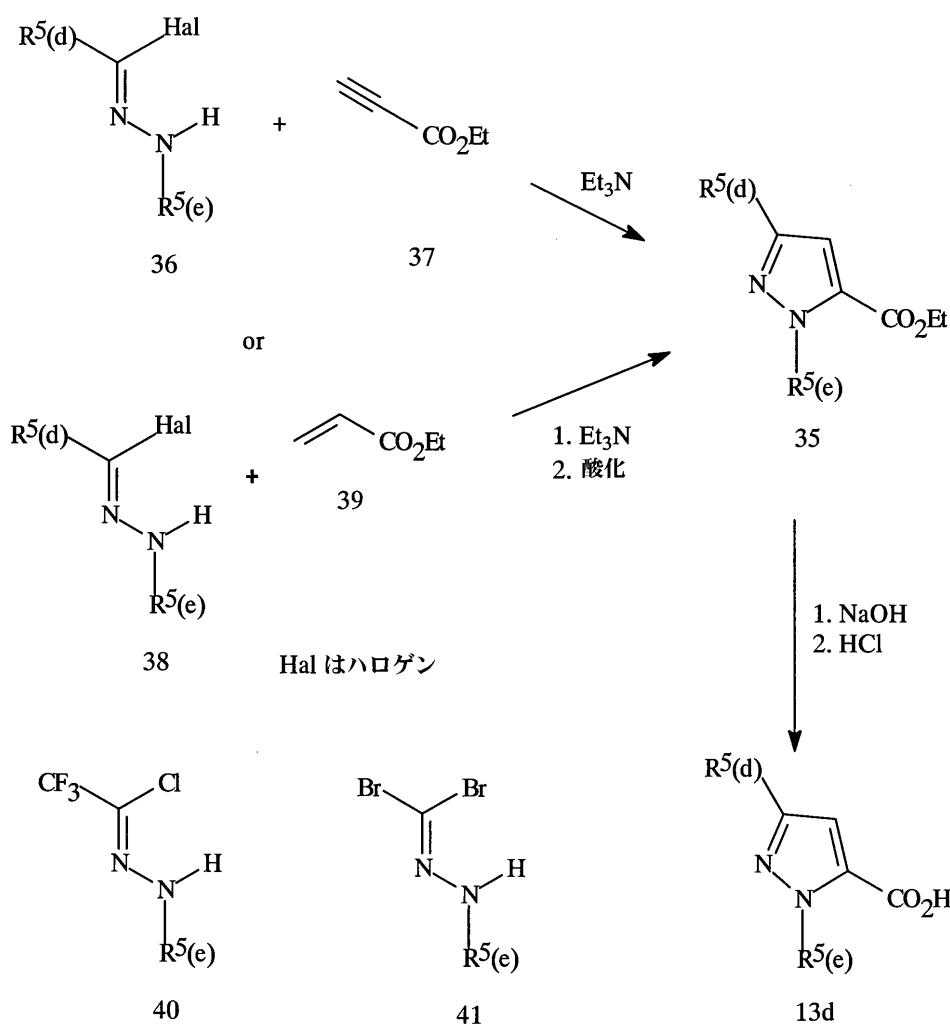
スキーム 25 に示すように、式 37 の置換プロピオレートまたは式 39 のアクリレートのうちのいずれかを用いて、適切に置換されたニトリリミンの 3 + 2 環状付加を行うことで、式 13 d のピラゾール酸を調製することも可能である。アクリレートを用いての環状付加では、中間体のピラズリンをさらに酸化させてピラゾールに変える必要がある。これらのエステル 35 を加水分解するとピラゾール酸 13 d が得られる。この反応に好ましいイミノハライドとしては、トリフルオロメチルイミノクロリド 40) とイミノジブロミド (41) があげられる。40 などの化合物は周知である (J. H e t e r o c y c l . C h e m . 1985、22 (2)、565~8)。41 などの化合物については、周知の方法 (T e t r a h e d r o n L e t t e r s 1999、40、2605) で得ることができる。これらの手順は、R⁵ (e) が場合により置換されていてもよいフェニルであり、R⁵ (d) がハロアルキルまたはブロモである化合物を調製する上で特に有用である。

10

【0102】

【化34】

スキーム 25



20

30

40

【0103】

場合により置換されていてもよいフェニルヒドラジン 33 と式 42 のケトニトリルとの反応によって、式 12 a のピラゾールアミンを調製することが可能である。この環化反応に関しては文献に十分な説明がある。中心的な参考文献ならびに代表的ないくつかの反応条件については、P C T 出願公開第 01 / 004115 号パンフレットならびに、S y n t

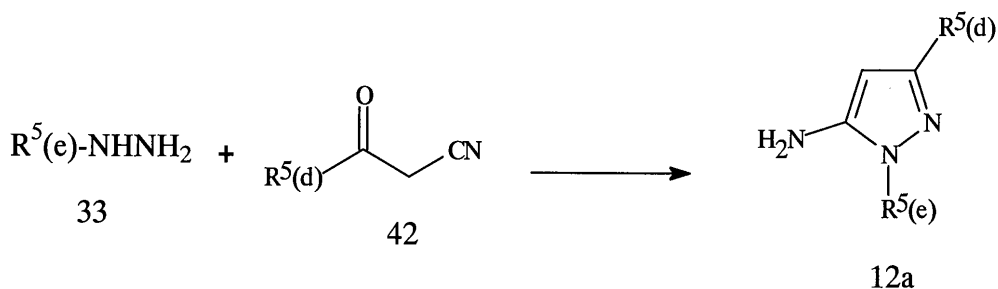
50

hesis、1997、(3)、337～341を参照のこと。反応条件に関しては本発明の実施例7も参照のこと。

【0104】

【化35】

スキーム26



10

【0105】

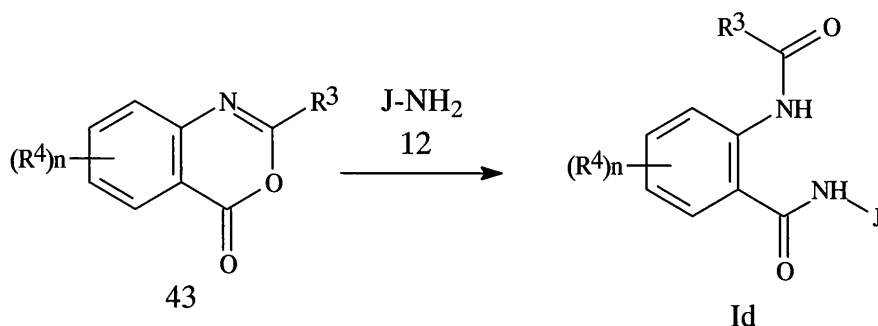
式Idの化合物は、スキーム27に示すようにベンゾキサジノン43をアミン12で処理することで調製可能なものである。アントラニルアミドを生成するためのベンゾキサジノンとアミンとの一般的な反応は化学文献に十分な説明がある。ベンゾキサジノン化学の概説であれば、ヤコブセン (Jakobsen) ら、*Bioorganic and Medicinal Chemistry* 2000、8、2095～2103ならびに同文献に引用の参考文献を参照のこと。ベンゾキサジノン43を調製するための代表的な反応方法については、*Journal of Heterocyclic Chemistry*、2000、37(4)、725～729および*Tetrahedron*、1995、51(7)、1861～6を参照のこと。

20

【0106】

【化36】

スキーム27



30

40

【0107】

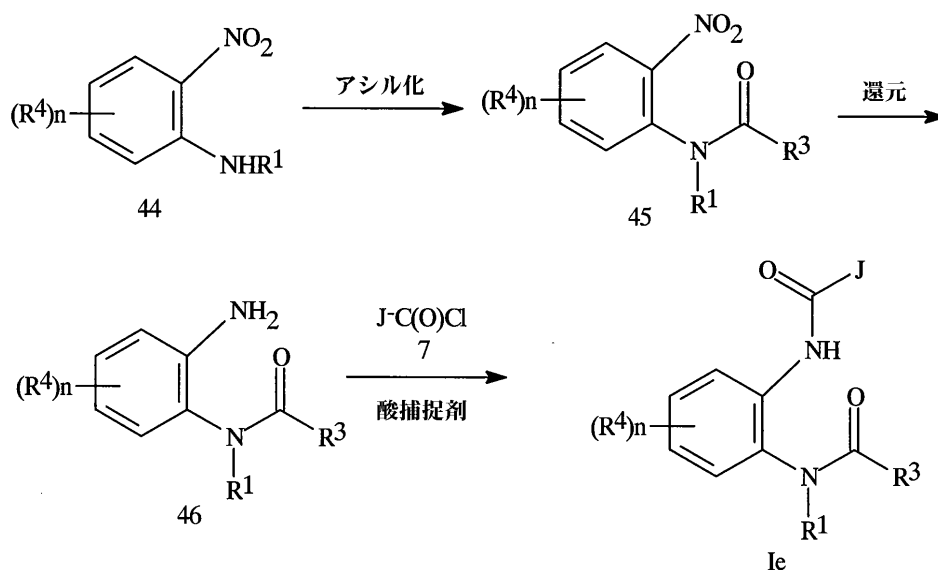
スキーム28に示す方法で、式Ieの化合物を調製することができる。アミン44のアシル化に続いてニトロ基を還元すると、式46のアミンが得られる。アミン46と酸クロリド7とをカップリングすると、スキーム1で説明したものと類似の方法で式Ieの化合物が得られる。スキーム3で説明したものと類似の方法での還元アルキル化によって、式44の化合物を調製することができる。アシル化反応については、スキーム1およびスキーム2で説明したものと類似の方法での酸クロリド3または酸4とのカップリングにより達成することが可能である。

【0108】

50

【化 3 7】

スキーム 28



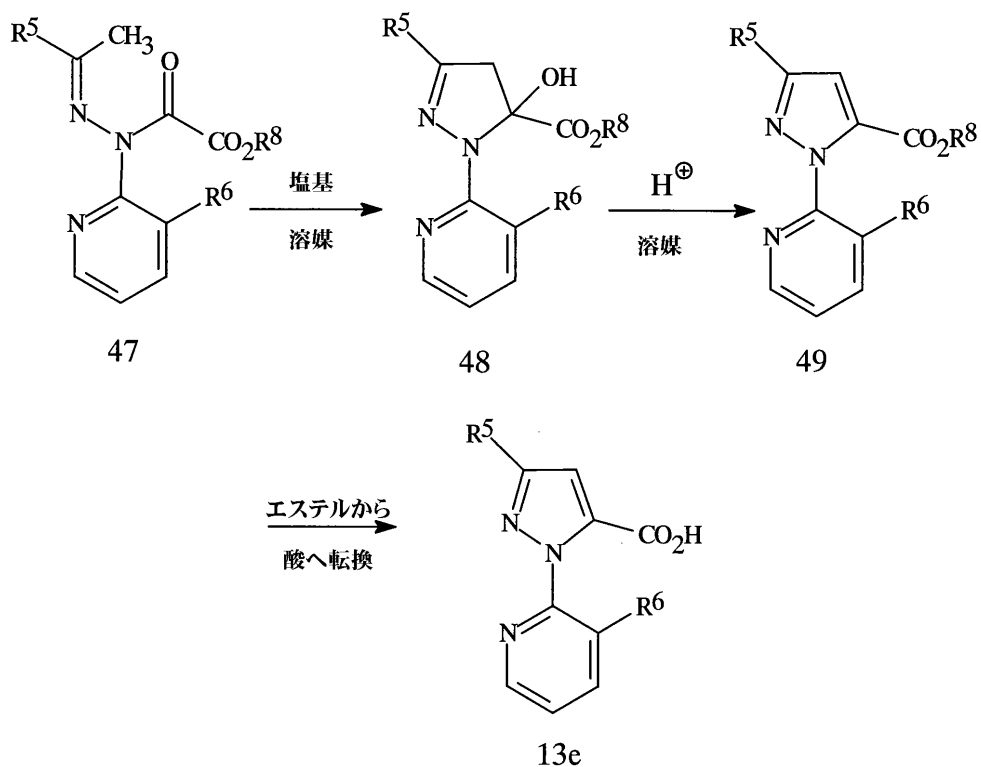
【0109】

スキーム 29 に概要を示す方法で、 R^5 が CF_3 である式 13e のピラゾールカルボン酸を調製することができる。

【0110】

【化 3 8】

スキーム 29



【0111】

50

R⁸ が C₁ ~ C₄ アルキルである式 47 の化合物と好適な塩基とを好適な有機溶媒中で反応させると、酢酸などの酸による中和後に式 48 の環化生成物が得られる。好適な塩基としては、たとえば、水素化ナトリウム、カリウム *t*-ブトキシド、ジメチルナトリウム (CH₃ S (O) CH₂ · 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) 炭酸塩または水酸化物、フッ化テトラアルキルまたは水酸化テトラアルキル (メチル、エチルまたはブチルなど) アンモニウムまたは 2-*tert*-ブチルイミノ-2-ジエチルアミノ-1, 3-ジメチル-ペルヒドロ-1, 3, 2-ジアザホスホニン (diazaphosphonine) をあげることができるが、これに限定されるものではない。好適な有機溶媒としては、たとえば、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をあげることができるが、これに限定されるものではない。環化反応は通常、約 0 から 120 °C の温度範囲で行われる。溶媒、塩基、温度および添加時間による影響はいずれも相互依存性であり、副成物が生成されるのを最小限に抑えるには反応条件の選択が重要になる。好ましい塩基のひとつにフッ化テトラブチルアンモニウムがある。

10

【0112】

式 48 の化合物を脱水処理して式 49 の化合物を得た後、カルボキシルエステル官能基をカルボン酸に転換すると、式 13e の化合物が得られる。触媒量の好適な酸で処理することで脱水を実施する。この触媒酸としては、たとえば硫酸をあげることができるが、これに限定されるものではない。この反応は、有機溶媒を使用して行われるのが普通である。当業者であれば分かるであろうとおり、脱水反応は、通常は約 0 から 200 °C、一層好ましくは約 0 から 100 °C の温度範囲で、広範囲にわたる溶媒中で実施できるものである。スキーム 9 の方法における脱水の場合、酢酸を含む溶媒と約 65 °C の温度が好ましい。無水条件下での求核的切断あるいは、酸または塩基のいずれかの使用を伴う加水分解法をはじめとする多数の方法 (方法の概説については T. W. グリーン (Greene) および P. G. M. ウーツ (Wuts)、Protective Groups in Organic Synthesis、第 2 版、ジョン・ワイリー・アンド・サンズ・インコーポレイテッド (John Wiley & Sons, Inc.)、ニューヨーク、1991、第 224 ~ 269 頁を参照のこと) で、カルボキシルエステル化合物をカルボン酸化合物に転換することが可能である。スキーム 9 の方法の場合、塩基触媒加水分解法が好ましい。好適な塩基としては、アルカリ金属 (リチウム、ナトリウムまたはカリウムなど) 水酸化物があげられる。たとえば、水とエタノールなどのアルコールとの混合物にエステルを溶解することが可能である。水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムで処理すると、エステルが鹼化し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。塩酸または硫酸などの強酸を用いる酸性化を行うと、式 13e のカルボン酸が得られる。このカルボン酸は、結晶化、抽出、蒸留をはじめとする当業者間で周知の方法で単離可能なものである。

20

30

【0113】

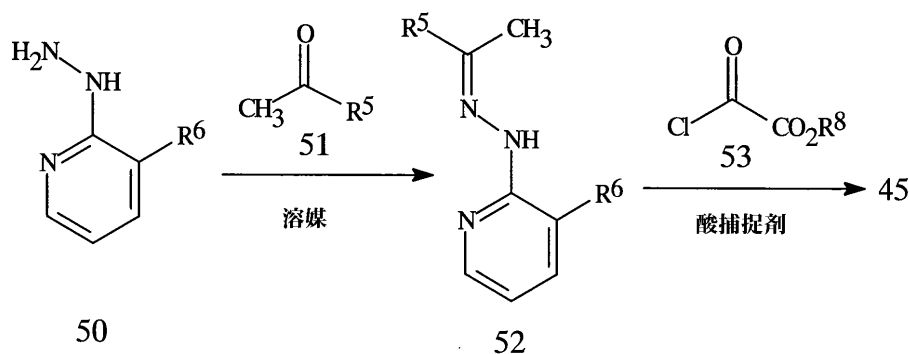
式 47 の化合物については、スキーム 30 に概要を示す方法で調製することができる。

【0114】

【化 39】

40

スキーム 30



10

【0115】

式中、 R^5 は CF_3 であり、 R^8 は $C_1 \sim C_4$ アルキルである。

【0116】

水、メタノールまたは酢酸などの溶媒中にて、式 50 のヒドラジン化合物を式 51 のケトンで処理すると、式 52 のヒドラゾンが得られる。この反応には、式 52 のヒドラゾンの分子置換パターン次第で高温が必要になる場合があることや任意の酸による触媒作用が必要になる場合があることは、当業者であれば理解できよう。トリエチルアミンなどの酸捕捉剤の存在下で、ジクロロメタンまたはテトラヒドロフランなどであるがこれに限定されるものではない好適な有機溶媒中にて、式 52 のヒドラゾンを式 53 の化合物と反応させると、式 47 の化合物が得られる。通常、この反応は、約 0 から 100 °C の温度で行われる。スキーム 30 の方法に関するさらに詳しい実験内容については、実施例 8 で説明する。式 50 のヒドラジン化合物は、対応する 2-ハロピリジンとヒドラジンと接触させるなどの標準的な方法で調製可能なものである。

20

【0117】

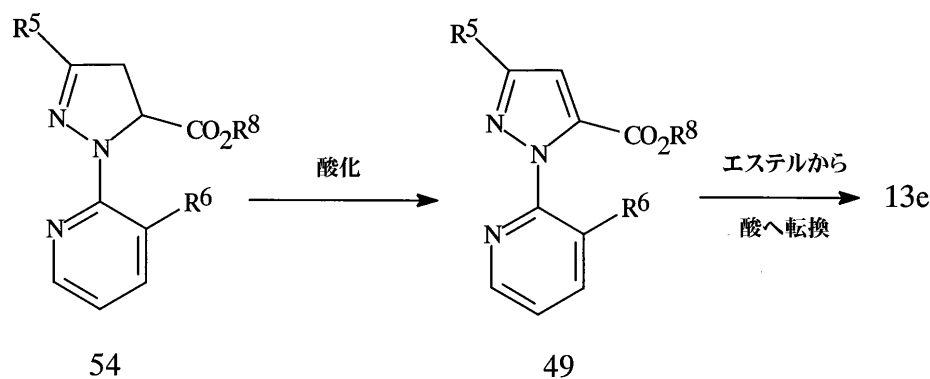
スキーム 29 に示す方法に代わるものとして、 R^5 が Cl または Br である、式 13e のピラゾールカルボン酸を、スキーム 31 に概要を示す方法で調製することができる。

【0118】

【化 40】

30

スキーム 31



40

【0119】

式中、 R^8 は $C_1 \sim C_4$ アルキルである。

【0120】

任意に酸の存在下で式 54 の化合物を酸化させて式 49 の化合物を得た後、カルボキシルエステル官能基をカルボン酸に転換すると、式 13e の化合物が得られる。酸化剤として

50

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、過一硫酸カリウム（オキソン（Oxone）（登録商標）など）または過マンガン酸カリをあげることができる。完全な転換状態を得るには、式 54 の化合物に対して少なくとも 1 当量の酸化剤を使用するものとし、好ましくは約 1 から 2 当量使用する。この酸化は一般に、溶媒の存在下で行われる。溶媒には、テトラヒドロフラン、p-ジオキサンなどのエーテル、酢酸エチル、炭酸ジメチルなどの有機エステル、あるいは N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリルなどの極性非プロトン性有機物質を用いることができる。酸化ステップで使用するのに適した酸には、硫酸、リン酸などの無機酸ならびに、酢酸、安息香酸などの有機酸がある。酸を使用する場合、この酸については式 54 の化合物に対して 0.1 当量を超える量で用いるものとする。完全な転換状態を得るには、1 から 5 当量の酸を用いることが可能である。好ましいオキシダントは過硫酸カリウムであり、硫酸の存在下で酸化を行うと好ましい。この反応は、酸を使用する場合は酸と所望の溶媒との中で式 54 の化合物を混合して行うことが可能なものである。続いて都合のよい速度でオキシダントを加えることができる。反応を終了させるのに相応の反応時間が得られる（好ましくは 8 時間未満となる）ように、反応温度は一般に約 0℃と低いところから溶媒の沸点までの間で変更される。所望の生成物である式 49 の化合物は、結晶化、抽出、蒸留をはじめとする当業者間で周知の方法で単離可能なものである。式 49 のエステルを式 13e のカルボン酸に転換するのに適した方法は、スキーム 29 ですすでに述べたとおりである。

10

20

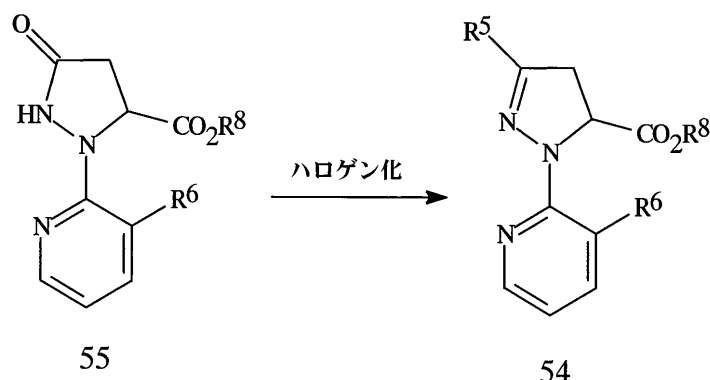
【0121】

式 54 の化合物は、スキーム 32 に示すようにして対応する式 55 の化合物から調製可能なものである。

【0122】

【化 41】

スキーム 32



30

【0123】

式中、R⁸ は C₁ ~ C₄ アルキルである。

【0124】

通常は溶媒の存在下で式 55 の化合物をハロゲン化試薬で処理すると、式 54 の対応するハロ化合物が得られる。使用可能なハロゲン化試薬には、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ホラン、ジハロジフェニルホスホラン、塩化オキサリル、ホスゲンがある。好ましいのはオキシハロゲン化リンと五ハロゲン化リンである。完全な転換状態を得るには、式 55 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るものとし、好ましくは約 0.33 から 1.2 当量の間で使用する。完全な転換状態を得るには、式 55 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るものとし、好ましくは約 0.20 から 1.0 当量の間で使用する。この反応には、R⁸ が C₁ ~ C₄ アルキルである式 55 の化合物が好ましい。このハロゲン化に合った一般的な溶媒には、ジクロロメタン、クロ

40

50

ロホルム、クロロブタンなどのハロゲン化アルカン、ベンゼン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族溶媒、テトラヒドロフラン、p-ジオキサン、ジエチルエーテルなどのエーテル、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がある。任意に、トリエチルアミン、ピリジン、N, N-ジメチルアニリンなどの有機塩基を添加することも可能である。N, N-ジメチルホルムアミドなどの触媒の添加も任意である。好ましいのは、溶媒がアセトニトリルで塩基を使用しないプロセスである。一般に、アセトニトリル溶媒を用いるのであれば、塩基と触媒はいずれも必要ない。この好ましいプロセスは式55の化合物をアセトニトリル中で混合して行われる。続いて都合の良い時間をかけてハロゲン化試薬を加え、反応が終了するまで混合物を所望の温度で保持する。反応温度は一般に20℃からアセトニトリルの沸点の間であり、反応時間は一般に2時間未満である。この反応マスを、重炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウムなどの無機塩基、あるいは酢酸ナトリウムなどの有機塩基で中和する。所望の生成物である式54の化合物は、結晶化、抽出、蒸留をはじめとする当業者間で周知の方法で単離可能なものである。

10

【0125】

あるいは、 R^5 が異なるハロゲン (R^5 がBrである式54を得る場合はClなど) またはp-トルエンスルホネート、ベンゼンスルホネートおよびメタンスルホネートなどのスルホン酸基である式54の対応する化合物を、臭化水素または塩化水素でそれぞれ処理することで、 R^5 がBrまたはClである式54の化合物を調製することが可能である。この方法によって、式37の開始化合物の R^6 ハロゲンまたはスルホネート置換基が、たとえばそれぞれ臭化水素または塩化水素からのBrまたはClに置換される。この反応は、ジブロモメタン、ジクロロメタンまたはアセトニトリルなどの好適な溶媒中で行われる。この反応は、圧力容器中にて大気圧または大気圧前後あるいは大気圧より高い圧力で実施可能なものである。式54の開始化合物の R^5 がClなどのハロゲンである場合、反応で生成されるハロゲン化水素をスパーキングまたは他の好適な手段で除去できるような方法で反応を行うと好ましい。この反応は約0から100℃の間で行うことが可能なものであり、最も都合がよいのは周囲温度 (約10から40℃) 前後、一層好ましくは約20から30℃である。ルイス酸触媒 (R^5 がBrである式54の調製では三臭化アルミニウム) を添加することで、反応を容易にできる場合がある。抽出、蒸留、結晶化をはじめとする当業者間で周知の通常の方法で、式54の生成物を単離する。

20

【0126】

R^5 がClまたはBrである式54の開始化合物は、すでに述べたようにして式55の対応する化合物から調製可能なものである。 R^5 がスルホン酸基である式54の開始化合物も、ジクロロメタンなどの好適な溶媒中にて塩化スルホンル (p-トルエンスルホンルクロリドなど) および第3級アミン (トリエチルアミンなど) などの塩基で処理を行うなどの標準的な方法で、同様に式54の対応する化合物から調製可能である。

30

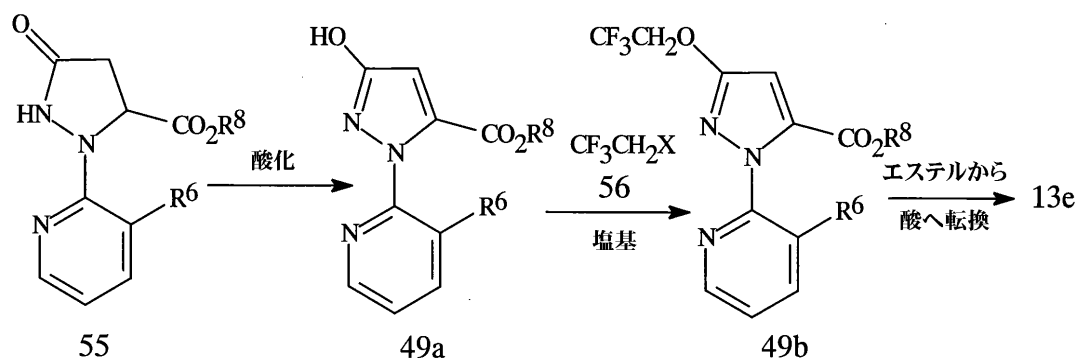
【0127】

スキーム33に概要を示す方法で、 R^5 が $OC_2H_4CF_3$ である式13eのピラゾールカルボン酸を調製することが可能である。

【0128】**【化42】**

40

スキーム 33



10

【0129】

式中、 R^8 は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、 X は脱離基である。

【0130】

この方法では、スキーム 32 で示したようなハロゲン化を行う代わりに、式 55 の化合物を酸化して式 49a の化合物を得る。この酸化の反応条件は、スキーム 31 で式 54 の化合物を式 49 の化合物に転換する場合についてすでに述べたとおりである。

20

【0131】

次に、塩基の存在下にてアルキル化剤 CF_3CH_2X (56) と接触させることで、式 49a の化合物をアルキル化して式 49b の化合物を生成する。アルキル化剤 56 において、 X はハロゲン (Br 、 I など)、 $OS(O)_2CH_3$ (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) などの求核反応脱離基であり、メタンスルホネートでもうまくいく。この反応を少なくとも 1 当量の塩基の存在下で実施する。好適な塩基には、アルカリ金属 (リチウム、ナトリウムまたはカリウムなど) 炭酸塩および水酸化物などの無機塩基ならびに、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ある。この反応については溶媒中で行うのが普通であり、当該溶媒には、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、アセトニトリルなどの極性非プロトン性溶媒、アセトニトリル、 N 、 N -ジメチルホルムアミドなどが可能である。無機塩基と併用するのであればアルコールおよび極性非プロトン性溶媒が好ましい。塩基には炭酸カリウム、溶媒にはアセトニトリルが好ましい。この反応は約 0 から 150℃で行うのが普通であり、最も一般的には周囲温度から 100℃で行う。式 49b の生成物については、抽出などの従来の手法で単離することが可能である。続いて、スキーム 29 で式 49 を式 13e に転換する場合についてすでに述べたような方法で式 49b のエステルを式 13e のカルボン酸に転換することができる。

30

40

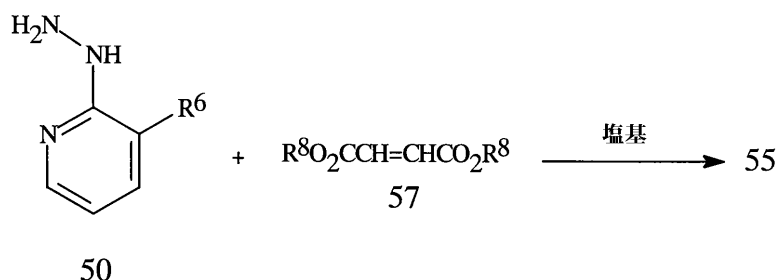
【0132】

式 55 の化合物を、スキーム 34 に概要を示す方法で式 50 の化合物から調製可能である。

【0133】

【化 43】

スキーム 34



10

【0134】

式中、 R^8 は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルである。

【0135】

この方法では、塩基および溶媒の存在下で式50のヒドラジン化合物を式57の化合物（フマル酸エステルまたはマレイン酸エステルあるいはその混合物を使用できる）と接触させる。この塩基は一般に、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tert-ブトキシド、リチウムtert-ブトキシドなどの金属アルコキシド塩である。この塩基を式50の化合物に対して0.5当量を超える量で使用するものとし、好ましくは0.9から1.3当量の間で使用する。また、式57の化合物を1.0当量を超える量で使用するものとし、好ましくは1.0から1.3当量の間で使用する。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など、極性プロトン性有機溶媒と極性非プロトン性有機溶媒とを使用することが可能である。好ましい溶媒は、メタノールやエタノールなどのアルコールである。アルコールがフマル酸エステルまたはマレイン酸エステルとアルコキシド塩基とを構成しているものと同一であると特に好ましい。この反応は一般に、式18の化合物と塩基とを溶媒中で混合して行われる。混合物を所望の温度まで加熱または冷却し、式57の化合物を一定の時間をかけて加えるようにしてもよい。一般に、反応温度は0℃から使用する溶媒の沸点までの間である。この反応は、溶媒の沸点を高める目的で大気圧よりも高い圧力下で実施してもよいものである。通常、約30から90℃の間の温度が好ましい。添加時間については、熱の移動が可能な程度に短くすることが可能である。一般的な添加時間は1分間から2時間の間である。最適な反応温度および添加時間は、式50および式57の化合物の性質によって変わってくる。添加後、反応混合物を反応温度で一定時間保持するようにしてもよい。反応温度次第に必要な保持時間が0から2時間まで変わることがある。一般的な保持時間は10から60分間である。次に、酢酸などの有機酸、あるいは塩酸、硫酸などの無機酸を添加し、反応マスを酸性化してもよい。反応条件と単離の手段によっては、式55の化合物の $-\text{CO}_2\text{R}^8$ 官能基が加水分解されて $-\text{CO}_2\text{H}$ に変わることがある。たとえば、反応混合物中に水が存在すると、このような加水分解が促進される可能性がある。カルボン酸（ $-\text{CO}_2\text{H}$ ）が形成された場合は、従来技術において周知のエステル化方法を利用してこれを転換し、 R^8 が $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルである $-\text{CO}_2\text{R}^8$ に戻すことが可能である。所望の生成物である式55の化合物については、結晶化、抽出または蒸留などの当業者間で周知の方法で単離することができる。

20

30

40

【0136】

式Iの化合物の調製で上述した試薬および反応条件の中には、中間体中に含まれる特定の官能基と両立できないものがあることが知られている。このような場合は、保護／脱保護配列または官能基相互転換（interconversion）を合成に導入することで、所望の生成物を得る上での助けになるであろう。保護基の使い方とその選択肢に関しては化学合成分野の当業者であれば明らかであろう（たとえば、グリーン（Greene）

50

, T. W. 、ウーツ (W u t s) , P. G. M. 、P r o t e c t i v e G r o u p s i n O r g a n i c S y n t h e s i s、第2版、ワイリー (W i l e y) 、ニューヨーク、1991を参照のこと)。場合によっては、個々のスキームに示すように特定の試薬を導入後、ここでは詳細に述べていない常套の合成ステップを実施しなければ式Iの化合物の合成を終了できないことがある点は、当業者であれば分かるであろう。また、上記のスキームにて説明した複数のステップを、式Iの化合物を調製する目的で提示した特定のシーケンスに含まれる以外の順序で組み合わせて実施しなければならない場合がある点も当業者であれば分かるであろう。

【0137】

また、本願明細書に記載の式Iの化合物および中間体に対して、親電子反応、求核反応、ラジカル反応、有機金属反応、酸化反応、還元反応などのさまざまな処理をほどこし、置換基を加えたり既存の置換基を修飾したりできることも、当業者であれば分かるであろう。

【0138】

さらに推敲しなくとも、当業者が上記の説明を利用すれば、本発明を最大限に活用することができると思われる。したがって、以下の実施例は単なる一例にすぎないものとみなし、方法の如何を問わず本願の開示内容を限定することはないものとする。クロマトグラフィでの溶媒混合物の場合または別途記載の場合を除き、パーセンテージは重量比である。クロマトグラフィでの溶媒混合物の部およびパーセンテージは、特に明記しない限り容量比である。¹H NMRスペクトルを、テトラメチルシランを基準にした低磁場のppm値で示す。sは一重線であり、dは二重線であり、tは三重線であり、qは四重線であり、mは多重線であり、ddは二重線の二重線であり、dtは三重線の二重線であり、brsは広い一重線である。

【実施例】

【0139】

実施例1

1-(2-クロロフェニル)-N-[3-メチル-2-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]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

ステップA: 1-(2-クロロフェニル)-5-(2-フラニル)-3-(トリフルオル(trifluor)メチル)-1H-ピラゾールの調製

4, 4, 4-トリフルオロ-1-(2-フリル)-1, 3-ブタンジオン(30.0g、146mmol)を氷酢酸(65mL)に入れた溶液に、酢酸ナトリウム(12.1g、148mmol)を加えた。この混合物を約25℃まで冷却し、2-クロロフェニルヒドラジン塩酸塩(25.6g、145mmol)を少量ずつ加え、穏やかな発熱後、この混合物を4時間かけて60℃まで加熱し、続いて25℃まで冷却した。この混合物をジクロロメタン(400mL)で希釈し、水(3×250mL)、炭酸ナトリウム飽和水溶液(2×250mL)、ブラインで有機相を洗浄した後、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下にて蒸発させたところ、表題化合物43.2gが茶色の油分として得られた。

¹H NMR(CDC1₃) δ 7.6(m, 5H)、6.9(1H)、5.7(d, 1H)。

【0140】

ステップB: 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-カルボン酸の調製

アセトニトリル(415mL)中にステップAの表題化合物(43.2g、138mmol)を含有する懸濁液に、約0.25時間かけてリン酸二水素ナトリウム一水和物(92.4g、669mmol)を加えた。室温にて0.5時間攪拌後、この混合物を約5℃まで冷却し、反応温度を10℃未満に維持したまま、水430mL中に亜塩素酸ナトリウム(181.7g、2.0mmol)を含む溶液を1時間かけて滴下して加えた。[注: 放出される黄色のオフガスを浄化する目的で水酸化ナトリウムスクラバを取り付けた。] 添

加終了後、この懸濁液を5℃で約1時間攪拌し、25℃で一晩攪拌した上で、濃塩酸(150 mL)を滴下により添加してpH1まで酸性化し、続いて酢酸エチルで抽出(1×500 mL、さらに2×250 mL)した。混合酢酸エチル抽出物をメタ亜硫酸ナトリウムの水溶液(水1.05 L中に228.5 g)に反応温度20℃未満で滴下して加えた。この懸濁液を配分し、水性層を酢酸エチルで抽出(2×100 mL)した。有機層を混合し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下にて蒸発させた。ヘキサン：ジエチルエーテル(99：1、100 mL)で残渣を粉末化したところ、表題化合物32.9 gが固体で得られた。

^1H NMR (DMSO- d_6) δ 13.9 (bs, 1H)、7.7 (m, 5H)。

【0141】

10

ステップC： 1-(2-クロロフェニル)-N-(3-メチル-2-ニトロフェニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの調製

ステップBの表題化合物(1.2 g、3.4 mmol)をジクロロメタン(15 mL)に入れた混合物に、塩化オキサリル(0.5 g、3.7 mmol)を加えた後、N,N-ジメチルホルムアミド約2滴を加えた。最初の発熱後、懸濁液を N_2 下にて0.4時間室温にて攪拌し、続いて減圧下にて蒸発させ、油状残渣を得た。この残渣をテトラヒドロフラン(20 mL)に溶解させ、2-メチル-6-ニトロアニリン(0.5 g、152.2 mmol)を加えた後、N,N-ジイソプロピルエチルアミン(0.7 g、129.5 mmol)を加え、この懸濁液を N_2 下にて一晩室温にて攪拌した。粗混合物を減圧下にて蒸発させ、溶離液としてヘキサン：酢酸エチル(2：1)を用いてシリカゲルでのフラッシュ 20
シカラムクロマトグラフィ処理をほどこして残渣を精製したところ、表題化合物200 mgが固体として得られた。m. p. 215~220℃。

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.3 (s, 3H)、6.3~6.6 (s, 1H)、7.4~7.6 (m, 7H)、8.0 (d, 1H)。

【0142】

ステップD： N-(2-アミノ-3-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-カルボキサミドの調製

ステップCの表題化合物(1.0 g、2.3 mmol)を酢酸エチル(50 mL)に溶解させ、パール(Parr)振盪機(45 psi)で3時間、炭素(200 mg、1.8 mmol)上で10%パラジウムにて水素化した。セライト(Celite)^(R) 珪藻土 30
濾過助剤で反応混合物を濾過し、濾液を減圧下にて蒸発させた後、油状残渣をヘキサン中でスラリー化して濾過したところ、表題化合物1.0 gがオフホワイトの固体として得られた。m. p. 165~167℃。

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.2 (s, 3H)、3.6 (m, 2H)、6.7 (m, 1H)、6.9 (m, 1H)、7.1 (m, 1H)、7.2 (m, 1H)、7.4 (m, 2H)、7.5 (m, 2H)、8.1 (bs, 1H)。

【0143】

ステップE： 1-(2-クロロフェニル)-N-[3-メチル-2-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの調製 40

テトラヒドロフラン(20 mL)中にステップDの表題化合物(0.6 g、1.5 mmol)を含有する懸濁液に、塩化イソブトリル(isobutryl)(0.25 g、2.3 mmol)を加えた後、I-ジイソプロピルエチルアミン(0.5 g、3.9 mmol)を加えた。この懸濁液を25℃で一晩攪拌した後、1N HCl(100 mL)および酢酸エチル(100 mL)で希釈した。有機層を分離し、1N HCl、水、重炭酸ナトリウム飽和水溶液、ブラインで洗浄(各々約50 mL洗浄)し、続いて硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下にて蒸発させたところ、本発明の化合物である表題化合物0.6 gが固体で得られた。m. p. 240~242℃。 ^1H NMR (CDCl₃) δ 1.3 (d, 6H)、2.5 (s, 3H)、2.6 (m, 1H)、7.0~7.6 (m, 9H)、9.5 (s, 1H)。

50

【0144】

実施例 2

2-メチル-6-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]-N-[2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド

ステップA: 2-メチル-N-[2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-6-ニトロベンズアミドの調製

2-メチル-6-ニトロ安息香酸(9.0 g、49.7 mmol)と塩化チオニル(62 mL)との混合物をトルエン(100 mL)中にて2.5時間還流加熱した後、25℃まで冷却した。この懸濁液を減圧下にて蒸発させ、続いてトルエンで共沸化(azeotrope)した。2-アミノ-5-トリフルオロメチルトルエン(2.89 g、16.5 mmol)とトリエチルアミン(2.02 g、20 mmol)とをテトラヒドロフルン(tetrahydrofuran)(20 mL)中に入れた溶液に、テトラヒドロフラン(10 mL)に溶解した残渣滴下して加えた。この懸濁液を72時間25℃で攪拌した後、水の中に注ぎ、酢酸エチルで抽出(2×20 mL)した。この混合有機抽出物をシリカゲル上で蒸発させ、シリカゲル(溶離液として100%ヘキサンから1:1ヘキサン:酢酸エチルまでの勾配)で中圧液体クロマトグラフィ処理をほどこして精製したところ、表題化合物1.22 gが得られた。

¹H NMR(CDCl₃) δ 2.4(s, 3H)、2.6(s, 3H)、7.5~7.7(m, 5H)、8.1(m, 1H)、8.2(m, 1H)。

【0145】

ステップB: 2-アミノ-6-N-[2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミドの調製

ステップAの表題化合物(2.73 g、7.7 mmol)をエタノール(25 mL)に溶解させ、パール(Parr)振盪機(350 kPa)を用いて16時間、炭素(0.2 g)上でパラジウムにて水素化した。反応懸濁液をセライト(Celite)^(R)で濾過した後、白色のパッドをジエチルエーテルで洗浄した。混合有機層を減圧下にて蒸発させたところ、表題化合物2.4 gが半固体として得られた。

¹H NMR(CDCl₃) δ 2.4(m, 6H)、6.8(m, 3H)、7.1(m, 1H)、7.4~7.7(m, 4H)、8.3(m, 1H)。

【0146】

ステップC: 2-メチル-6-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]-N-[2-メチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミドの調製

クロロホルム(5 mL)中にステップBの表題化合物(0.15 g、0.5 mmol)とN,N-ジイソプロピルエチルアミン(0.13 g、1.0 mmol)とを含有する溶液に、塩化イソブチリル(51.8 mg、0.5 mmol)を加えた。この懸濁液を25℃にて一晩攪拌した後、1N HClで希釈した。約1時間の攪拌後、懸濁液を0.45ミクロンのPTFE膜で濾過し、濾液を減圧下にて蒸発させたところ、本発明の化合物である表題化合物0.08 gが固体で得られた。m.p. > 230℃。

¹H NMR(DMSO-d₆) δ 1.0(d, 6H)、2.5(s, 3H)、2.4(s, 3H)、2.6(m, 1H)、7.1(m, 1H)、7.3(m, 1H)、7.6(m, 2H)、7.9(m, 2H)、9.3(bs, 1H)、9.9(s, 1H)。

【0147】

実施例 3

2-メチル-6-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]-N-[2-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]ベンズアミド

ステップA: 2-メチル-N-[2-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-6-ニトロベンズアミドの調製

実施例2(ステップA)の手順により、2-メチル-4-トリフルオロメトキシアニリン(3.15 g、16.5 mmol)を、テトラヒドロフラン(30 mL)に2-メチル-6-ニトロベンゾイルクロリド(3.3 g、16.5 mmol)およびトリエチルアミ

ン (2.02 g、20 mmol) を加えたものと反応させた。反応終了後、この反応懸濁液を過剰な水の中に注ぎ、酢酸エチルで数回抽出した。この混合抽出物を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下にて蒸発させたところ、固体が得られた。この固体をヘキサン：ジエチルエーテル溶液で粉末化してさらに精製し、表題化合物 2.73 g を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.3 (s, 3H)、2.6 (s, 3H)、7.1 (m, 3H)、7.5 (m, 1H)、7.6 (m, 1H)、7.9 (m, 1H)、8.1 (m, 1H)。

【0148】

ステップ B： 2-アミノ-6-N-[2-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)-フェニル]ベンズアミドの調製

10

実施例 2 (ステップ B) の手順により、実施例 3 (ステップ A) の表題化合物 (2.73 g、7.7 mmol) を水素化し、表題化合物 2.4 g を半固体として得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 2.3 (s, 3H)、2.5 (s, 3H)、6.6 (m, 2H)、7.1 (m, 6H)、7.4 (bs, 1H)、8.0 (m, 1H)。

【0149】

ステップ C： 2-メチル-6-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ(amino)-N-[2-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]ベンズアミドの調製
ステップ B の表題化合物 (0.2 g、0.6 mmol) と N,N-ジイソプロピルエチルアミン (0.16 g、1.2 mmol) とをジクロロメタン (5 mL) 中に含む溶液に、塩化イソブチリル (0.16 g、1.2 mmol) を加えた。この反応物を 25℃で一晩攪拌した後、懸濁液を水の中に注ぎ、酢酸エチルで数回抽出した。この混合抽出物を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下にて蒸発させたところ、本発明の化合物である表題化合物 0.13 g が固体で得られた。m.p. > 230℃。

20

^1H NMR (DMSO-d₆) δ 1.0 (d, 6H)、2.3 (s, 3H)、2.4 (s, 3H)、2.6 (m, 1H)、7.1 (m, 1H)、7.2~7.4 (m, 4H)、7.7 (m, 1H)、9.3 (s, 1H)、9.8 (s, 1H)。

【0150】

実施例 4

3-クロロ-2-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]-N-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]ベンズアミド

30

ステップ A： 3-クロロ-2-ニトロ-N-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]ベンズアミドの調製

3-クロロ-2-ニトロ安息香酸 (2.0 g、9.7 mmol) をジクロロメタン (30 mL) に入れた混合物に、五塩化リン (2.14 g、10.2 mmol) を少量ずつ加えた。添加を終えて気体の発生も停止した後、この溶液を室温にて 0.5 時間攪拌した後、減圧下にて蒸発させた。残留したオキシ塩化リンを、トルエンを用いて減圧下にてさらに除去し、対応する塩化ベンゾイル 2.1 g を固体で得た。塩化ベンゾイル (1.0 g、4.4 mmol) をジクロロメタン (10 mL) に入れた溶液を、ジクロロメタン (3 mL) 中に 4-トリフルオロメトキシアニリン (0.79 g、4.4 mmol) とトリエチルアミン (0.45 g、4.4 mmol) とを含有する溶液に滴下して加えた。この懸濁液を室温にて 0.5 時間攪拌した後、過剰な水の中に注ぎ、酢酸エチルで数回抽出した。この混合有機抽出物を水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下にて蒸発させ、固体を得た。この固体をヘキサン：ジエチルエーテル (1：1) で洗浄したところ、表題化合物 1.38 g が固体で得られた。m.p. 171~172℃。

40

^1H NMR (CDCl₃) δ 7.2 (m, 3H)、7.5~7.7 (m, 4H)、7.8 (bs, 1H)。

【0151】

ステップ B： 2-アミノ-3-クロロ-N-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]ベンズアミドの調製

水素化ホウ素ナトリウム (26 mg、0.68 mmol) をエタノール (1 mL) に入れ

50

た溶液に、銅（I I）アセチルアセトネート（20.0 mg、0.08 mmol）を2-プロパノール（1 mL）に入れた懸濁液に加え、続いて2-プロパノール（3 mL）中にステップAの表題化合物（0.25 g、0.6 mmol）を含有する懸濁液、さらには水素化ホウ素ナトリウム（2.0 mg、78 mmol）をエタノール（2 mL）に入れた溶液を加えた。この反応混合物を25℃で7時間攪拌し、続いて希釈塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで数回抽出した。この混合有機抽出物を塩化マグネシウム上で乾燥させ、減圧下にて蒸発させたところ、表題化合物0.18 gが得られた。

¹H NMR (CDCl₃) δ 7.3 (m, 5H)、7.4 (m, 2H)、7.6 (m, 2H)、7.8 (bs, 1H)。

【0152】

10

ステップC： 3-クロロ-2-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]-N-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]ベンズアミドの調製

ステップBの表題化合物（0.18 g、0.5 mmol）とトリエチルアミン（54.0 mg、0.5 mmol）とをジクロロメタン（3 mL）に入れた混合物に、塩化イソブチリル（57 mg、0.5 mmol）を加えた。1.5時間攪拌後、塩化イソブチリルをさらに5滴とトリエチルアミン5滴とを加えた。この懸濁液を2時間攪拌した後、水の中に注ぎ、酢酸エチルで数回抽出した。この混合抽出物を水で洗浄した後、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下にて蒸発させた。溶離液としてヘキサン：酢酸エチル（2：1）を用いてシリカゲルでのフラッシュカラムクロマトグラフィ処理をほどこし、残渣をさらに精製したところ、本発明の化合物である表題化合物40.0 mgが固体で得られた。m.p. 230～233℃。

20

¹H NMR (DMSO-D₆) δ 1.0 (d, 6H)、2.6 (m, 1H)、7.3～7.4 (m, 3H)、7.5 (m, 1H)、7.7 (m, 1H)、7.8 (m, 2H)、9.6 (s, 1H)、10.4 (s, 1H)。

【0153】

実施例5

1-(3-クロロ-ピリジニル)-N-[2-メチル-6-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]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

ステップA： 1-(3-クロロ-ピリジニル)-N-(2-メチル-6-ニトロフェニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの調製 30

0℃にてジクロロメタン（30 mL）中で攪拌した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（2.875 g、9.86 mmol）の懸濁液に、塩化オキサリル（5.16 mL、59.2 mmol）を滴下して加えた後、N,N-ジメチルホルムアミド（1滴）を加えた。この攪拌溶液を還流加熱し、この温度で1時間攪拌した後、減圧下にて溶液を乾燥するまで濃縮した。続いて残渣をテトラヒドロフラン（30 mL）に溶解させ、この攪拌溶液に2-メチル-6-ニトロアニリンを加えた。次に、この溶液を0℃まで冷却し、N,N-ジイソプロピルエチルアミン（8.60 mL、49.3 mmol）を滴下して加えた。攪拌溶液を還流加熱し、この温度で42時間攪拌した後、減圧下にて乾燥するまで濃縮した。さらに、残渣を酢酸エチル（30 mL）に溶解させ、1N HCl（10 mL）、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液（10 mL）、ブライン（10 mL）で上記の溶液を洗浄し、乾燥させ（MgSO₄）、減圧下にて濃縮したところ、黄色の固体が残った。この生成物を攪拌しながらアセトニトリル（6 mL）に溶解させ、アンモニア水（6 mL）を加え、溶液を周囲温度にて2時間攪拌した後、減圧下にて乾燥するまで濃縮した。この生成物をシリカゲル（3：1ヘプタン-酢酸エチル溶離液）でのフラッシュカラムクロマトグラフィで精製したところ、表題化合物が黄色の固体で得られた（1.53 g）。

40

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.21 (s, 3H)、7.18 (s, 1H)、7.27 (t, 1H)、7.38 (m, 1H)、7.47 (d, 1H)、7.84 (d, 1H)、7.85 (d, 1H)、8.42 (dd, 1H)、9.16 (s, 1H)。

50

【0154】

ステップB: N-(2-アミン-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-カルボキサミドの調製
 エタノール(5 mL)に炭素(69 mg)上の10% Pdを加えた攪拌懸濁液の入ったフラスコを脱気/窒素充填(×3)した。この懸濁液に、1-(3-クロロ-ピリジニル)-N-(2-メチル-6-ニトロフェニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(すなわち、ステップAの生成物)(1.38 g、3.25 mmol)をエタノール(9 mL)に入れた溶液を加えた。次に、フラスコを脱気/窒素充填(×3)し、続いて脱気/水素充填(×3)した。反応混合物を周囲温度にて18時間攪拌した後、セライト(Celite)^(R)で濾過し、フィルタ床をエタノールで洗浄(2×3 mL)した。濾液を減圧下にて濃縮したところ、表題化合物がオフホワイトの固体として得られた(1.306 g)。

【0155】

ステップC: 1-(3-クロロ-ピリジニル)-N-[2-メチル-6-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの調製
 塩化イソブチリル(0.053 mL、0.505 mmol)をテトラヒドロフランに入れた攪拌溶液に、N-(2-アミン-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(すなわち、ステップBの生成物)(0.20 g、0.505 mmol)を加えた。この溶液を0℃まで冷却し、ジイソプロピルエチルアミン(0.60 mL、3.59 mmol)を滴下して加えた。続いて、この攪拌溶液を18時間かけて周囲温度まで自然に温めた後、減圧下にて乾燥するまで濃縮した。残渣を酢酸エチル(10 mL)に溶解させ、1N HCl(10 mL)、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液(10 mL)、ブライン(10 mL)で上記の溶液を洗浄し、乾燥させ(MgSO₄)、減圧下にて濃縮したところ、黄色の固体が残った。この生成物を高温のtert-ブチルメチルエーテル(5 mL)中でのスラリー化によって精製したところ、本発明の化合物である表題化合物が215~217℃で溶解する固体(216 mg)で得られた。

¹H NMR(CDCl₃) δ 1.11(s, 3H)、1.13(s, 3H)、2.20(s, 3H)、2.44(m, 1H)、6.89(dd, 1H)、7.05(s, 1H)、7.07(d, 1H)、7.15(s, 1H)、7.35(m, 1H)、7.48(s, 1H)、7.81(dd, 1H)、8.41(dd, 1H)、9.06(s, 1H)。

【0156】

実施例6

1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[3-メチル-2-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]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
 ステップA: 2-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロフェニル)-プロパナミド(propanamide)の調製
 0℃にてジクロロメタン(22.5 mL)中で攪拌した2-メチル-6-ニトロアニリン(2.5 g、16.4 mmol)の溶液に、ピリジン(2.5 mL)を加え、さらに塩化イソブチリル(1.72 mL、16.4 mmol)を滴下した。この溶液を2時間かけて周囲温度まで自然に温めた。周囲温度でさらに48時間攪拌した後、ジクロロメタン(10 mL)を加え、さらに炭酸水素ナトリウム飽和水溶液(30 mL)を加えた。水性相を分離し、ジクロロメタン(20 mL)で抽出した。次に、有機抽出物同士を混合し、乾燥させ(MgSO₄)、減圧下にて濃縮したところ、表題化合物が黄色の固体(3.54 g)で得られた。

【0157】

ステップB: N-(2-アミノ-6-メチルフェニル)-2-メチルプロパナミドの調製

エタノール（5 mL）に炭素（25 mg）上の10% Pdを加えた攪拌懸濁液の入ったフラスコを脱気／窒素充填（×3）した。この懸濁液に、2-メチルーN-（2-メチルー6-ニトロフェニル）-プロパナミド（すなわち、ステップAの生成物）（2.54 g、11.4 mmol）をエタノール（45 mL）に入れた溶液を加えた。次に、フラスコを脱気／窒素充填（×3）し、続いて脱気／水素充填（×3）した。反応混合物を周囲温度にて35分間攪拌した後、セライト（Celite）^(R)で濾過し、フィルタ床をエタノールで洗浄（2×5 mL）した。濾液を減圧下にて濃縮したところ、表題化合物がオフホワイトの固体として得られた（2.19 g）。

【0158】

ステップC： 1-（3-クロロピリジニル）-N-〔3-メチルー2-〔（2-メチルー1-オキソプロピル）アミノ〕フェニル〕-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの調製 10

0℃にてジクロロメタン（4 mL）中で攪拌した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（0.1 g、0.42 mmol）の懸濁液に、塩化オキサリル（0.31 g、2.44 mmol）を滴下し、さらにN，N-ジメチルホルムアミド（1滴）を加えた。この攪拌溶液を還流加熱し、この温度で1時間攪拌した後、減圧下にて溶液を乾燥するまで濃縮した。続いて残渣をテトラヒドロフラン（10 mL）に溶解させ、攪拌溶液をN-（2-アミノ-6-メチルフェニル）-2-メチルプロパナミド（すなわち、ステップBの生成物）に加えた。この溶液を0℃まで冷却し、N，N-ジイソプロピルエチルアミン（0.52 mL、2.99 mmol）を滴下して加えた。さらに、この溶液を18時間かけて周囲温度まで自然に温めた後、減圧下にて乾燥するまで濃縮した。残渣を酢酸エチル（10 mL）に溶解させ、1N HCl（10 mL）、炭酸水素ナトリウム飽和水溶液（10 mL）、ブライン（10 mL）で上記の溶液を洗浄し、乾燥させ（MgSO₄）、減圧下にて濃縮したところ、黄色の固体が残った。この生成物をシリカゲル（1：1ヘプタン-酢酸エチル溶離液）でのフラッシュカラムクロマトグラフィで精製し、続いて酢酸エチルから再結晶化したところ、本発明の化合物である表題化合物が219～220℃で溶融する固体（70 mg）で得られた。

¹H NMR（CDCl₃）δ 1.27（s，3H）、1.29（s，3H）、2.29（s，3H）、2.66（m，1H）、7.02（s，1H）、7.08（s，1H）、7.10（d，1H）、7.25（s，1H）、7.33（d，1H）、7.39（m，1H）、7.84（dd，1H）、8.44（dd，1H）、9.50（s，1H）。 30

【0159】

実施例7

N-〔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-イル〕-2-メチルー6-〔（2-メチルー1-オキソプロピル）アミノ〕ベンズアミド

ステップA： 4，4，4-トリフルオロ-3-オキソブタンニトリル（あるいは4，4，4-トリフルオロアセトアセトニトリルとも呼ばれる）の調製

窒素気泡発生装置と2枚の隔壁とを取り付けた500 mL容の三首フラスコに、リチウムジイソプロピルアミド（LDA）（18.4 mL、0.172 mol、ヘプタン中に2 M）を入れ、反応混合物を-72℃まで冷却した。トリフルオロ酢酸メチル（10.0 g、0.078 mol）、アセトニトリル（6.41 g、0.156 mol）およびTHF（100 mL）の0℃の溶液を、添加用漏斗を用いて窒素下にて滴下して加えた。45分後、この溶液を1から2時間かけて室温まで自然に温め、冷水（250 mL）で急冷し、有機溶媒を蒸発させた。続いて水性層をジエチルエーテルで洗浄（3×250 mL）し、濃HClを用いてpH 2まで酸性化し、メチレンクロリドで洗浄（3×250 mL）した。続いて、水性層をジエチルエーテルで抽出（3×250 mL）した。このジエチルエーテル抽出物を硫酸ナトリウムで乾燥させて濃縮し、表題化合物を透明なオレンジ色の油（1.38 g、0.010 mol、収率32%）として得た。 40

^1H NMR (CD_3OD , 300MHz) δ 2.96 (2H, s)。

【0160】

ステップB: 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-アミンの調製

パーソナル・ケミストリー (Personal Chemistry) (米国マサチューセッツ州ボストンのパーソナル・ケミストリー・インコーポレイテッド (Personal Chemistry Inc.)) の10mL容の反応容器に、2-クロロフェニルヒドラジン (0.392g、2.19mmol) と、エタノール (2.5mL) と、氷酢酸5滴とを加えた。4, 4, 4-トリフルオロ-3-オキソブタンニトリル (すなわち、ステップAの生成物) (0.300g、2.19mmol) をエタノール (1mL) に入れた溶液を加えた後、チューブを密封し、マイクロ波にて150℃で30分間加熱した。得られた粗混合物を濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィ (酢酸エチル/ヘキサン、1:4) で精製し、表題化合物を黄色の固体 (0.179g、0.684mmol、収率31%) として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , 300MHz) δ 3.82 (2H, br)、5.85 (1H, s)、7.45~7.60 (4H, m)。

【0161】

ステップC: 5-メチル-2-(1-メチルエチル)-4H-3, 1-ベンゾキサジン-4-オンの調製

500mL容の丸底フラスコに、2-アミノ-6-メチル安息香酸 (5.00g、0.033mol) とTHF (200mL) とを入れた。塩化イソブチリル (7.049g、0.066mol) とトリエチルアミン (10.04g、0.099mol) とを加え、反応混合物を室温にて一晩攪拌した。溶媒を除去した後、化合物をシリカゲルクロマトグラフィ (酢酸エチル/ヘキサン、1:9) で精製し、表題化合物を白色固体 (4.85g、0.024mol、収率72%) として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , 300MHz) δ 1.35 (6H, d)、2.78 (3H, s)、2.90 (1H, septet)、7.21 (1H, d)、7.40 (1H, d)、7.64 (1H, t)。

【0162】

ステップD: N-[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-イル]-2-メチル-6-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]ベンズアミドの調製

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-アミン (すなわち、ステップBの生成物) (0.200g、0.76mmol) とDMF (5mL) とを仕込んだ10mL容のフラスコに、窒素下にて水素化ナトリウム (0.2g、7.9mmol、純度95%) を入れた。室温にて5分間攪拌後、5-メチル-2-(1-メチルエチル)-4H-3, 1-ベンゾキサジン-4-オン (すなわち、ステップCの生成物) (0.155g、0.76mmol) を加えた。反応をTLC (薄層クロマトグラフィ) で監視し、水10滴で急冷し、シリカゲルプレパラティブTLC (1:4 酢酸エチル/ヘキサン) で直接に精製したところ、本発明の化合物である表題化合物が白色固体 (0.135g、0.29mmol、収率38%) で得られた。

^1H NMR (CDCl_3 , 300MHz) δ 1.08 (6H, d)、2.14 (3H, s)、2.38 (1H, m)、6.91 (1H, d)、7.07 (1H, s)、7.02 (1H, t)、7.41~7.59 (5H, m)、8.28 (1H, br)、8.36 (1H, br)。

【0163】

以下の実施例8は、たとえば実施例5に示すような別のステップによって、1-(3-クロロ-ピリジニル)-N-[2-メチル-6-[(2-メチル-1-オキソプロピル)アミノ]フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドの調製に用いることができる、1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(トリフル

10

20

30

40

50

オロメチル) - 1H-ピラゾール-5-カルボン酸の調製について説明するものである。

【0164】

実施例 8

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-カルボン酸の調製

ステップA: 3-クロロ-2(1H)-ピリジノン(2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチリデン)ヒドラゾンの調製

20~25℃で3-クロロ-2(1H)-ピリジノンヒドラゾン(あるいは(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-ヒドラジンと呼ばれることもある)(10g、69.7mmol)に1, 1, 1-トリフルオロアセトン(7.80g、69.6mmol)を加えた。10
添加の終了後、混合物を約10分間攪拌した。溶媒を減圧下にて除去し、混合物を酢酸エチル(100mL)と飽和炭酸ナトリウム水溶液(100mL)とに配分した。有機層を乾燥させ、蒸発させた。シリカゲルでのクロマトグラフィ(酢酸エチルで溶出)によって、(酢酸エチル/ヘキサンからの結晶化後)m.p. 64~64.5℃のオフホワイトの固体としての生成物(11g、収率66%)が得られた。

IR (nujol) ν 1629、1590、1518、1403、1365、1309、1240、1196、1158、1100、1032、992、800 cm^{-1} 。

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.12 (s, 3H)、6.91~6.86 (m, 1H)、7.64~7.61 (m, 1H)、8.33~8.32 (m, 2H)。

MS m/z 237 (M^+)。

20

【0165】

ステップB: エチル水素エタンジオエート(ethanedioate)(3-クロロ-2-ピリジニル)(2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチリデン)ヒドラジド(あるいはエチル水素エタンジオエート(3-クロロ-2-ピリジニル)(2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチリデン)ヒドラジンと呼ばれることもある)の調製

0℃にてジクロロメタン(68mL)中で3-クロロ-2(1H)-ピリジノン(2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチリデン)ヒドラゾン(すなわち、ステップAの生成物)(32.63g、0.137mol)にトリエチルアミン(20.81g、0.206mol)を加えた。エチルクロロオキソアセテート(chlorooxoacetate)(18.75g、0.137mol)のジクロロメタン(69mL)溶液を上記の混
合物に0℃で滴下して加えた。この混合物を約2時間かけて25℃まで自然に温めた。混
合物を0℃まで冷却し、エチルクロロオキソアセテート(3.75g、27.47mmol)をジクロロメタン(14mL)に入れたものを別途滴下して加えた。さらに約1時間
後、混合物をジクロロメタン(約450mL)で希釈し、混合物を水で洗浄(2×150
mL)した。有機層を乾燥させ、蒸発させた。シリカゲルでのクロマトグラフィ(1:1
酢酸エチル-ヘキサンで溶出)によって、(酢酸エチル/ヘキサンからの結晶化後)m.
p. 73.0~73.5℃の固体としての生成物(42.06g、収率90%)が得られ
た。

IR (nujol) ν 1751、1720、1664、1572、1417、1361、1330、1202、1214、1184、1137、1110、1004、1043、1013、942、807、836 cm^{-1} 。

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$, 115℃) 1.19 (t, 3H)、1.72 (br s, 3H)、4.25 (q, 2H)、7.65 (dd, $J=8.3$ 、4.7 Hz, 1H)、8.20 (dd, $J=7.6$ 、1.5 Hz, 1H)、8.55 (d, $J=3.6$ Hz, 1H)。

MS m/z 337 (M^+)。

40

【0166】

ステップC: エチル1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-4, 5-ジヒドロ-5-ヒドロキシ-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキシレートの調製

50

エチル水素エタンジオエート（３－クロロ－２－ピリジニル）（２，２，２－トリフルオロ－１－メチルエチリデン）ヒドラジド（すなわち、ステップＢの生成物）（５ｇ、１４．８ｍｍｏｌ）のジメチルスルホキシド（２５ｍＬ）溶液をフッ化テトラブチルアンモニウム水和物（１０ｇ）のジメチルスルホキシド（２５ｍＬ）溶液に８時間かけて加えた。添加が終了したら、この混合物を酢酸（３．２５ｇ）の水（２５ｍＬ）溶液に加えた。２５℃で一晩攪拌した後、混合物をトルエンで抽出（４×２５ｍＬ）し、混合トルエン抽出物を水（５０ｍＬ）で洗浄し、乾燥させ、蒸発させて固形分を得た。シリカゲルでのクロマトグラフィ（１：２酢酸エチル／ヘキサンで溶出）によって、*m. p.* ７８～７８．５℃（酢酸エチル／ヘキサンからの再結晶化後）の固体としての生成物（２．９１ｇ、収率５０％、３－クロロ－２（１Ｈ）－ピリジノン（２，２，２－トリフルオロ－１－メチルエチリデン）ヒドラゾン約５％を含有）が得られた。

IR (nujol) ν 3403、1726、1618、1582、1407、1320、1293、1260、1217、1187、1150、1122、1100、1067、1013、873、829 cm^{-1} 。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.19 (s, 3H)、3.20 (ABZパターンの1/2、 $J=18\text{Hz}$ 、1H)、3.42 (ABZパターンの1/2、 $J=18\text{Hz}$ 、1H)、4.24 (q, 2H)、6.94 (dd, $J=7.9$ 、4.9 Hz 、1H)、7.74 (dd, $J=7.7$ 、1.5 Hz 、1H)、8.03 (dd, $J=4.7$ 、1.5 Hz 、1H)。

MS *m/z* 319 (M^+)。

20

【0167】

ステップD： エチル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－カルボキシレートの調製

エチル１－（３－クロロ－２－ピリジニル）－４，５－ジヒドロ－５－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－ピラゾール－５－カルボキシレート（すなわち、ステップCの生成物）（１ｇ、２．９６ｍｍｏｌ）の酢酸（１０ｍＬ）溶液に硫酸（濃縮、２滴）を加え、混合物を約１時間で６５℃まで温めた。この混合物を自然に２５℃まで冷却し、酢酸の大半を減圧下にて除去した。混合物を飽和炭酸ナトリウム水溶液（１００ｍＬ）と酢酸エチル（１００ｍＬ）とに配分した。水性層を酢酸エチル（１００ｍＬ）でさらに抽出した。この混合有機抽出物を乾燥させ、蒸発させて生成物を油分（０．６６ｇ、収率７７％）として得た。

IR (neat) ν 3147、2986、1734、1577、1547、1466、1420、1367、1277、1236、1135、1082、1031、973、842、802 cm^{-1} 。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.23 (t, 3H)、4.25 (q, 2H)、7.21 (s, 1H)、7.48 (dd, $J=8.1$ 、4.7 Hz 、1H)、7.94 (dd, $J=6.6$ 、2 Hz 、1H)、8.53 (dd, $J=4.7$ 、1.5 Hz 、1H)。

MS *m/z* 319 (M^+)。

【0168】

ステップE： 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－カルボン酸の調製

水酸化カリウム（０．５ｇ、８５％、２．２８ｍｍｏｌ）の水（１ｍＬ）溶液をエチル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－カルボキシレート（すなわち、ステップDの生成物）（０．６６ｇ、２．０７ｍｍｏｌ）のエタノール（３ｍＬ）溶液に加えた。約３０分後、溶媒を減圧下にて除去し、混合物を水（４０ｍＬ）に溶解させた。この溶液を酢酸エチル（２０ｍＬ）で洗浄した。水性層を濃塩酸で酸性化し、酢酸エチルで抽出（３×２０ｍＬ）した。この混合抽出物を乾燥させ、蒸発させて生成物を*m. p.* １７８～１７９℃（ヘキサン－酢酸エチルからの結晶化後）の固形分（０．５３ｇ、収率９３％）として得た。

IR (nujol) ν 1711、1586、1565、1550、1440、1425

50

、1292、1247、1219、1170、1135、1087、1059、1031、972、843、816 cm^{-1} 。

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ 7.61 (s, 1H)、7.77 (m, 1H)、8.30 (d, 1H)、8.60 (s, 1H)。

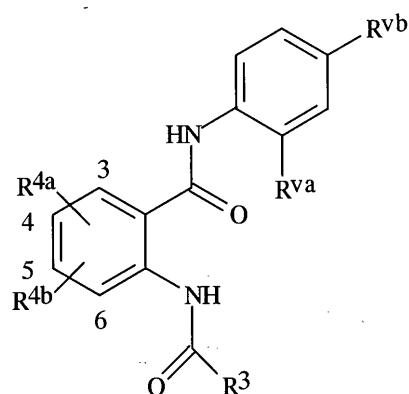
【0169】

本願明細書に記載の手順と従来技術において周知の方法とを併用し、以下の表1から20に示す化合物を調製することができる。これらの表では次のような略号を使用する。tは第3級であり、sは第2級であり、nはノルマルであり、iはイソであり、cはシクロであり、Meはメチルであり、Etはエチルであり、Prはプロピルであり、i-Prはイソプロピルであり、Buはブチルであり、Phはフェニルであり、OMeはメトキシであり、OEtはエトキシであり、SMeはメチルチオであり、SEtはエチルチオであり、CNはシアノであり、 $\text{S}(\text{O})_2\text{Me}$ はメチルスルホニルである。

【0170】

【表1】

表1



R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{va}	R^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF_3
Et	3-Me	5-Me	H	OCF_3
i-Pr	3-Me	H	H	OCF_3
t-Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
i-Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl

【0171】

【表2】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I	
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂	10
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃	20
Et	3-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Me	H	Me	OEt	
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	30
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	40
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	

【 0 1 7 2 】

【 表 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	10
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	20
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	30
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	40
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	

【 0 1 7 3 】

【 表 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	10
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	20
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	30
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	40
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	

【 0 1 7 4 】

【 表 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	10
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	20
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	30
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	40
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	H	CF ₃	
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br	10
Me	3-Cl	H	Et	Br	
Et	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃	20
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	30
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	40
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	10
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	20
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	30
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	

【 0 1 7 7 】

【 表 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	10
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	
Et	6-Cl	H	Me	Cl	20
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	30
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	40
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	10
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	20
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl	
Et	6-F	H	Ph	Br	30
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	40
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

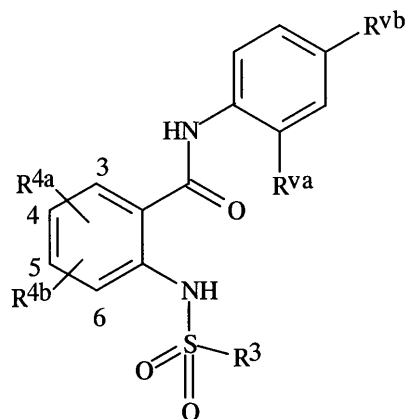
10

【 0 1 8 0 】

20

【 表 1 1 】

表 2



30

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃

40

50

【 0 1 8 1 】

【 表 1 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe	20
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Me	H	Me	OEt	
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	30
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	40
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	

【 0 1 8 2 】

【 表 1 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br

10

20

30

40

50

【 0 1 8 3 】

【 表 1 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	40
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	

【 0 1 8 4 】

【 表 1 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	20
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	40
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	

【 0 1 8 5 】

【 表 1 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{Va}	R ^{Vb}	
Me	3-Cl	H	H	CF ₃	
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br	
Me	3-Cl	H	Et	Br	10
Et	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂	20
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	30
Et	3-Br	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	40
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	

【 0 1 8 6 】

【 表 1 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	10
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	20
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	30
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	40
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	

【 0 1 8 7 】

【表 1 8】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me

10

20

30

40

【 0 1 8 8 】

【表 1 9】

50

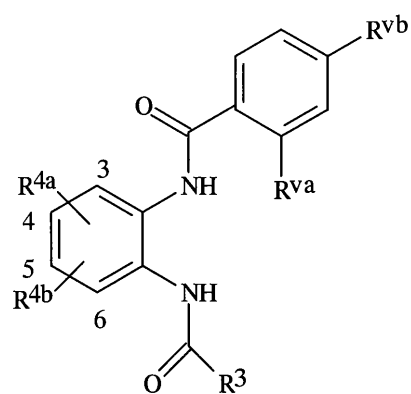
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	10
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	20
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl	
Et	6-F	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	30
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	40
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロバルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

【 0 1 9 0 】

【 表 2 1 】

表 3



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃

【 0 1 9 1 】

【 表 2 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃	10
Et	3-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Me	H	Me	OEt	
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	20
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	30
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	40
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	10
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	20
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	30
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	40
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	10
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	20
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	30
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	40
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	

【 0 1 9 4 】

【 表 2 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	10
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	20
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	30
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	40
Me	3-Cl	H	H	CF ₃	
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br	
Me	3-Cl	H	Et	Br	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	

【 0 1 9 6 】

【 表 2 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	10
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	20
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	30
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	40
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	

【 0 1 9 7 】

【 表 2 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	
Et	6-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	10
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	30
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	40
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	

【 0 1 9 8 】

【 表 2 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	10
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl	
Et	6-F	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃	30
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	40
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	

【 0 1 9 9 】

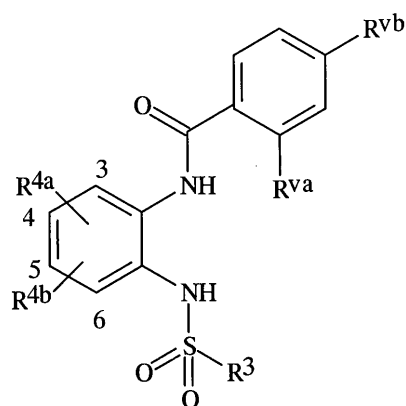
【 表 3 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

【 0 2 0 0 】

【 表 3 1 】

表 4



10

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃

20

30

40

【 0 2 0 1 】

【 表 3 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Me	H	Me	OEt	
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	10
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	20
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	30
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	
Et	3-Me	H	Ph	Br	40
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	

【 0 2 0 2 】

【 表 3 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	20
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	H	CF ₃	30
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	40
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	

【 0 2 0 3 】

【 表 3 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	10
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	20
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	30
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	40
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	

【 0 2 0 4 】

【 表 3 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	H	CF ₃	
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br	
Me	3-Cl	H	Et	Br	40
Et	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	10
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	20
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	30
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	40
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	

【 0 2 0 6 】

【 表 3 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂
プロバルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロバルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br

10

20

30

40

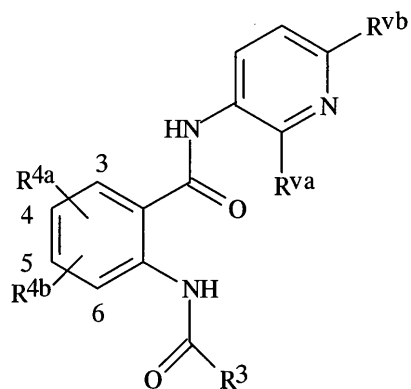
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	30
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	40
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	

【 0 2 0 8 】

【 表 3 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃	10
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl	
Et	6-F	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl	20
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	30
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	40
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	

表 5



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt

【 0 2 1 0 】

【 表 4 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	10
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	20
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	30
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	40
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	

【 0 2 1 1 】

【 表 4 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	10
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	20
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	40
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	

【 0 2 1 2 】

【 表 4 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	30
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	

【 0 2 1 3 】

【 表 4 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	H	CF ₃	
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br	
Me	3-Cl	H	Et	Br	
Et	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃	40
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃	

【 0 2 1 4 】

【 表 4 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	10
Et	3-Br	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	20
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	30
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	40
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	

【 0 2 1 5 】

【 表 4 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	40
Et	6-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	

【 0 2 1 6 】

【 表 4 7 】

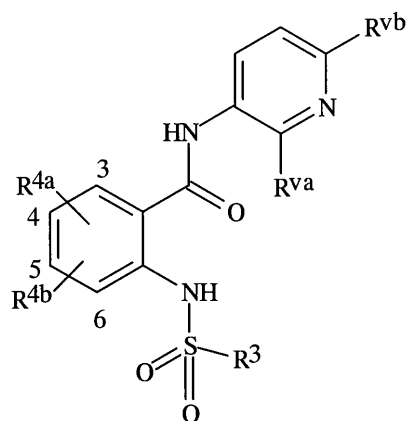
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	10
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	20
Me	6-Cl	H	Me	OEt	
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	30
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	40
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl	
Et	6-F	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl	10
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃	20
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	30
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	40
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	

【 0 2 1 8 】

【 表 4 9 】

表 6



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

【 0 2 1 9 】

【 表 5 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	10
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	20
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	30
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	40
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	

【 0 2 2 0 】

【 表 5 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	10
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	20
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	30
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	

【 0 2 2 1 】

【 表 5 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	10
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	20
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	40
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	

【 0 2 2 2 】

【 表 5 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

10

20

30

40

【 0 2 2 3 】

【 表 5 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	10
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	20
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	

【 0 2 2 4 】

【 表 5 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	20
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	
Et	6-Cl	H	Me	Cl	40
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	

【 0 2 2 5 】

【 表 5 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
t-Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	20
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	30
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	40
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	

【 0 2 2 6 】

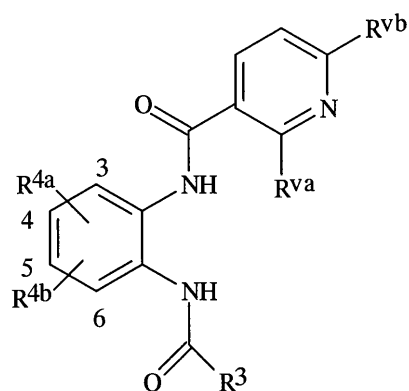
【 表 5 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl	
Et	6-F	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	10
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃	20
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	30
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	40

【 0 2 2 7 】

【 表 5 8 】

表 7



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

【 0 2 2 8 】

【 表 5 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	10
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	20
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	30
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	40
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	10
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	20
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	30
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	

【 0 2 3 0 】

【 表 6 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	10
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	20
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	40
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	

【 0 2 3 1 】

【 表 6 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	20
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	H	CF ₃	
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br	
Me	3-Cl	H	Et	Br	
Et	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	20
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	

【 0 2 3 3 】

【 表 6 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	
Et	6-Cl	H	Me	Cl	40
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	

【 0 2 3 4 】

【 表 6 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	10
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	20
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	30
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	40
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	

【 0 2 3 5 】

【 表 6 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

10

20

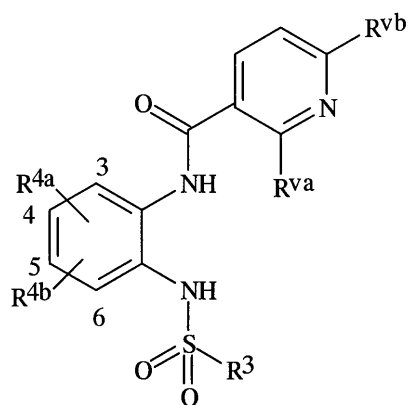
30

40

【 0 2 3 6 】

【 表 6 7 】

表 8



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

【 0 2 3 7 】

【 表 6 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	10
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	20
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	30
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	40
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	10
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	20
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	30
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	40
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	

【 0 2 3 9 】

【 表 7 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	10
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	20
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	40
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	

【 0 2 4 0 】

【 表 7 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	20
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	H	CF ₃	
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br	
Me	3-Cl	H	Et	Br	
Et	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	10
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	20
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	
Et	6-Cl	H	Me	Cl	40
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	

【 0 2 4 3 】

【 表 7 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	20
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	30
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	40
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	

【 0 2 4 4 】

【 表 7 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

10

20

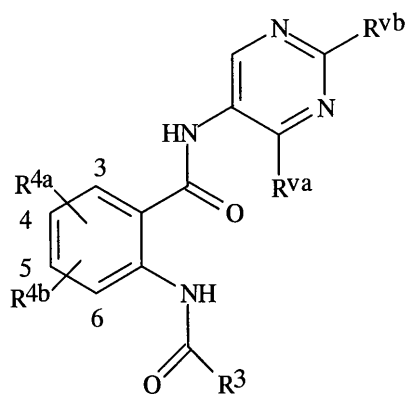
30

40

【 0 2 4 5 】

【 表 7 6 】

表 9



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

【 0 2 4 6 】

【 表 7 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロバルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	10
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	20
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロバルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	30
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	40
プロバルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	

【 0 2 4 7 】

【 表 7 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃

10

20

30

40

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OE _t	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	10
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	20
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	40
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

10

20

30

40

【 0 2 5 0 】

【 表 8 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	10
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	20
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	40
Et	6-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	

【 0 2 5 2 】

【 表 8 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
t-Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	10
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	20
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	30
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	40
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	

【 0 2 5 3 】

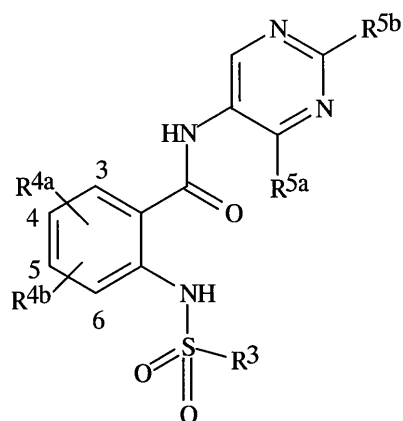
【 表 8 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl	
Et	6-F	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	10
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	30
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	

【 0 2 5 4 】

【 表 8 5 】

表10



10

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

20

30

40

【 0 2 5 5 】

【 表 8 6 】

50

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	10
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	20
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	30
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	40
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	

【 0 2 5 6 】

【 表 8 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	10
プロバルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	20
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	30
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	
プロバルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロバルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	10
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	20
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	40
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	

【 0 2 5 8 】

【 表 8 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

10

20

30

40

【 0 2 5 9 】

【 表 9 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	20
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	

【 0 2 6 0 】

【 表 9 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	
Et	6-Cl	H	Me	Cl	40
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	

【 0 2 6 1 】

【 表 9 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
t-Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	20
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	30
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	40
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	

【 0 2 6 2 】

【 表 9 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

10

20

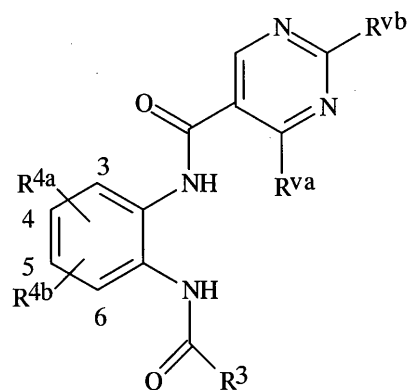
30

40

【 0 2 6 3 】

【 表 9 4 】

表11



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

10

20

30

40

【 0 2 6 4 】

【 表 9 5 】

50

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	10
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	20
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	30
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	40
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	

【 0 2 6 5 】

【 表 9 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	10
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	20
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	30
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	40
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	

【 0 2 6 6 】

【 表 9 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	10
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	20
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	40
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	

【 0 2 6 7 】

【 表 9 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	10
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	20
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	H	CF ₃	
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br	
Me	3-Cl	H	Et	Br	
Et	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	

【 0 2 6 8 】

【 表 9 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	10
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	20
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ビリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ビリジル	Cl	

【 0 2 6 9 】

【 表 1 0 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	20
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	
Et	6-Cl	H	Me	Cl	40
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	

【 0 2 7 0 】

【 表 1 0 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	20
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	30
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	40
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	

【 0 2 7 1 】

【 表 1 0 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

10

20

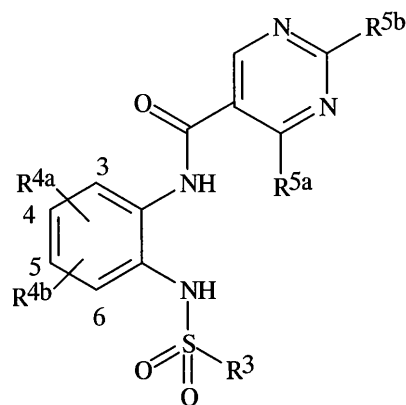
30

40

【 0 2 7 2 】

【 表 1 0 3 】

表12



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

【 0 2 7 3 】

【 表 1 0 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃	10
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃	
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	20
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	H	Br	
Et	3-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	Ph	Cl	30
Et	3-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	40
プロパルギル	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	

【 0 2 7 4 】

【 表 1 0 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	10
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	20
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	30
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	40
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃	

【 0 2 7 5 】

【 表 1 0 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
Et	6-Me	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Me	H	Me	OEt	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et	10
プロパルギル	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃	20
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
プロパルギル	6-Me	H	H	Br	
Et	6-Me	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	Cl	
Et	6-Me	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	Cl	40
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl	
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	

【 0 2 7 6 】

【 表 1 0 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	20
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	H	CF ₃	
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br	
Me	3-Cl	H	Et	Br	
Et	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	

【 0 2 7 7 】

【 表 1 0 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe	
Me	3-Cl	H	Me	OEt	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	20
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃	
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	Br	
Et	3-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	Cl	
Et	3-Cl	H	Ph	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	Cl	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	20
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	H	CF ₃	
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br	
Me	6-Cl	H	Et	Br	
Et	6-Cl	H	Me	Cl	40
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	

【 0 2 7 9 】

【 表 1 1 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	
t-Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	10
シクロプロピル	6-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃	
Et	6-F	H	F	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe	
Me	6-Cl	H	Me	OEt	20
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	30
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂	40
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	H	Br	
Et	6-Cl	H	H	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃	

【 0 2 8 0 】

【 表 1 1 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
プロパルギル	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

10

20

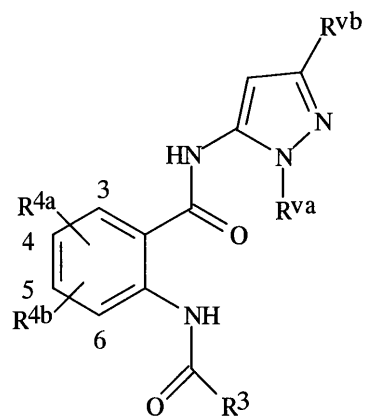
30

40

【 0 2 8 1 】

【 表 1 1 2 】

表13



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₃
Et	3-Me	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OEt
Me	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Et	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇

10

20

30

40

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	Et	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	OCF ₂ CHF ₂	
プロパルギル	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	CHF ₂	CF ₃	10
Me	3-Me	H	CHF ₂	Me	
Et	3-Me	H	Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Ph	Br	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	2-ClPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	OCF ₃	20
Me	3-Me	H	2-ClPh	Br	
Et	3-Me	H	2-ClPh	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	2-ClPh	SCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	2-MePh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	30
Et	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
Me	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	40
プロパルギル	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	

【 0 2 8 3 】

【 表 1 1 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	
プロバルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	20
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロバルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SMe	
Et	6-Me	H	Me	OMe	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
Et	6-Me	H	Me	Et	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF ₂ CHF ₂	
プロバルギル	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
Et	6-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	40
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF ₃	Me	
Me	6-Me	H	Ph	CF ₃	
Et	6-Me	H	Ph	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br	

【 0 2 8 4 】

【 表 1 1 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br	
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl	
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
Me	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
Me	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	Me	Br	
Et	3-Br	5-Me	Et	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl	40
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl	
Me	3-Cl	H	Me	I	
Et	3-Cl	H	Me	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	

【 0 2 8 5 】

【 表 1 1 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
Me	3-F	H	Me	C ₂ F ₅	
Et	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt	
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	20
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF ₃	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	CF ₃	Me	
Et	3-Cl	H	Ph	CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br	
Me	3-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-CN	H	2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br	
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl	40
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
Me	3-F	H	2-MePh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	

【 0 2 8 6 】

【 表 1 1 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
プロパルギル	3-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
シクロプロピル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
Me	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
プロパルギル	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Et	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	Me	SMe
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇

10

20

30

40

【 0 2 8 7 】

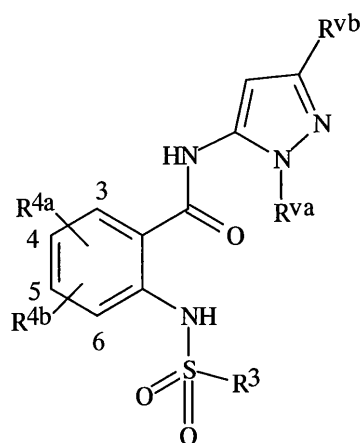
【 表 1 1 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-F	H	Me	Et	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
Et	6-I	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF ₃	Me	10
プロパルギル	6-Cl	H	Ph	CF ₃	
Et	6-Cl	H	Ph	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl	20
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	30
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
Et	6-F	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	40
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
Me	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
プロパルギル	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	

【 0 2 8 8 】

【 表 1 1 9 】

表14



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₃
Et	3-Me	H	Me	SMe

10

20

30

40

【 0 2 8 9 】

【 表 1 2 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	OMe	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OEt	
Me	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
Et	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	Et	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	OCF ₂ CHF ₂	10
プロパルギル	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	CHF ₂	CF ₃	
Me	3-Me	H	CHF ₂	Me	
Et	3-Me	H	Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Ph	Br	20
シクロプロピル	3-Me	5-Br	2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	2-ClPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	OCF ₃	
Me	3-Me	H	2-ClPh	Br	
Et	3-Me	H	2-ClPh	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	2-ClPh	SCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	30
プロパルギル	3-Me	H	2-MePh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	40
Me	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
Me	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	

【 0 2 9 0 】

【 表 1 2 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Me	H	H	CF ₃	
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br	
Me	6-Me	H	Et	Br	
Et	6-Me	H	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I	
プロバルギル	6-Me	H	Me	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃	20
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
プロバルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	6-Me	H	Me	SMe	
Et	6-Me	H	Me	OMe	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
Et	6-Me	H	Me	Et	40
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF ₂ CHF ₂	
プロバルギル	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
Et	6-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	

【 0 2 9 1 】

【 表 1 2 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF ₃	Me	
Me	6-Me	H	Ph	CF ₃	
Et	6-Me	H	Ph	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	2-ピリジル	Cl	10
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br	
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl	
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
プロバルギル	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	20
Et	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
Me	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	30
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
プロバルギル	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
Me	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	40
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	Me	Br	
Et	3-Br	5-Me	Et	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl	
Me	3-Cl	H	Me	I	

【 0 2 9 2 】

【 表 1 2 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Cl	H	Me	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF ₂	10
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
Me	3-F	H	Me	C ₂ F ₅	
Et	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt	20
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF ₃	CF ₃	30
プロパルギル	3-Cl	H	CF ₃	Me	
Et	3-Cl	H	Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br	
Me	3-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-CN	H	2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	40
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br	
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
Me	3-F	H	2-MePh	CF ₃	

【 0 2 9 3 】

【 表 1 2 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	10
シクロプロピル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
Me	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	20
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	6-Cl	H	Et	Br	
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I	
Me	6-Cl	H	Me	CF ₃	30
Et	6-Cl	H	Me	OCF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	SCHF ₂	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
Me	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	40
Et	6-Cl	H	Et	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	SMe	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OMe	

【 0 2 9 4 】

【 表 1 2 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
Et	6-F	H	Me	Et	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂	10
Me	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
Et	6-I	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF ₃	Me	
プロパルギル	6-Cl	H	Ph	CF ₃	
Et	6-Cl	H	Ph	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-ピリジル	CF ₃	20
Me	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl	
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl	
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF ₃	30
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₃	
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	40
Et	6-F	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	

【 0 2 9 5 】

【 表 1 2 6 】

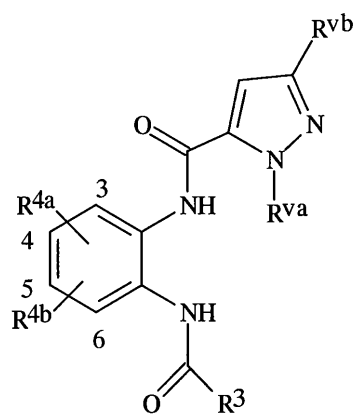
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

【 0 2 9 6 】

【 表 1 2 7 】

10

表15



20

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃

30

40

50

【 0 2 9 7 】

【 表 1 2 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₃	
Et	3-Me	H	Me	SMe	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	OMe	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OEt	10
Me	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
Et	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	Et	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	OCF ₂ CHF ₂	
プロパルギル	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Me	SO ₂ Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	CHF ₂	CF ₃	20
Me	3-Me	H	CHF ₂	Me	
Et	3-Me	H	Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Ph	Br	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	2-ClPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	OCF ₃	30
Me	3-Me	H	2-ClPh	Br	
Et	3-Me	H	2-ClPh	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	2-ClPh	SCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	2-MePh	CF ₃	
Et	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-FPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	40
シクロプロピル	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
Et	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-ピリジル	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl	

【 0 2 9 8 】

【 表 1 2 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
Me	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
プロパルギル	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF ₂ CHF ₂

10

20

30

40

【 0 2 9 9 】

50

【表 1 3 0】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
プロパルギル	6-Me	H	Me	SO ₂ Me	
Et	6-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF ₃	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF ₃	Me	
Me	6-Me	H	Ph	CF ₃	
Et	6-Me	H	Ph	Cl	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	2-ピリジル	Cl	
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br	
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl	
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂	20
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	2-FPh	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃	
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃	
Me	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br	
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
Me	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃	40
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃	
Me	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	Me	Br	
Et	3-Br	5-Me	Et	Br	

【 0 3 0 0 】

【表 1 3 1】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl	
Me	3-Cl	H	Me	I	
Et	3-Cl	H	Me	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	10
プロパルギル	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
Me	3-F	H	Me	C ₂ F ₅	
Et	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	20
プロパルギル	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt	
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂	30
Me	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF ₃	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	CF ₃	Me	
Et	3-Cl	H	Ph	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br	
Me	3-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	40
Et	3-CN	H	2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br	
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl	

【 0 3 0 1 】

【 表 1 3 2 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	3-F	H	2-MePh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
プロパルギル	3-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
シクロプロピル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
Me	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
プロパルギル	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Et	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF ₃

10

20

30

40

【 0 3 0 2 】

【 表 1 3 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	Me	SMe
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-I	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF ₃	Me
プロパルギル	6-Cl	H	Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
シクロプロピル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂

10

20

30

40

【 0 3 0 3 】

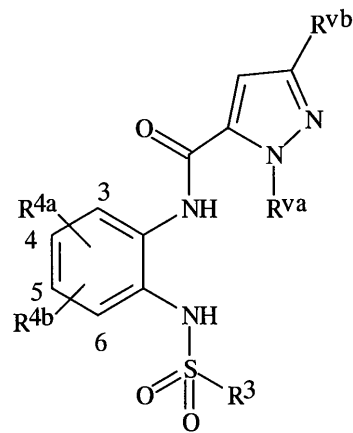
【 表 1 3 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

【 0 3 0 4 】

【 表 1 3 5 】

表16



10

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
プロパルギル	3-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅

20

30

【 0 3 0 5 】

【 表 1 3 6 】

40

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₃
Et	3-Me	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OEt
Me	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Et	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	OCF ₂ CHF ₂
プロパルギル	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	CHF ₂	CF ₃
Me	3-Me	H	CHF ₂	Me
Et	3-Me	H	Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Ph	Br
シクロプロピル	3-Me	5-Br	2-ピリジル	CF ₃
Et	3-Me	H	2-ピリジル	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	2-ClPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	3-Me	H	2-ClPh	Br
Et	3-Me	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	2-ClPh	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
プロパルギル	3-Me	H	2-MePh	CF ₃
Et	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
シクロプロピル	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Et	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃

10

20

30

40

【 0 3 0 6 】

【 表 1 3 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
Me	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
プロパルギル	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₃
シクロプロピル	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇

10

20

30

40

【 0 3 0 7 】

【 表 1 3 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF ₂ CHF ₂
プロパルギル	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF ₃	Me
Me	6-Me	H	Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₃
シクロプロピル	6-Me	4-Br	2-ピリジル	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
プロパルギル	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
シクロプロピル	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-ピリジル	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
プロパルギル	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Br

10

20

30

40

【 0 3 0 8 】

【 表 1 3 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	Cl	
Me	3-Cl	H	Me	Br	
Et	3-Br	5-Me	Et	Br	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl	
Me	3-Cl	H	Me	I	
Et	3-Cl	H	Me	CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	SCF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	SCHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
Me	3-F	H	Me	C ₂ F ₅	
Et	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	20
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	SMe	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt	
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	SO ₂ Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF ₃	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	CF ₃	Me	
Et	3-Cl	H	Ph	CF ₃	40
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br	
Me	3-Cl	H	2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-CN	H	2-ピリジル	Cl	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃	

【 0 3 0 9 】

【 表 1 4 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	3-F	H	2-MePh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
プロパルギル	3-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
シクロプロピル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
Me	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
プロパルギル	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

10

20

30

40

【 0 3 1 0 】

【 表 1 4 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Et	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	Me	SMe
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-I	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF ₃	Me
プロパルギル	6-Cl	H	Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-ピリジル	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	OCF ₃

10

20

30

40

【 0 3 1 1 】

【 表 1 4 2 】

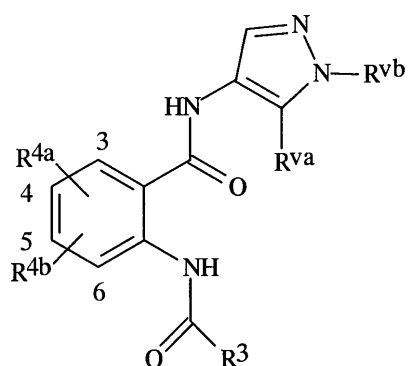
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
シクロプロピル	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-ピリジル	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	OCF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Br
プロパルギル	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	Cl

10

【 0 3 1 2 】

【 表 1 4 3 】

表17



20

30

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CHF ₂
Et	3-Me	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF ₂
プロパルギル	3-Me	H	Me	CBrF ₂
シクロプロピル	3-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅

40

50

【 0 3 1 3 】

【 表 1 4 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	3-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	F	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF ₂	
Me	3-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	20
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl	
プロパルギル	3-Me	H	Et	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
Me	3-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	40
Et	3-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	

【 0 3 1 4 】

【表 1 4 5】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF ₂	
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂	10
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	20
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	30
Me	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂	
Me	6-Me	H	H	CHF ₂	
Et	6-Me	4-Me	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	40
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CBrF ₂	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et	

【 0 3 1 5 】

【表 1 4 6】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	6-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	6-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	F	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF ₂	
Me	6-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	20
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	30
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C ₂ F ₅	
Me	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	40
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH ₂ CF ₃	

【 0 3 1 6 】

【 表 1 4 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	H	CHF ₂
Et	3-Br	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF ₂

10

20

30

40

【 0 3 1 7 】

【 表 1 4 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CBrF ₂	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et	
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	3-Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	3-Cl	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CH ₂ CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF ₂	
Me	3-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	30
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	40
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
Me	3-F	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロバルギル	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	10
Et	3-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	CHF ₂	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	20
プロバルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	30
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロバルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂	40
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	H	Et	CHF ₂	
Et	6-Br	4-Me	Me	CH ₂ CF ₃	

【 0 3 1 9 】

【 表 1 5 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CBrF ₂	10
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et	
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	6-Cl	H	Et	CH ₂ C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	Cl	C ₂ F ₅	20
シクロプロピル	6-Cl	H	F	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF ₂	
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	
Et	6-F	H	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF ₂	
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	30
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl	
プロパルギル	6-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	CF ₃	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	40
Et	6-Cl	H	H	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	

【 0 3 2 0 】

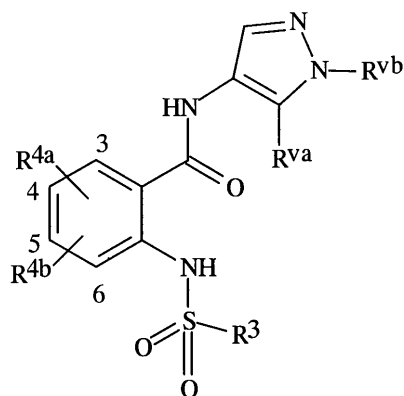
【 表 1 5 1 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C ₂ F ₅	
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃	10
Et	6-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-F	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF ₂	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et	20
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	30
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	40
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	

【 0 3 2 1 】

【 表 1 5 2 】

表18



10

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CHF ₂
Et	3-Me	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF ₂
プロパルギル	3-Me	H	Me	CBrF ₂
シクロプロピル	3-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF ₃
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	3-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF ₂
Me	3-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

20

30

40

【 0 3 2 2 】

【 表 1 5 3 】

50

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl	
プロパルギル	3-Me	H	Et	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	10
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
Me	3-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	20
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	30
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF ₂	
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	40
プロパルギル	3-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₂ CHF ₂	

【 0 3 2 3 】

【 表 1 5 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	10
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂	
Me	6-Me	H	H	CHF ₂	
Et	6-Me	4-Me	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CBrF ₂	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	30
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et	
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	6-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	40
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	6-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	F	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF ₂	

【 0 3 2 4 】

【 表 1 5 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
プロパルギル	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH ₂ CF ₃
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 3 2 5 】

【 表 1 5 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	6-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	H	H	CHF ₂	
Et	3-Br	5-Me	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CBrF ₂	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et	
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	3-Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	40
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	

【 0 3 2 6 】

【 表 1 5 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	3-Cl	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF ₂	
Me	3-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	10
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	20
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
Me	3-F	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃	40
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	CHF ₂	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	

【 0 3 2 7 】

【 表 1 5 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Et	CHF ₂
Et	6-Br	4-Me	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF ₂
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CBrF ₂
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH ₂ C ₂ F ₅

10

20

30

40

【 0 3 2 8 】

【 表 1 5 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	Cl	C ₂ F ₅
シクロプロピル	6-Cl	H	F	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-F	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl
プロパルギル	6-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	CF ₃	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C ₃ F ₇
プロパルギル	6-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Et	6-F	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 3 2 9 】

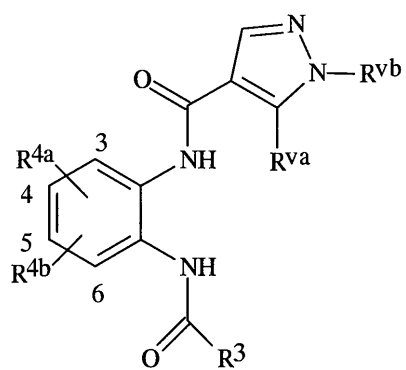
【 表 1 6 0 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF ₂	
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et	
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	10
プロバルギル	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	20
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロバルギル	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	30

【 0 3 3 0 】

【 表 1 6 1 】

表19



10

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CHF ₂

【 0 3 3 1 】

【 表 1 6 2 】

20

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Me	5-Me	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF ₂	10
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	3-Me	H	Me	CBrF ₂	
シクロプロピル	3-Me	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et	
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	3-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF ₃	20
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	3-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	F	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF ₂	30
Me	3-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl	
プロパルギル	3-Me	H	Et	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂	40
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	CH ₂ CF ₃	

【 0 3 3 2 】

【 表 1 6 3 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
Me	3-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	10
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF ₂	20
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	30
Me	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	40
プロパルギル	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	

【 0 3 3 3 】

【 表 1 6 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂	
Me	6-Me	H	H	CHF ₂	
Et	6-Me	4-Me	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CBrF ₂	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et	
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	6-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	20
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	6-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	F	CH ₂ CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF ₂	
Me	6-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	40
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	

【 0 3 3 4 】

【 表 1 6 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C ₂ F ₅	
Me	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	10
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	20
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	CHF ₂	
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et	
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	30
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	40
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	

【 0 3 3 5 】

【 表 1 6 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	H	H	CHF ₂	10
Et	3-Br	5-Me	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CBrF ₂	20
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et	
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	3-Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	30
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	3-Cl	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF ₂	
Me	3-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	40
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	

【 0 3 3 6 】

【 表 1 6 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	CH ₂ CF ₃	10
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
Me	3-F	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	20
Et	3-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	CHF ₂	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et	30
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	40
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	

【 0 3 3 7 】

【 表 1 6 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Et	CHF ₂
Et	6-Br	4-Me	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF ₂
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CBrF ₂
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	Cl	C ₂ F ₅
シクロプロピル	6-Cl	H	F	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-F	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl

10

20

30

40

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl
プロパルギル	6-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	CF ₃	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C ₃ F ₇
プロパルギル	6-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
シクロプロピル	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Et	6-F	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 3 3 9 】

【 表 1 7 0 】

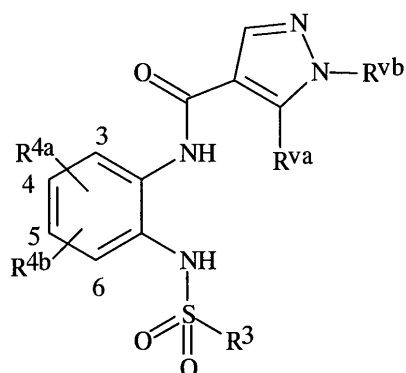
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-ピリジル	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂

10

【 0 3 4 0 】

【 表 1 7 1 】

表20



20

30

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CHF ₂
Et	3-Me	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF ₂
プロパルギル	3-Me	H	Me	CBrF ₂
シクロプロピル	3-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et

40

【 0 3 4 1 】

50

【表 1 7 2】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	3-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Me	H	Et	CHF ₂	10
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	3-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	F	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF ₂	
Me	3-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	20
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl	
プロパルギル	3-Me	H	Et	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	CF ₃	Me	30
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	3-Me	5-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C ₂ F ₅	
Me	3-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	40
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	

【 0 3 4 2 】

【表 1 7 3】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
シクロプロピル	3-Me	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF ₂	
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et	
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	10
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
Et	3-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	3-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	30
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂	
Me	6-Me	H	H	CHF ₂	
Et	6-Me	4-Me	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃	40
Et	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CBrF ₂	
シクロプロピル	6-Me	H	Me	CH ₂ F	

【 0 3 4 3 】

【 表 1 7 4 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et	
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	6-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅	10
シクロプロピル	6-Me	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	
Me	6-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	F	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF ₂	
Me	6-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	20
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl	
プロパルギル	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	30
Et	6-Me	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	6-Me	4-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C ₂ F ₅	
Me	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	40
Et	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂	

【 0 3 4 4 】

【 表 1 7 5 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH ₂ CF ₃
シクロプロピル	6-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-ピリジル	CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	6-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
プロパルギル	6-Me	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	H	CHF ₂
Et	3-Br	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 3 4 5 】

【 表 1 7 6 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CBrF ₂	
シクロプロピル	3-Cl	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et	10
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	3-Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	3-Cl	H	Et	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂	20
Me	3-Cl	H	Cl	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Br	H	F	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH ₂ Cl	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF ₂	
Me	3-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl	30
プロパルギル	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂	
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-CN	H	CF ₃	Me	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	40
シクロプロピル	3-Cl	5-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
Me	3-F	H	H	CF ₂ CHF ₂	

【 0 3 4 6 】

【 表 1 7 7 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Et	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH ₂ CF ₃	10
シクロプロピル	3-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ピリジル	CHF ₂	
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et	
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	20
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH ₂ CF ₃	
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	30
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃	
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	3-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	40
Me	3-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Et	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CClF ₂	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	

【 0 3 4 7 】

【 表 1 7 8 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
Me	6-Cl	H	Et	CHF ₂	
Et	6-Br	4-Me	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF ₂	10
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF ₂	
プロパルギル	6-Cl	H	Me	CBrF ₂	
シクロプロピル	6-Cl	H	Me	CH ₂ F	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et	
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr	
Et	6-Cl	H	Et	CH ₂ C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	20
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	Cl	C ₂ F ₅	
シクロプロピル	6-Cl	H	F	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF ₂	
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	
Et	6-F	H	Me	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ Cl	30
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF ₂	
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl	
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl	
プロパルギル	6-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	CF ₃	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂	40
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	Me	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	

【 0 3 4 8 】

【 表 1 7 9 】

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}	
シクロプロピル	6-Cl	4-Br	H	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅	
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C ₂ F ₅	
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇	10
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C ₃ F ₇	
プロパルギル	6-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ピリジル	CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
シクロプロピル	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
Et	6-F	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF ₂	20
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et	
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃	30
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-ピリジル	CHF ₂	
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-ピリジル	CBrF ₂	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
プロパルギル	6-Cl	H	3-Me-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	40
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₃	
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CH ₂ CF ₃	
Me	6-Cl	H	3-Br-2-ピリジル	CF ₂ CHF ₂	

【0349】

発明の生物学的実施例
組成／実用性

通常、本発明の化合物を製剤または組成物として、液体希釈剤、固体希釈剤または界面活 50

性剤のうちの少なくとも1種を含む農業的に適した担体と併用する。この製剤または組成物の成分については、活性成分の物性、施用形態、土壌の種類や温湿度などの環境要因と相反しないように選択する。有用な製剤には、任意に増粘してゲル状にしてもよい、溶液（乳化可能な濃縮物を含む）、懸濁液、乳剤（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）などの液体がある。また、有用な製剤には、水分散性（「水和性」）または水溶性であってもよい、微粉末、粉末、顆粒、ペレット、錠剤、膜などの固体がある。活性成分を（マイクロ）カプセル化してさらに懸濁液または固体製剤の形にしてもよい。あるいは、活性成分からなる製剤全体をカプセル化（または「オーバーコート」）してもよい。カプセル化することで、活性成分の放出を制御したり遅らせることができる。噴霧可能な製剤を好適な媒質に入れて薄め、1ヘクタールあたり約1から数百リットルの噴霧量で使用することも可能である。さらに製剤を得るための中間体として最初は高濃度組成物を使用する。

10

【0350】

これらの製剤には一般に、有効量の活性成分と、希釈剤と、界面活性剤とが、全体で100重量パーセントになるおおむね下記のような範囲で含まれる。

【0351】

【表180】

	重量%		
	活性成分	希釈剤	界面活性剤
水分散性および水溶性の顆粒、 錠剤および粉末	5-90	0-94	1-15
懸濁液、乳液、溶液（乳剤を含む）	5-50	40-95	0-15
微粉末	1-25	70-99	0-5
顆粒およびペレット	0.01-99	5-99.99	0-15
高濃度組成物	90-99	0-10	0-2

20

30

【0352】

一般的な固体希釈剤は、ワトキンス（Watkins）ら、Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers、第2版、ドーランド・ブックス（Dorland Books）、コールドウェル（Caldwell）、ニュージャージー（New Jersey）に記載されている。一般的な液体希釈剤は、マースデン（Marsden）、Solvents Guide、第2版、インターサイエンス（Interscience）、ニューヨーク（New York）、1950に記載されている。McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual、アルーアド・パブリッシング・コーポレーション（Allured Publ. Corp.）、リッジウッド（Ridgewood）、ニュージャージーならびにシゼリー（Sisely）およびウッド（Wood）、Encyclopedia of Surface Active Agents、ケミカル・パブリッシング・カンパニー・インコーポレイテッド（Chemical Publ. Co., Inc.）、ニューヨーク（New York）、1964には、界面活性剤ならびに推奨される使い方が列挙されている。いずれの製剤にも、発泡、ケーキング、腐食、微生物の増殖などを抑える目的の添加剤あるいは、粘度を高めるための増粘剤を少量

40

50

含み得る。

【0353】

界面活性剤としては、たとえば、ポリエトキシシル化アルコール、ポリエトキシシル化アルキルフェノール、ポリエトキシシル化ソルビタン脂肪酸エステル、スルホコハク酸ジアルキル、硫酸アルキル、スルホン酸アルキルベンゼン、オルガノシリコン、N，N－ジアルキルタウリン、スルホン酸リグニン、スルホン酸ナフタレンホルムアルデヒド縮合物、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コポリマーがあげられる。固体希釈剤としては、たとえば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイト、カオリンなどのクレー、スターチ、糖類、シリカ、タルク、珪藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウム、重炭酸ナトリウム、硫酸ナトリウムがあげられる。液体希釈剤としては、たとえば、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、亜麻仁油、キリ油、ゴマ油、コーン油、ラッカセイ油、綿実油、大豆油、ナタネ油、ココナツ油、脂肪酸エステル、シクロヘキサノン、2－ヘプタノン、イソホロン、4－ヒドロキシー4－メチル－2－ペンタノンなどのケトン、メタノール、シクロヘキサノール、デカノール、テトラヒドロフルフリルアルコールなどのアルコールがあげられる。

【0354】

単に成分を混合するだけで、乳化可能な濃縮物をはじめとする溶液を調製することができる。微粉末および粉末を調製するには、ブレンドし、通常はハンマーミルまたは流体エネルギーミルなどの場合のように粉碎すればよい。懸濁液の場合は湿式粉碎で調製するのが普通である。たとえば、米国特許第3，060，084号を参照のこと。顆粒およびペレットを調製するには、予備成形した粒状担体に活性材料を噴霧するか、凝集法を用いるようにすればよい。ブラウニング（Browning）、「Agglomeration」、Chemical Engineering、1967年12月4日、第147～48頁、Perry's Chemical Engineer's Handbook、第4版、マグローヒル（McGraw-Hill）、ニューヨーク、1963、第8～57頁以下ならびに、国際特許出願公開第91／13546号パンフレットを参照のこと。ペレットを調製するには米国特許第4，172，714号に記載されているようにすればよい。水分散性顆粒および水溶性顆粒を調製するには、米国特許第4，144，050号、米国特許第3，920，442号、DE3，246，493号に教示されているようにすればよい。錠剤を調製するには、米国特許第5，180，587号、米国特許第5，232，701号、米国特許第5，208，030号に教示されているようにすればよい。膜を調製するには、GB2，095，558号、米国特許第3，299，566号に教示されているようにすればよい。

【0355】

製剤の従来技術に関するこれ以上の情報については、T. S. ウッズ（Woods）、「The Formulator's Toolbox — Product Forms for Modern Agriculture」、Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge、T. ブルックス（Brooks）およびT. R. ロバーツ（Roberts）編、Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry、英国王立化学協会（The Royal Society of Chemistry）、ケンブリッジ（Cambridge）、1999、第120～133頁を参照のこと。また、米国特許第3，235，361号第6欄の第16行目～第7欄の第19行目ならびに実施例10～41、米国特許第3，309，192号第5欄の第43行目～第7欄の第62行目ならびに実施例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号第3欄の第66行目～第5欄の第17行目ならびに実施例1～4、クリングマ

ン (Klingman)、Weed Control as a Science、ジョン・ワイリー・アンド・サンズ・インコーポレイテッド (John Wiley and Sons, Inc.)、ニューヨーク、1961、第81～96頁ならびに、ハンス (Hance) ら、Weed Control Handbook、第8版、ブラックウェル・サイエンティフィック・パブリケーションズ (Blackwell Scientific Publications)、オックスフォード、1989も参照のこと。

【0356】

以下の実施例では、パーセンテージはいずれも重量比であり、製剤はいずれも従来の方法で調製したものである。化合物番号はインデックステーブルAの化合物を示している。

【0357】

10

【表181】

実施例A

水和剤

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

20

【0358】

【表182】

実施例B

顆粒

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

【0359】

30

【表183】

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/マグネシウムペントナイト	59.0%

40

【0360】

【表184】

実施例D

乳化可能な濃縮物

化合物7	20.0%
油性スルホネートとポリオキシエチレンエーテルとのブレンド	10.0%
イソホロン	70.0%

【0361】

【表185】

10

実施例E

顆粒

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%

【0362】

20

本発明の化合物は、都合のよい代謝および／または土壌残留パターンを持つことを特徴とし、農業と非農業の無脊椎有害生物のスペクトルを制御する活性を呈する。（本願開示内容の文脈において、「無脊椎有害生物の防除」とは、摂食（feeding）を大きく低下させる無脊椎有害生物の発育または害虫によって引き起こされる他の損傷あるいは被害の阻害（死滅させることを含む）を意味し、関連の表現については同様に定義する。）本願開示で用いる場合、「無脊椎有害生物」という用語には、害虫として経済的観点から重要である節足動物、腹足類および線虫を含む。「節足動物」という用語には、昆虫、ダニ、クモ、サソリ、ムカデ、ヤスデ、ダンゴムシ、コムカデを含む。「腹足類」という用語には、カタツムリ、ナメクジ、その他の柄眼目を含む。「線虫」という用語には、回虫、犬糸状虫および植物寄生性線虫（線虫綱）、吸虫（吸虫綱）、鉤頭動物門および条虫（条虫綱）などのあらゆる蠕虫類を含む。すべての化合物があらゆる害虫に同じように有効だとは限らないことは当業者であれば分かるであろう。本発明の化合物は、経済的観点から重要な農業害虫、森林害虫、温室害虫、育苗害虫、観葉植物の害虫のほか、食品および繊維、公衆衛生、動物の衛生、家庭用の構造体および商用構造体、家庭用品、貯蔵製品の害虫に対する活性を示す。これには、ヤガ科のアーミーワーム、根切虫、ルーパー、タバコガ（ハスモンヨトウ（*Spodoptera fugiperda* J. E. スミス（Smith））、シロイチモジヨトウ（*Spodoptera exigua* ヒュブネル（Huebner））、タマナヤガ（*Agrotis ipsilon* ハフナゲル（Hufnagel））、イラクサギンウワバ（*Trichoplusia ni* ヒュブネル（Huebner））、オオタバコガ（*Heliothis virescens* ファブリシウス（Fabricius））など）；メイガ科の穿孔性害虫、繭を作る害虫、食葉に巣を作る群局性害虫、コーンワーム、アオムシ、葉脈を残して葉を食害する害虫（アワノメイガ（*Ostrinia nubilalis* ヒュブネル（Huebner））、ネーブルオレンジワーム（*Amyelois transitella* ウォーカー（Walker））、ウスギンツトガ（*Crambus caliginosellus* クレメンズ（Clemens））、クロオビクロノメイガ（*Herpetogramma licarsialis* ウォーカー（Walker））など）；ハマキガ科のハマキムシ、芽を食害する害虫、種子を食害する害虫、果実を食害する害虫（コドリングア（*Cydia pomonella* リンネ（Linnaeus））、グレープベリーモス（*Endopiza viteana* クレメンズ（Clemens））、ナシヒメシン

30

40

50

クイ (*Grapholitha molesta* ブスク (*Busck*)) など) ; 経済的観点から重要な他の多くの鱗翅目 (コナガ (*Plutella xylostella* リンネ (*Linnaeus*))、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella* ソーンダズ (*Saunders*))、マイマイガ (*Lymantria dispar* リンネ (*Linnaeus*)) など) などの鱗翅目の幼虫 ; チャバネゴキブリ科およびゴキブリ科 (トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis* リンネ (*Linnaeus*))、アジアゴキブリ (*Blattella asahinai* ミズクボ (*Mizukubo*))、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica* リンネ (*Linnaeus*))、チャオビゴキブリ (*Supella longipalpa* ファブリシウス (*Fabricius*))、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana* リンネ (*Linnaeus*))、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea* バーマイスター (*Burmeister*))、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae* ファブリシウス (*Fabricius*)) などのゴキブリをはじめとするゴキブリ目のニフおよび成虫 ; ヒゲナガゾウムシ科、マメゾウムシ科、ゾウムシ科のゾウムシ (ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis* ボヘマン (*Boheman*))、イネミズゾウムシ (*Lissorhopterus oryzophilus* クッセル (*Kuschel*))、オサゾウムシ (*Sitophilus granarius* リンネ (*Linnaeus*))、コクゾウムシ (*Sitophilus oryzae* リンネ (*Linnaeus*)) ; ハムシ科のノミハムシ、ウリハムシ、根食い線虫、ハムシ、イモハムシおよびハモグリムシ (コロアドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata* セイ (*Say*))、ウェスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera* ルコンテ (*LeConte*)) など) ; コガネムシ科 (*Scarabaeidae*) のコガネムシおよび他の甲虫 (マメコガネ (*Popillia japonica* ニューマン (*Newman*))、ヨーロッパコガネムシ (*European chafer*) (*Rhizotrogus majalis* ラゾウモブスキー (*Razoumowsky*)) など) ; カツオブシムシ科のカツオブシムシ ; コメツキムシ科のコメツキムシ ; キクイムシ科のキクイムシ、ゴミムシダマシ科のコクヌストモドキをはじめとする鞘翅目の食葉性幼虫および成虫があげられる。また、クギヌキハサミムシ科のハサミムシ (ヨーロッパクギヌキハサミムシ (*Forficula auricularia* リンネ (*Linnaeus*))、ブラックイヤウィグ (black earwig) (*Chelisoches morio* ファブリシウス (*Fabricius*)) など) をはじめとする革翅目の成虫および幼虫 ; カスミカメムシ科のカスミカメムシ、セミ科のセミ、ヨコバイ科のヨコバイ (カキノヒメヨコバイ (*Empoasca*) spp. など)、アワフキムシ科 (*Fulgoroidea*) およびウンカ科のプラントホッパー、ツノゼミ科のツノゼミ、キジラミ科のキジラミ、コナジラミ科のコナジラミ、アブラムシ科のアブラムシ、ネアブラムシ科のネアブラムシ、コナカイガラムシ科のコナカイガラムシ、カタカイガラムシ科、マルカイガラムシ科およびワタフキカイガラムシ科のカイガラムシ、グンバイムシ科のグンバイムシ、カメムシ科のカメムシ、ナガカメムシ科のナガカメムシ (cinch bug) (*Blissus* spp. など) ならびに他のコバネナガカメムシ、コガシラアワフキ科のアワフキムシ、ヘリカメムシ科のヘリカメムシ、ホシカメムシ科のアカホシカメムシおよびホシカメムシなどの半翅目および同翅目の成虫およびニフもあげられる。さらに、ハダニ科のハダニおよびアカダニ (リンゴハダニ (*Panonychus ulmi* コッチ (*Koch*))、ナミハダニ (*Tetranychus urticae* コッチ (*Koch*))、マクダニエルダニ (*Tetranychus mcdanieli* マクレガー (*McGregor*)) など)、ヒメハダニ科のヒメハダニ (カンキツヒメハダニ (*Brevipalpus lewisi* マクレガー (*McGregor*)) など)、フシダニ科のサビダニおよびフシダニならびに他の食葉性ダニなどのコナダニ (ダニ) ならびに、人間および動物の健康にとって重要なダニすなわち、チリダニ科のヒョウダニ、ニキビダニ科のニキビダニ、ニクダニ科のムギコナダニ、マダ

ニ科のマダニ（シカダニ（*Ixodes scapularis* セイ（Say））、オーストラリアマダニ（*Ixodes holocyclus* ニューマン（Neuman））、カクマダニ（*Dermacentor variabilis* セイ（Say））、ローンスタールチック（*lone star tick*）（*Amblyomma americanum* リンネ（Linnaeus））、キュウセンダニ科、シラミダニ科、ヒゼンダニ科の疥癬や皮癬のダニの成虫および幼虫；バッタ、イナゴおよびコオロギ（クルマバッタ（*Melanoplus sanguinipes* ファブリシウス（Fabricius））、*M. differentialis* トーマス（Thomas））、アメリカイナゴ（*Schistocerca americana* ドルーリー（Drury））など）、サバクバッタ（*Schistocerca gregaria* フォースカル（Forsk.））、トノサマバッタ（*Locusta migratoria* リンネ（Linnaeus））、ヨーロッパイエコオロギ（*Acheta domestica* リンネ（Linnaeus））、ケラ（*Gryllotalpa* spp.）など）をはじめとする直翅目の成虫および幼若虫；ハモグリムシ、ユスリカ、ミバエ（ミバエ科）、キモグリバエ（*Oscinella frit* リンネ（Linnaeus））、ウジバエ、イエバエ（*Musca domestica* リンネ（Linnaeus））など）、ヒメイエバエ（*Fannia canicularis* リンネ（Linnaeus））、*F. femoralis* ステイン（Stein）など）、サシバエ（*Stomoxys calcitrans* リンネ（Linnaeus））、イエバエの一種（face fly）、ノサシバエ、クロバエ（*Chrysomya* spp.、*Phormia* spp.）および他のイエバエ（muscoïd）害虫、アブ（*Tabanus* spp. など）、ウマバエ（*Gastrophilus* spp.、*Oestrus* spp. など）、ウシバエ（*Hypoderma* spp. など）、メクラアブ（*Chrysops* spp.）、ヒツジシラミバエ（*Melophagus ovinus* リンネ（Linnaeus））など）ならびに他の短角亜目、カ（*Aedes* spp.、*Anopheles* spp.、*Culex* spp. など）、ブユ（*Prosimulium* spp.、*Simulium* spp. など）、クロヌカカ、スナバエ、sciarids および他の長角亜目をはじめとする双翅目の成虫および幼若虫；ネギアザミウマ（*Thrips tabaci* リンデマン（Lindeman））および他の食葉性アザミウマをはじめとする総翅目の成虫および幼若虫；アリ（アカオオアリ（*Camponotus ferrugineus* ファブリシウス（Fabricius））、クロオオアリ（*Camponotus pennsylvanicus* デ・ギーア（De Geer））、イエヒメアリ（*Monomorium pharaonis* リンネ（Linnaeus））、チビヒアリ（*Wasmannia auropunctata* Roger）、アカカミアリ（*Solenopsis geminata* ファブリシウス（Fabricius））、ヒアリ（*Solenopsis invicta* ブレン（Buren））、アルゼンチンアリ（*Iridomyrmex humilis* メイル（Mayr））、アシナガキアリ（*Paratrechina longicornis* ラトレイル（Latreille））、トビイロシワアリ（*Tetramorium caespitum* リンネ（Linnaeus））、ヒメトビイロケアリ（*Lasius alienus* フォースター（Forster））、コヌカアリ（*Tapinoma sessile* セイ（Say）））、ハチ（クマバチを含む）、スズメバチ（hornet）、スズメバチ（yellow jacket）、大形のハチ（wasp）をはじめとするハチ目の昆虫害虫；ミゾガシラシロアリ（*Reticulitermes flavipes* コラー（Kollar））、セイヨウシロアリ（*Reticulitermes hesperus* バンクス（Banks））、イエシロアリ（*Coptotermes formosanus* シラキ（Shiraki））、ハワイシロアリ（*Incisitermes immigrans* シンダー（Snyder））および他の経済的観点から重要であるシロアリなどのシロアリ目の昆虫害虫；セイヨウシミ（*Lepisma saccharina* リンネ（Linnaeus））、マダラシミ（*Therm*

obia domestica パッカード (Packard)) などのシミ目の昆虫害虫; コロモジラミ (Pediculus humanus capitis デ・ギアー (De Geer))、アタマジラミ (Pediculus humanus humanus リンネ (Linnaeus))、ニワトリハジラミ (Menacanthus stramineus ニッツ (Nitszsch))、イヌハジラミ (Trichodectes canis デ・ギアー (De Geer))、fluff louse (Goniocotes gallinae デ・ギアー (De Geer))、ヒツジハジラミ (Bovicola ovis シュランク (Schrank))、ウシジラミ (short-nosed cattle louse) (Haematopinus eurysternus ニッツ (Nitszsch))、ウシジラミ (long-nosed cattle louse) (Linognathus vituli リンネ (Linnaeus)) ならびに、人間や動物につく他の吸血シラミおよびハジラミを含むハジラミ目の昆虫害虫; ケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis ロッシュチャイルド (Rothschild))、ネコノミ (Ctenocephalides felis ブーシュ (Bouche))、イヌノミ (Ctenocephalides canis カーティス (Curtis))、ニワトリノミ (Ceratophyllus gallinae シュランク (Schrank))、ニワトリフトノミ (Echidnophaga gallinacea ウェストウッド (Westwood))、ヒトノミ (Pulex irritans リンネ (Linnaeus)) および人間や鳥を悩ます他のノミを含むノミ目の昆虫害虫があげられる。包含されるさらに他の節足動物害虫として、ドクイトグモ (Loxosceles reclusa グレッチュおよびミュレイク (Gertsch & Mulaik)) ならびにクロゴケグモ (Latrodectus mactans ファブリシウス (Fabricius)) などのクモ目のクモ、イエムカデ (Scutigera coleoptrata リンネ (Linnaeus)) などの唇脚綱ゲジ目のムカデがあげられる。活性には、経済的観点から重要な農業害虫 (すなわち、ネコブセンチュウ属の根こぶ線虫、ネグサレセンチュウ属の根ぐされ線虫、ユミハリセンチュウ属のユミハリ線虫など) ならびに動物および人間の健康を害する害虫 (すなわち、経済的観点から重要なあらゆる吸虫、条虫および回虫であり、ウマの普通円虫 (Strongylus vulgaris)、イヌの犬回虫 (Toxocara canis)、ヒツジの捻転胃虫 (Haemonchus contortus)、イヌの犬糸状虫 (Dirofilaria immitis レイディ (Leidy))、ウマの葉状条虫 (Anoplocephala perfoliata)、反芻動物の肝蛭虫 (Fasciola hepatica リンネ (Linnaeus)) など) などであるがこれに限定されるものではない、円虫目、回虫目、蟯虫目、ラブジチダ目、センビセンチュウ目、エノプルス目の経済的観点から重要な虫類をはじめとする、線虫綱、条虫綱、吸虫綱および鉤頭動物門の虫類も含まれる。

【0363】

本発明の化合物は、鱗翅目 (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 (Cnaphalocrosis medinalis Guenee)、ハムシモドキの幼虫 (Crambus caliginosellus Clemens)、シバツトガ (Crambus teterrellus Zincken)、コドリंगा (Cydia pomonella Linnaeus)、ミスジアオリंगा (Earias insulana Boisduval)、クサオビリンガ (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

alicarsialis Walker)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller)、ワタアカミムシ (*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) など) の害虫に対して特に高い活性を示す。また、本発明の化合物は、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 dirrhodum* 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 Fonscolombe) およびミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricida* 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 & Perring)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri* Ashmead) およびオンシツコナジラミ (*Trialeturodes vaporariorum* Westwood)、ジャガイモヒメヨコバイ (*Empoasca fabae* Harris)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus* Fallen)、フタテンヨコバイ (*Macrolestes quadrilineatus* Forbes)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps* Uhler)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus* 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 (*Sogatodes orizicola* Muir)、シロリンゴヨコバイ (*Typhlocyba pomaria* McAtee)、チマダラヒメヨコバイ (*Erythroneoura* spp.)、十七年ゼミ (*Magcicada septendecim* Linnaeus)、イセリヤカイガラムシ (*Icerya purchasi* Maskell)、サンホゼカイガラムシ (*Quadraspidiotus perniciosus* 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* spp.)、ヨーロッパナシキジラミ (*Cacopsylla pyricola* Foerster)、カキキジラミ (*Trioza diospyri* Ashmead)を含む同翅目の虫類に対して商業的に有用な活性を有する。これらの化合物は、
 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)、コットンレーズバグ (*Corythuca gossypii* Fabricius)、トマトバグ (*Cyrtopeltis modesta* Distant)、アカホシカメムシ (*Dysdercus suturellus* Herrich-Schaeffer)、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 Beauvois)、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)を含む半翅目の虫類に対する活性も有する。本発明の化合物で防除される他の昆虫目としては、総翅目 (ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis* Pergande)、ミカンアザミウマ (*Scirtothrips 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 など; 鞘翅目 (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など) があげられる。

【0364】

本発明の化合物については、殺虫剤、殺真菌剤、殺線虫剤、殺菌剤、ダニ駆除剤、発根促進剤などの成長調節剤、不妊化剤、セミオケミカル、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激剤、他の生物学的に活性な化合物または昆虫病原性細菌、ウイルスまたは真菌をはじめとする1またはそれ以上の他の生物学的に活性な化合物または薬剤と混合し、農業用途でのスペクトルをさらに広くする多成分病虫害防除剤を製造することが可能である。よって、本発明の組成物はさらに、少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物 (compound) または薬剤を生物学的に有効な量で含み得る。本発明の化合物の製剤化に用いることのできる上記のような生物学的に活性な化合物または薬剤の一例として、アバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、エバーメクチン、アザジラクチン、アジノホスーメチル、ピフェントリン、ビンフェナゼート (bifenazate)、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、クロルピリホスーメチル、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、エンドスルファン、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、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルシトリネート、ターフルバリネート、フルフェノクスロン、フェノホス、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、イソフェンホス、ルフエヌロン、マラチオン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メソミル、メソプレン、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、オキサミル、パラチオン、パラチオンーメチル、ペルメトリン、フォレート、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、スルプロホス、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、チオスルタップーナトリウム、トラロメトリン、トリクロルホン、トリフルムロンなどの殺虫剤；アシベンゾラル、アゾキシストロビン、ベノミル、ブラストサイジン－S、ボルドー液（三塩基性硫酸銅）、ブロムコナゾール、カルプロパミド、カプタホール、キャプタン、カルベンダゾール、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（RH 7281）、ジクロシメット（S－2900）、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（RP 407213）、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、エディフェンホス、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、フェンプロコナゾール、フェンカラミド（SZX0722）、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、フルメトヴァー（flumetover）（RPA 403397）、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトラニル、フルトリアフォル、フォルペット、ホセチルーアルミニウム、フララキシル、フラメタピル（furametapyr）（S－82658）、ヘキサコナゾール、イプロコナゾール、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、ネオアソジン（メタンアルソン酸鉄）、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、プロクロラズ、プロパモカルブ、プロピコナゾール、ピリフェノックス、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、チオフアネート－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、ビンクロゾリンなどの殺真菌剤；アルジカルブ、オキサミル、フェナミホスなどの殺線虫剤；ストレプトマイシンなどの殺菌剤；アミトラズ、キノメチオネート、クロルベンジレート、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、酸化フェンブタズ、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、テブフェンピラドなどのダニ駆除剤；aizawaiおよびkurstakiの種を含むバチルス・チューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）、バチルス・チューリングゲンシスのδ内毒素、バキュロウイルス、昆虫病原性細菌、ウイルスおよび真菌などの生物剤があげられる。

10

20

30

40

【0365】

農業用防除剤の概要が記載された参考文献のひとつに、Pesticide Manual、第12版、C. D. S. トムリン（Tomlin）編、British Crop Protection Council、Farnham、サリー（Surrey）、U. K.、2000がある。

【0366】

50

注目すべきなのは、アバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、アミドフルメト、エバーメクチン、アザジラクチン、アジノホスーメチル、ビフェントリン、ビンフェナゼート、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、クロルピリホスーメチル、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、エンドスルファン、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、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルシトリネート、 τ -フルバリネート、フルフェノクスロン、フェノホス、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、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メソミル、メソプレン、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、オキサミル、パラチオン、パラチオンーメチル、ペルメトリン、フォレート、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、スルプロホス、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、チオスルタッブーナトリウム、トラロメトリン、トリクロルホンおよびトリフルムロン、アルジカルブ、オキサミル、フェナミホス、アミトラズ、キノメチオネート、クロルベンジレート、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、酸化フェンブタスズ、フェン
 10
 20
 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、テブフェンピラド、a i z a w a i および k u r s t a k i の種を含むバチルス・チューリンゲンシス、バチルス・チューリンゲンシスの δ 内毒素、バキュロウイルスおよび昆虫病原性細菌、ウイルスおよび真菌よりなる群から選択される別の生物学的に活性な化合物または薬剤を（式 I の成分および界面活性剤および／または希釈剤に加えて）少なくとも 1 種含む組成物である。

【0367】

本発明の化合物と混合するのに好ましい殺虫剤およびダニ駆除剤としては、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、トラロメトリンなどのピレスロイド；フェノチカルブ、メソミル、オキサミル、チオジカルブなどのカルバメート；クロチアニジン、イミダクロプリド、チアクロプリドなどのネオニコチノイド、インドキサカルブなどの神経ナトリウムチャンネル遮断剤、スピノサド、アバメクチン、エバーメクチン、エマメクチンなどの殺虫性大環状ラクトン；エンドスルファン、エチプロール、フィプロニルなどの γ -アミノ酪酸（GABA）拮抗剤；フルフェノクスロン、トリフルムロンなどの殺虫性尿素、ジオフェノラン、ピリプロキシフェンなどの幼若ホルモンミミック；ピメトロジン；アミトラズがあげられる。本発明の化合物と混合するのに好ましい生物剤としては、バチルス・チューリンゲンシスおよびバチルス・チューリンゲンシスの δ 内毒素ならびに、バキュロウイルス科のメンバを含む天然ウイルス殺虫剤および遺伝子組換えウイルス殺虫剤ならびに食虫性真菌があげられる。
 30
 40

【0368】

最も好ましい混合物としては、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ソミルとの混合物；本発明の化合物とイミダクロプリドとの混合物；本発明の化合物とチアクロプリドとの混合物；本発明の化合物とインドキサカルブとの混合物；本発明の化合物とアバメクチンとの混合物；本発明の化合物とエンドスルファンとの混合物；本発明の化合物とエチプロールとの混合物；本発明の化合物とフィプロニルとの混合物；本発明の化合物とフルフェノクスロンとの混合物；本発明の化合物とピリプロキシフェンとの混合物；本発明の化合物とピメトロジンとの混合物；本発明の化合物とアミトラズとの混合物；本発明の化合物とバチルス・チューリンゲンシスとの混合物、本発
 50

明の化合物とバチルス・チューリンゲンシスの δ 内毒素との混合物があげられる。

【0369】

特定の場合において、制御スペクトルは同様であるが作用機構の異なる他の無脊椎有害生物防除化合物または薬剤同士を組み合わせると耐性管理の点で特に都合がよいことがある。よって、本発明の組成物はさらに、制御スペクトルは同様であるが作用機構の異なる少なくとも1種の追加の無脊椎有害生物防除化合物または薬剤を生物学的に有効な量で含み得る。植物保護化合物（タンパク質など）を発現するように遺伝子修飾した植物または植物のローカスを生物学的に有効な量の本発明の化合物に接触させることで、植物保護のスペクトルをさらに広げることが可能であり、耐性管理の点で有利なものとなり得る。

【0370】

農業および／または非農業での加害部位を含む害虫の環境や保護対象となる領域に、あるいは防除対象としたい害虫に対して直接に、1またはそれ以上の本発明の化合物を有効量で施用することで、農業および非農業の用途で無脊椎有害生物を防除する。よって、本発明はさらに、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1またはそれ以上の本発明の化合物と接触させるか、あるいはこのような化合物を少なくとも1種含有する組成物と接触させる、あるいは少なくとも1種のこのような化合物と有効量の少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤とを含有する組成物と接触させることを含む、無脊椎有害生物を防除するための方法を含む。本発明の化合物と有効量の少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤とを含有する好適な組成物の例として、別の生物学的に活性な化合物または薬剤が本発明の化合物と同一の顆粒に含まれるか、本発明の化合物とは別の顆粒に含まれる粒状組成物があげられる。

10

20

【0371】

好ましい接触方法のひとつに噴霧による方法がある。あるいは、本発明の化合物を含む粒状組成物を植物の枝葉または土壤に施用してもよい。また、液体製剤の土壤用ドレンチ、土壤向け粒状製剤、育苗箱処理剤または移植苗の浸漬剤で施用される本発明の化合物を含む組成物に植物を接触させることで、この植物による取り込みを通して本発明の化合物が効果的に送達される。加害部位に本発明の化合物を含む組成物を局所的に施用する方法でも化合物の効果が得られる。他の接触方法として、直接スプレーおよび残留性スプレー、空中散布、ゲル、種子コーティング、マイクロカプセル化、全身摂取、誘引餌、耳標、塊葉、噴霧剤、薰蒸剤、エーロゾル、微粉末のほか多くの方法による、本発明の化合物または組成物の施用があげられる。また、無脊椎動物防除装置（昆虫用ネットなど）の製造用資材に本発明の化合物を含浸させてもよい。

30

【0372】

本発明の化合物については、無脊椎動物が食べる誘引餌に混入させたり、罠などの装置内に入れておくことが可能である。極めて低い施用率、特に直接に触れるのではなく体内に取り込むことで致死量となる用量の活性成分で土壤の昆虫を防除するにあたっては、0.01～5%の活性成分と、0.05～10%の保水剤（単数または複数）と、40～99%の野菜粉とを含む顆粒または誘引餌が効果的である。

【0373】

本発明の化合物は純粋な状態で施用可能なものであるが、企図した最終用途に応じて場合によっては食物との併用で、好適な担体、希釈剤、界面活性剤の1以上の化合物を含む製剤の形で施用が最も多い。好ましい施用方法には、この化合物の水分散液または精油液を噴霧することがある。スプレーオイル、スプレーオイル濃縮物、スプレッドスティッカー（spreader sticker）、アジュバント、他の溶媒ならびに、ピペロニルブトキシドなどの相乗剤と併用することで、化合物の効力が高められることも多い。

40

【0374】

効果的に防除するのに必要な施用率（すなわち「生物学的に有効な量」）は、防除対象となる無脊椎動物の種、害虫のライフサイクル、ライフステージ、その大きさ、場所、時節、宿主作物または動物、摂食挙動、交尾の挙動、周囲の湿度、温度などの要因に左右される。通常の条件下では、農業用エコシステムでの害虫防除には1ヘクタールあたり活性成

50

分約 0.01 から 2 kg の施用率で十分であるが、0.0001 kg / ヘクタールと少量で十分なこともあれば、8 kg / ヘクタールが必要なこともある。非農業用途では、効果的な使用率は約 1.0 から 50 mg / 平方メートルの範囲であるが、0.1 mg / 平方メートルと少ない量で十分なこともあれば、150 mg / 平方メートルが必要なこともある。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は、当業者であれば容易に判断できるものである。

【0375】

以下に示す本発明の生物学的実施例での試験は、特定の節足動物害虫から植物を保護する本発明による方法の効果を示すものである。「防除効力」とは、摂食を有意に低減させる節足動物の発達の阻害を表す（死亡率を含む）。しかしながら、これらの化合物によって得られる害虫防除保護性はこれらの種に限定されるものではない。化合物の内訳に関してはインデックステーブル A を参照のこと。以下のインデックステーブルでは、次のような略号を使用する。t は第 3 級、n はノルマル、i はイソ、s は第 2 級、c はシクロ、Me はメチル、Et はエチル、Pr はプロピル、Bu はブチルである。したがって、i-Pr はイソプロピル、s-Bu は第 2 級ブチルといった具合である。略号「Ex.」は「実施例」の意味であり、これに続く数字はどの実施例で化合物を調製するかを示している。

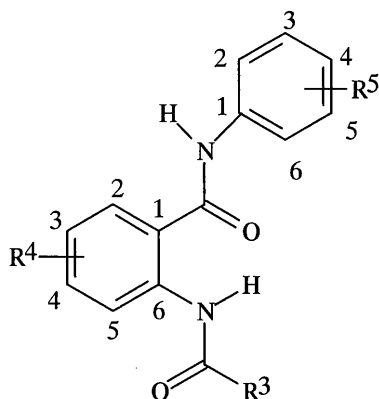
10

【0376】

【表 186】

索引表 A

20



30

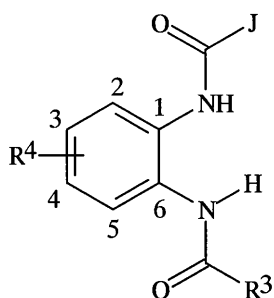
化合物	R ³	R ⁴	R ⁵	融点(℃)
1	<i>t</i> -Bu	H	2,3- <i>di</i> Me	208-209
2	<i>i</i> -Pr	H	4-OCF ₃	160-161
3 (実施例 4)	<i>i</i> -Pr	5-Cl	4-OCF ₃	230-233
4	Me	5-Me	4-OCF ₃	224-225
5	Me	5-Me	2-Me,4-Cl	114-116
6	<i>i</i> -Pr	5-Cl	2-Me,4-Cl	>250
7 (実施例 3)	<i>i</i> -Pr	2-Me	2-Me,4-OCF ₃	230
8	<i>t</i> -Bu	2-Me	2-Me,4-OCF ₃	200-203
9 (実施例 2)	<i>i</i> -Pr	2-Me	2-Me,4-CF ₃	230
10	<i>i</i> -Pr	5-NO ₂	4-CF ₃	固形分
11	4-CF ₃ -Ph	5-Me	2-Me	>250

40

【0377】

【表 187】

索引表 B



化合物	R ³	R ⁴	J	融点 (°C)
12	<i>t</i> -Bu	H	2,3- <i>di</i> Me-Ph	161-164
13	<i>t</i> -Bu	H	2-CF ₃ -Ph	173-174
14	<i>i</i> -Pr	H	2,4-F-Ph	148
15	<i>i</i> -Pr	H	2,3- <i>di</i> Me-Ph	169-171
16	<i>t</i> -Bu	H	2,4- <i>di</i> F-Ph	146-149
17	<i>i</i> -Pr	5-Me	2,3- <i>di</i> Me-Ph	202-205
18	<i>i</i> -Pr	5-Me	2,6- <i>di</i> Cl-Ph	230
19	<i>i</i> -Pr	5-Me	2,4- <i>di</i> F-Ph	196
20	Me	H	2-F-Ph	固形分
21	<i>i</i> -Pr	5-Cl	2-Me,4-Cl,6-NC(O)CF ₃	203
22	<i>i</i> -Pr	5-Cl	2-Me,4-Cl,6-NC(O)CH ₃	>250
23	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-CF ₃ -Ph	固形分
24	<i>t</i> -Bu	5-Me	2-F,5-CF ₃ -Ph	固形分
25	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-CF ₃ -Ph	固形分
26	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-OCF ₃ -Ph	固形分
27	<i>i</i> -Pr	5-Me	4-CF ₃ -Ph	固形分
28	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-CF ₃ -Ph	固形分
29	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-CF ₃ -Ph	固形分
30	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-OCF ₃ -Ph	固形分
31	<i>i</i> -Pr	5-Me	2-F,5-CF ₃ -Ph	固形分
32	<i>i</i> -Pr	5-Me	4-OCF ₃ -Ph	固形分
33	<i>i</i> -Pr	5-Me	4-CF ₃ -Ph	固形分
34	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-CF ₃ -Ph	固形分

10

20

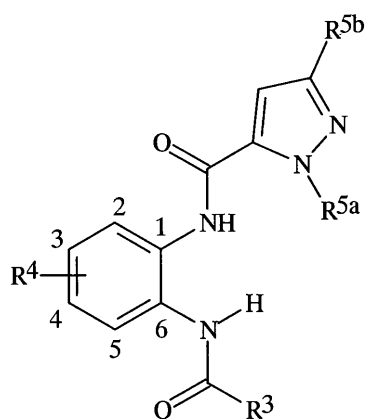
30

40

【 0 3 7 8 】

【 表 1 8 8 】

索引表 C

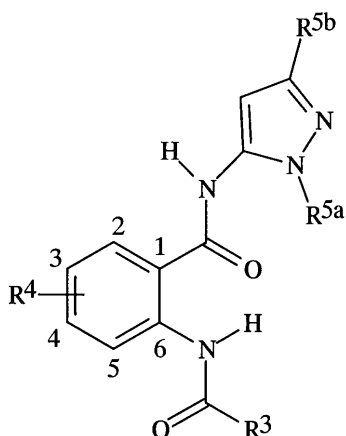


化合物	R ³	R ⁴	R ^{5a}	R ^{5b}	融点 (°C)
35 (実施例 1)	<i>i</i> -Pr	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	固形分
36	Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	204-205
37 (実施例 6)	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	219-220
38	NHEt	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	185-186
39	NHi-Pr	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	191-192
40	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	205-206
41	Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Cl	201-202
42	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Cl	229-230
43	NHEt	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Cl	187-188
44	NHi-Pr	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Cl	195-196
45	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Cl	201-202
46	Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Br	176-177
47	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Br	237-238
48	NHEt	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Br	176-177
49	NHi-Pr	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Br	192-193
50	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	Br	196-197
51	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-ピリジル	Br	190-191
52	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-ピリジル	Cl	185-186
53 (実施例 5)	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	215-217
54	Me	2-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	167-168

【 0 3 7 9 】

【 表 1 8 9 】

索引表 D



10

化合物	R ³	R ⁴	R ^{5a}	R ^{5b}	融点 (°C)
55	Me	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	194-195
56	<i>i</i> -Pr	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	244-246
57	<i>t</i> -Bu	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	260
58	Et	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	236-237
59	<i>i</i> -Pr	2-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	203-205
60	<i>t</i> -Bu	2-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	232-233
61	Et	2-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	170-172
62	Me	2-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	212-213
63	Me	5-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	192-193
64	Me	2-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	236
65 (実施例 7)	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-ピリジル	CF ₃	198

20

30

【0380】

発明の生物学的実施例
試験

コナガ (*Plutella xylostella*) の防除を評価するために、12～14日目のハツカダイコンの苗を入れた小さな蓋のない容器で試験ユニットを構成した。何匹もの幼虫を育てている硬質の昆虫餌シートから、コアサンプラーを利用して一部を柱状に採取し、昆虫餌の上にいる10～15匹の第一齢幼虫で苗をあらかじめ加害し、幼虫を含む柱状部分と餌とを試験ユニットに移した。柱状に採取した餌を完全に乾燥させると、幼虫は試験苗に移動した。

40

【0381】

被験化合物については、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、イソプロパノールを含有するX-77^(R) スプレッダー・ロ・フォーム・フォーミュラ (Spreader Lo-Foam Formula) 非イオン界面活性剤 (ラブランド・インダストリーズ・インコーポレイテッド (Loveland Industries, Inc.)) 300 ppmとを含有する溶液を用いて組成した。組成した化合物を、1/8 JJカスタムボディ (スプレーイング・システムズ・カンパニー (Spraying Systems Co.)) を各試験ユニットの1.27 cm (0.5インチ) 上に設けたS U J 2噴霧器のノズルを使って1 mLの液体で施用した。このスクリーンで実験した化合物についてはいずれも50 ppmで噴霧し

50

、3回繰り返した。組成した被験化合物の噴霧後、各試験ユニットを1時間かけて乾燥させ、一番上に黒色の網を張ったキャップをのせた。栽培室の中で25℃で相対湿度70%にて試験ユニットを6日間保持した。苗の摂食による被害を目視で評価した。

【0382】

試験の対象となった化合物のうち、11、37、39、43、47、48、51、52、53および63で優れたレベルの苗保護性（摂食による被害が30%またはそれ以下）が得られた。

【国際公開パンフレット】

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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
3 April 2003 (03.04.2003)

PCT

(10) International Publication Number
WO 03/026415 A2

(51) International Patent Classification: A01N

(21) International Application Number: PCT/US02/29468

(22) International Filing Date:
17 September 2002 (17.09.2002)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/324,083 21 September 2001 (21.09.2001) US(71) Applicant (for all designated States except US): E.I. DU
PONT DE NEMOURS AND COMPANY [US/US]; 1007
Market Street, Wilmington, DE 19898 (US).

(72) Inventors: and

(73) Inventors/Applicants (for US only): LAHM, George,
Philip [US/US]; 148 Fairhill Drive, Wilmington, DE
19808 (US). SELBY, Thomas, Paul [US/US]; 116 Hunter
Court, Wilmington, DE 19808 (US).(74) Agent: HEISER, David, E.; E.I. du Pont de Nemours and
Company, Legal Patent Records Center, 4417 Lancaster
Pike, Wilmington, DE 19805 (US).(81) Designated States (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GH,
GM, GU, HT, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,
MX, MY, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE,
SG, SI, SK, SL, SM, SN, SR, ST, SV, SZ, TD, TH,
TI, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) Designated States (regional): ARIPO patent (GH, GM,
KE, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, HU, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK,
TR), OAPI patent (BF, BJ, CI, CG, CO, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, NG, SN, TD, TG).

Declarations under Rule 4.17:

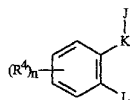
— as to applicant's entitlement to apply for and be granted
a patent (Rule 4.17(ii)) for the following designations: AE,
AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI,
GB, GD, GH, GM, GU, HT, IL, IN, IS, JP, KE, KG,
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MY, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SD,
SE, SG, SI, SK, SL, SM, SN, SR, ST, SV, SZ, TD, TH,
TI, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW; ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SI,
SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ,
MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ,
DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IT, LU, MC, NL, PT, SE,
SK, TR), OAPI patent (BF, BJ, CI, CG, CO, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, NG, SN, TD, TG).— as to the applicant's entitlement to claim the priority of the
earlier application (Rule 4.17(iii)) for all designations
of inventorship (Rule 4.17(iv)) for US only

Published:

without international search report and to be republished
upon receipt of that reportFor two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: INSECTICIDAL DIAMIDES

WO 03/026415 A2



(I)

(57) Abstract: This invention pertains to a method for controlling an invertebrate pest comprising contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a compound of Formula I including all geometric and stereoisomers, N-oxides and agriculturally suitable salts thereof (e.g. in a composition comprising a compound of Formula I) wherein J is a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is optionally substituted with 1 to 4 R₂'s; K is C(=O)NR₂ or NR₂C(=O); L is NR₂1'C(=O)R₂ or NR₂1'SO₂R₂; R₂ is as defined in the disclosure. Also disclosed are certain compositions for controlling an invertebrate pest comprising a biologically effective amount of a compound of Formula I, an N-oxide thereof or an agriculturally suitable salt thereof. Also disclosed are certain compounds of Formula I, N-oxides and agriculturally suitable salts thereof.

WO 03/026415

PCT/US02/29468

TITLE

INSECTICIDAL DIAMIDES

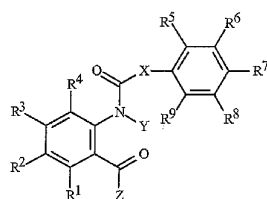
FIELD OF THE INVENTION

5 This invention relates to certain diamides, their *N*-oxides, agriculturally suitable salts and compositions, and methods of their use for controlling invertebrate pests in both agronomic and nonagronomic environments.

BACKGROUND OF THE INVENTION

The control of invertebrate pests such as arthropods is extremely important in achieving high crop efficiency. Damage by invertebrate pests to growing and stored
10 agronomic crops can cause significant reduction in productivity and thereby result in increased costs to the consumer. The control of invertebrate pests in forestry, greenhouse crops, ornamentals, nursery crops, stored food and fiber products, livestock, household, and public and animal health is also important. Many products are commercially available for these purposes, but the need continues for new compounds that are more effective, less
15 costly, less toxic, environmentally safer or have different modes of action.

NL 9202078 discloses *N*-acyl anthranilic acid derivatives of Formula i as insecticides



i

wherein, inter alia,

- X is a direct bond;
- 20 Y is H or C₁-C₆ alkyl;
- Z is NH₂, NH(C₁-C₃ alkyl) or N(C₁-C₃ alkyl)₂; and
- R¹ through R⁹ are independently H, halogen, C₁-C₆ alkyl, phenyl, hydroxy, C₁-C₆ alkoxy or C₁-C₇ acyloxy.

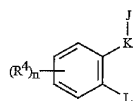
U.S. Patent 3,907,892 discloses certain N-fluoroalkanoyl-*o*-phenylenediamines as
25 insecticides.

WO 03/026415

PCT/US02/29468

SUMMARY OF THE INVENTION

This invention involves compounds of Formula I (including all geometric and stereoisomers) *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof



I

5 wherein

J is a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is optionally substituted with 1 to 4 R⁵;

K is —C(=A)NR²— or —NR²C(=A)—;

10 L is —NR¹C(=B)—R³ or —NR¹SO₂—R³;

A and B are independently O or S;

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

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

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

R³ is C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl, each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl, C₃-C₆ trialkylsilyl, phenyl, phenoxy and 5- or 6-membered heteroaromatic rings, each phenyl, phenoxy and 5- or 6-membered heteroaromatic ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R⁶, C₁-C₄ alkoxy; C₁-C₄ alkylamino; C₂-C₈

WO 03/026415

PCT/US02/29468

dialkylamino; C₁-C₄ alkoxy(C₁-C₄ alkyl)amino; C₃-C₆ cycloalkylamino; C₂-C₆ alkoxy carbonyl or C₂-C₆ alkyl carbonyl; or

R¹ and R³ can be taken together with -NC(=B)- or -NSO₂- moiety to which they are attached to form a ring comprising 2 to 6 atoms of carbon and optionally one additional atom of nitrogen, sulfur or oxygen, said ring optionally substituted with 1 to 4 substituents selected from the group consisting of C₁-C₂ alkyl, halogen, CN, NO₂ and C₁-C₂ alkoxy;

each R⁴ is independently H, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₃-C₆ trialkylsilyl, or a phenyl ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R⁶;

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

each R⁵ is independently a phenyl, benzyl, benzoyl, phenoxy, 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system, each phenyl, benzyl, benzoyl, phenoxy, heteroaromatic ring and aromatic fused heterobicyclic ring system optionally substituted with one to three substituents independently selected from R⁶; or

two R⁵ groups when attached to adjacent carbon atoms can be taken together as -OCF₂O-, -CF₂CF₂O- or -OCF₂CF₂O-;

each R⁶ is independently C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C₂-C₄ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₃-C₆ (alkyl)cycloalkylamino, C₂-C₄ alkyl carbonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl or C₃-C₆ trialkylsilyl; and

WO 03/026415

PCT/US02/29468

n is 1, 2, 3 or 4;

provided that L is other than —NHC(=O)— and R^3 is other than $\text{C}_1\text{—C}_6$ alkyl substituted with one or more fluorine moieties.

A method is provided for controlling an invertebrate pest comprising contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a compound of Formula I, an *N*-oxide thereof or an agriculturally suitable salt thereof (e.g., as a composition described herein).

This invention also provides a composition for controlling an invertebrate pest comprising a biologically effective amount of a compound of Formula I, an *N*-oxide thereof or an agriculturally suitable salt thereof; and at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents.

This invention also provides a composition comprising a biologically effective amount of a compound of Formula I, an *N*-oxide thereof or an agriculturally suitable salt thereof; and an effective amount of at least one additional biologically active compound or agent.

This invention also provides compounds of Formula I (including all geometric and stereoisomers), *N*-oxides or agriculturally suitable salts thereof, wherein

each R^5 is R^{5a} or R^{5b} ;

J is a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is substituted with R^{5a} and optionally substituted with 1 to 3 R^{5b} ;

K is $\text{—C(=A)NR}^2\text{—}$ or $\text{—NR}^2\text{C(=A)—}$;

L is $\text{—NR}^1\text{C(=B)—R}^3$ or $\text{—NR}^1\text{SO}_2\text{—R}^3$;

A and B are independently O or S;

R^1 is H or $\text{C}_1\text{—C}_4$ alkyl;

R^2 is H or $\text{C}_1\text{—C}_4$ alkyl;

R^3 is $\text{C}_1\text{—C}_4$ alkyl optionally substituted with halogen, CN, OCH_3 , or $\text{S(O)}_p\text{CH}_3$;

R^{5a} and R^{5b} are each independently $\text{C}_1\text{—C}_4$ alkyl, $\text{C}_1\text{—C}_4$ haloalkyl, halogen, CN, NO_2 , $\text{C}_1\text{—C}_4$ alkoxy, $\text{C}_1\text{—C}_4$ haloalkoxy, $\text{C}_1\text{—C}_4$ alkylthio, $\text{C}_1\text{—C}_4$ alkylsulfinyl, $\text{C}_1\text{—C}_4$ alkylsulfonyl, $\text{C}_1\text{—C}_4$ haloalkylthio, $\text{C}_1\text{—C}_4$ haloalkylsulfinyl, $\text{C}_1\text{—C}_4$ haloalkylsulfonyl, $\text{C}_2\text{—C}_4$ alkoxycarbonyl or $\text{C}_3\text{—C}_8$ dialkylaminocarbonyl; or a phenyl, benzyl, or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each phenyl, benzyl, and heteroaromatic ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R^6 ;

R^{5a} is attached to the J at a position *ortho* to K;

WO 03/026415

PCT/US02/29468

each R⁶ is independently halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ haloalkoxy; and

p is 0, 1 or 2; provided that L is other than —NHC(=O)— and R³ is other than C₁-C₆ alkyl substituted with one or more fluorine moieties.

DETAILS OF THE INVENTION

In the above recitations, the term "alkyl", used either alone or in compound words such as "alkylthio" or "haloalkyl" includes straight-chain or branched alkyl, such as, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, or the different butyl, pentyl or hexyl isomers. "Alkenyl" includes straight-chain or branched alkenes such as 1-propenyl, 2-propenyl, and the different butenyl, pentenyl and hexenyl isomers. "Alkenyl" also includes polyenes such as 1,2-propadienyl and 2,4-hexadienyl. "Alkynyl" includes straight-chain or branched alkynes such as 1-propynyl, 2-propynyl and the different butynyl, pentynyl and hexynyl isomers. "Alkynyl" can also include moieties comprised of multiple triple bonds such as 2,5-hexadiynyl.

"Alkoxy" includes, for example, methoxy, ethoxy, *n*-propyloxy, isopropyloxy and the different butoxy, pentoxy and hexyloxy isomers. "Alkoxyalkyl" denotes alkoxy substitution on alkyl. Examples of "alkoxyalkyl" include CH₃OCH₂, CH₃OCH₂CH₂, CH₃CH₂OCH₂, CH₃CH₂CH₂OCH₂ and CH₃CH₂OCH₂CH₂. "Alkylthio" includes branched or straight-chain alkylthio moieties such as methylthio, ethylthio, and the different propylthio, butylthio, pentylthio and hexylthio isomers. "Cycloalkyl" includes, for example, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl and cyclohexyl.

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

aromatic (where aromatic indicates that the Hückel rule is satisfied). The term "fused heterobicyclic ring system" includes a ring system comprised of two fused rings in which at least one ring atom is not carbon and can be aromatic or non aromatic, as defined above.

The term "halogen", either alone or in compound words such as "haloalkyl", includes
 5 fluorine, chlorine, bromine or iodine. Further, when used in compound words such as "haloalkyl", said alkyl may be partially or fully substituted with halogen atoms which may be the same or different. Examples of "haloalkyl" include F_3C , $ClCH_2$, CF_3CH_2 and CF_3CCl_2 . The terms "haloalkenyl", "haloalkynyl", "haloalkoxy", and the like, are defined analogously to the term "haloalkyl". Examples of "haloalkenyl" include $(Cl)_2C=CHCH_2$
 10 and $CF_3CH_2CH=CHCH_2$. Examples of "haloalkynyl" include $HC\equiv CCHCl$, $CF_3C\equiv C$, $CCl_3C\equiv C$ and $FCH_2C\equiv CCH_2$. Examples of "haloalkoxy" include CF_3O , CCl_3CH_2O , $HCF_2CH_2CH_2O$ and CF_3CH_2O .

The total number of carbon atoms in a substituent group is indicated by the " C_i-C_j " prefix where i and j are numbers from 1 to 8. For example, C_1-C_3 alkylsulfonyl designates
 15 methylsulfonyl through propylsulfonyl; C_2 alkoxyalkyl designates CH_3OCH_2 ; C_3 alkoxyalkyl designates, for example, $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ or $CH_3CH_2OCH_2$; and C_4 alkoxyalkyl designates the various isomers of an alkyl group substituted with an alkoxy group containing a total of four carbon atoms, examples including $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ and $CH_3CH_2OCH_2CH_2$. In the above recitations, when a compound of
 20 Formula 1 contains a heterocyclic ring, all substituents are attached to this ring through any available carbon or nitrogen by replacement of a hydrogen on said carbon or nitrogen.

When a group contains a substituent which can be hydrogen, for example R^3 , then, when this substituent is taken as hydrogen, it is recognized that this is equivalent to said group being unsubstituted.

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

The present invention comprises compounds selected from Formula I, *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof. One skilled in the art will appreciate that not all nitrogen
 35 containing heterocycles can form *N*-oxides since the nitrogen requires an available lone pair for oxidation to the oxide; one skilled in the art will recognize those nitrogen containing heterocycles which can form *N*-oxides. One skilled in the art will also recognize that tertiary

WO 03/026415

PCT/US02/29468

amines can form *N*-oxides. Synthetic methods for the preparation of *N*-oxides of heterocycles and tertiary amines are very well known by one skilled in the art including the oxidation of heterocycles and tertiary amines with peroxy acids such as peracetic and *m*-chloroperbenzoic acid (MCPBA), hydrogen peroxide, alkyl hydroperoxides such as *t*-butyl hydroperoxide, sodium perborate, and dioxiranes such as dimethyldioxirane. These methods for the preparation of *N*-oxides have been extensively described and reviewed in the literature, see for example: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-19, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 139-151, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; and G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

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

Preferred methods for reasons of better activity and/or ease of synthesis are:

Preferred 1. Methods comprising compounds of Formula I wherein K is

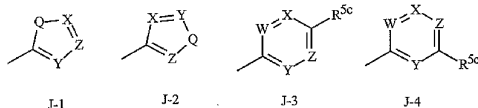
—C(=A)NR²— and A and B are both O.

Preferred 2. Methods comprising compounds of Formula I wherein K is

—NR²C(=A)— and A and B are both O.

Preferred 3. Methods of Preferred 1 or Preferred 2 wherein

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



Q is O, S or NR^{5c};

W, X, Y and Z are independently N or CR^{5c}, provided that in J-3 and J-4 at least one of W, X, Y or Z is N;

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R^1 and R^2 are each independently H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl or C₂-C₆ alkoxy carbonyl;

R^3 is C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₂ alkylthio, C₁-C₂ alkylsulfinyl and C₁-C₂ alkylsulfonyl;

each R^4 is independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl or C₁-C₄ haloalkylsulfonyl;

each R^5 is independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxy carbonyl or C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl; or

each R^5 is independently a phenyl, benzyl or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R^6 ; or

two R^5 groups when attached to adjacent carbon atoms can be taken together as -OCF₂O-, -CF₂CF₂O- or -OCF₂CF₂O-;

R^{5c} is H or R^5 ;

each R^6 is independently C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C₂-C₄ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₃-C₆ (alkyl)cycloalkylamino, C₂-C₄ alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl or C₃-C₆ trialkylsilyl; and

n is 1 or 2.

Preferred 4. Methods of Preferred 3 wherein

each R^5 is R^{5a} or R^{5b} ;

J is substituted with R^{5a} and optionally substituted with 1 to 2 R^{5b} ;

R^1 and R^2 are each independently H or C₁-C₄ alkyl;

R^3 is C₁-C₄ alkyl optionally substituted with halogen, CN, OCH₃, or S(O)_pCH₃;

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R^{5a} group is attached to the J at the position *ortho* to K;

R^{5a} and R^{5b} are each independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen,

CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄

alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄

haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxy carbonyl or

C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl; or a phenyl, benzyl, or a 5- or

6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with

one to three substituents independently selected from R⁶;

each R⁶ is independently halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-

C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄

haloalkoxy; and

p is 0, 1 or 2.

Preferred 5. Methods of Preferred 4 wherein J is phenyl, pyrazole, pyrrole, pyridine or pyrimidine.

Preferred 6. Methods of Preferred 5 wherein

R¹ and R² are each H;

one R⁴ is selected from the group consisting of C₁-C₃ alkyl, CF₃, OCF₃,

OCHF₂, S(O)_pCF₃, S(O)_pCHF₂ and halogen and an optional second R⁴

is selected from the group consisting of halogen, C₁-C₃ alkyl and C₁-C₃

haloalkyl.

Preferred 7. Methods of Preferred 6 wherein

J is J-1;

Q is NR^{5a};

X is N or CH;

Y is CH;

Z is CR^{5b};

R^{5a} is a phenyl or 2-pyridyl ring substituted with one or two substituents

selected from the group consisting of halogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄

haloalkyl or C₁-C₄ haloalkoxy; and

R^{5b} is halogen or CF₃.

The method of this invention includes embodiments which involve contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a composition comprising a compound of Formula I, an *N*-oxide or an agriculturally suitable salt thereof and a biologically effective amount of at least one additional compound or agent for controlling invertebrate pests.

This invention also relates to compositions for controlling an invertebrate pest comprising a biologically effective amounts of a compound of Formula I, an *N*-oxide or an

WO 03/026415

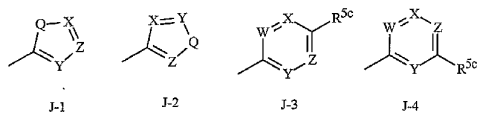
PCT/US02/29468

agriculturally suitable salt thereof and at least one of a surfactant, a solid diluent or a liquid diluent. The preferred compositions of the present invention are those which comprise the compounds of the above preferred methods.

This invention also pertains to certain compounds of Formula I as defined above, including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides or agriculturally suitable salts thereof. The preferred compounds of this invention for reasons of better activity and/or ease of synthesis are:

Preferred A. Compounds of Formula I wherein

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



Q is O, S or NR^{5c};

W, X, Y and Z are independently N or CR^{5c}, provided that in J-3 and J-4 at least one of W, X, Y or Z is N;

R¹ and R² are each independently H or C₁-C₄ alkyl;

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

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

R^{5a} is attached to the J at the position *ortho* to K;

R^{5a} and R^{5b} are each independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxy carbonyl or C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl; or a phenyl, benzyl, or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R⁶;

R^{5c} is H or R^{5a};

WO 03/026415

PCT/US02/29468

each R⁶ is independently halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ haloalkoxy;

n is 1 or 2; and

p is 0, 1 or 2.

Preferred B. Compounds of Preferred A wherein J is phenyl, pyrazole, pyrrole, pyridine or pyrimidine.

Preferred C. Compounds of Preferred B wherein

R¹ and R² are each H;

one R⁴ is selected from the group consisting of C₁-C₃ alkyl, CF₃, OCF₃,

OCHF₂, S(O)_pCF₃, S(O)_pCHF₂ and halogen and an optional second R⁴

is selected from the group consisting of halogen, C₁-C₃ alkyl and C₁-C₃ haloalkyl.

Preferred D. Compounds of Preferred C wherein

J is J-1;

Q is NR^{5a};

X is N or CH;

Y is CH;

Z is CR^{5b};

R^{5a} is a phenyl or 2-pyridyl ring substituted with one or two substituents

selected from the group consisting of halogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄

haloalkyl or C₁-C₄ haloalkoxy; and

R^{5b} is halogen or CF₃.

As noted above, J is a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is optionally substituted with 1 to 4 R⁵. The term "optionally substituted" in connection with these J groups refers to groups which are unsubstituted or have at least one non-hydrogen substituent that does not extinguish the activity for controlling invertebrate pests possessed by the unsubstituted analog. An example of phenyl optionally substituted with 1 to 4 R⁵ is the ring illustrated as U-1 in Exhibit 1, wherein R^v is R⁵ or H and r is an integer from 1 to 4. An example of a naphthyl group optionally substituted with 1 to 4 R⁵ is illustrated as U-85 in Exhibit 1, wherein R^v is R⁵ or H and r is an integer from 1 to 4. Examples of 5- or 6-membered heteroaromatic rings optionally substituted with 1 to 4 R⁵ include the rings U-2 through U-53 illustrated in Exhibit 1 wherein R^v is R⁵ or H and r is an integer from 1 to 4. Note that J-1 through J-4 above also denote 5- or 6-membered heteroaromatic rings. Note that U-2 through U-20 are examples of J-1, U-21 through U-35 and U-40 are examples of J-2, U-41 through U-48 are

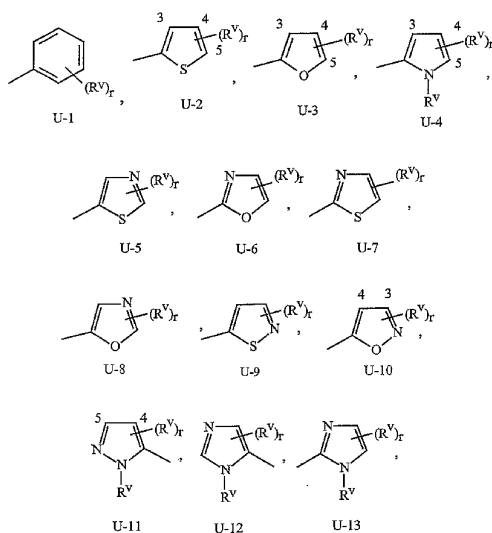
WO 03/026415

PCT/US02/29468

examples of J-3 and U-49 through U-53 are examples of J-4. Examples of aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring systems optionally substituted with 1 to 4 R^5 include U-54 through U-84 illustrated in Exhibit 1 wherein R^5 is R^5 or H and r is an integer from 1 to 4.

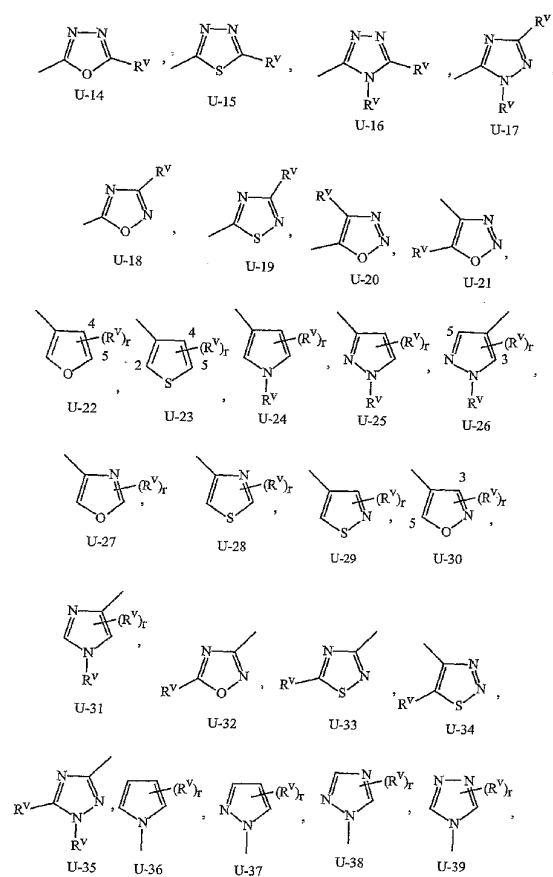
- 5 Although R^v groups are shown in the structures U-1 through U-85, it is noted that they can be H, which is equivalent R^5 to optional not being present. Note that when R^v is H when attached to an atom, this is the same as if said atom is unsubstituted. The nitrogen atoms that require substitution to fill their valence are substituted with H or R^v . Note that some U groups can only be substituted with less than 4 R^v groups (e.g. U-14, U-15, U-18 through U-21 and U-32 through U-34 can only be substituted with one R^v). Note that when the attachment point between $(R^v)_r$ and the U group is illustrated as floating, $(R^v)_r$ can be attached to any available carbon atom of the U group. Note that when the attachment point on the U group is illustrated as floating, the U group can be attached to the remainder of Formula I through any available carbon of the U group by replacement of a hydrogen atom.

15 Exhibit 1



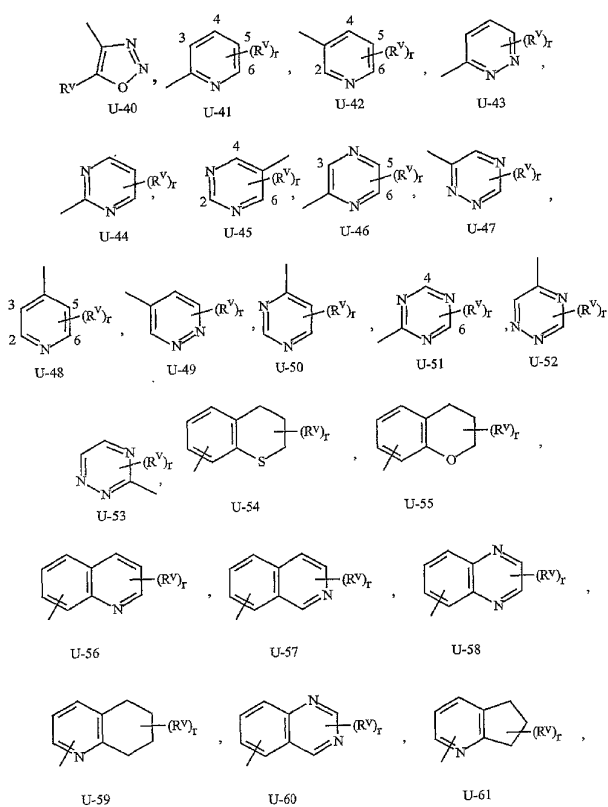
WO 03/026415

PCT/US02/29468



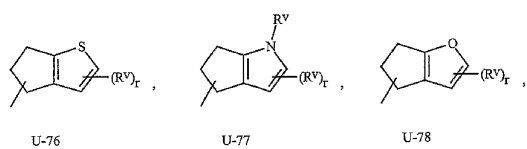
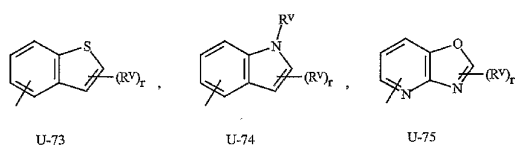
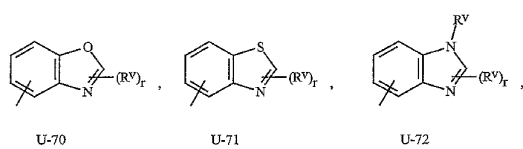
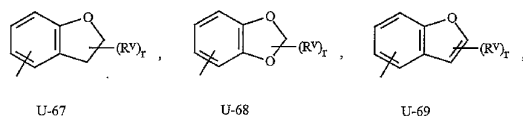
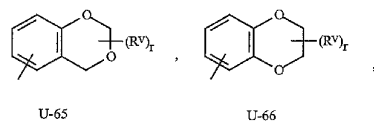
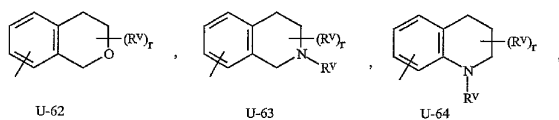
WO 03/026415

PCT/US02/29468



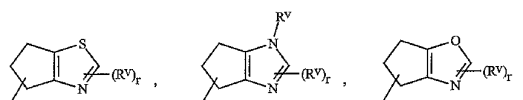
WO 03/026415

PCT/US02/29468



WO 03/026415

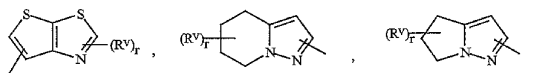
PCT/US02/29468



U-79

U-80

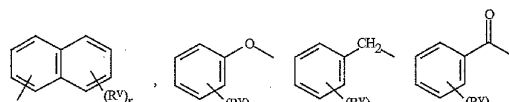
U-81



U-82

U-83

U-84



U-85

U-86

U-87

U-88

- As noted above, R^3 can be (among others) C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 alkenyl, C_2 - C_6 alkynyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of a phenyl ring, phenoxy or 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R^6 ; C_1 - C_4 alkoxy; C_1 - C_4 alkylamino; C_2 - C_8 dialkylamino; C_1 - C_4 alkoxy(C_1 - C_4 alkyl)amino; C_3 - C_6 cycloalkylamino; C_2 - C_6 alkoxy carbonyl or C_2 - C_6 alkyl carbonyl.
- Examples of the substituent rings of R^3 include the rings illustrated as U-1 through U-53 and U-86 illustrated in Exhibit 1, except that such rings are optionally substituted with 1 to 3 substituents independently selected from R^6 rather than R^V .

- As noted above, each R^5 can be independently (among others) phenyl, benzyl, benzoyl, phenoxy, 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system, each ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R^6 . Examples of such R^5 groups include the rings or ring systems illustrated as U-1 through U-88 illustrated in Exhibit 1, except that such rings are optionally substituted with 1 to 3 substituents independently selected from R^6 rather than R^V .

- The compounds of Formula I can be prepared by one or more of the following methods and variations as described in Schemes 1-34. The definitions of R^1 through R^6 , J, K, L and n

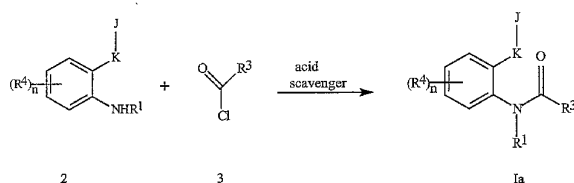
WO 03/026415

PCT/US02/29468

in the compounds of Formula I and Formulae 2-57 below are as defined above in the Summary of the Invention unless indicated otherwise. Compounds of Formulae Ia-Ie, 2a, 5a-e, 13a-e and 49a-b are various subsets of the compounds of Formula I, 2, 5, 13 and 49.

- Compounds of Formula Ia can be prepared by coupling of an amine of Formula 2 with an acid chloride of Formula 3 in the presence of an acid scavenger to provide the compound of Formula Ia as shown in Scheme 1. Typical acid scavengers include amine bases such as triethylamine, *N,N*-diisopropylethylamine and pyridine; other scavengers include hydroxides such as sodium and potassium hydroxide and carbonates such as sodium carbonate and potassium carbonate. In certain instances it is useful to use polymer-supported acid scavengers such as polymer-bound *N,N*-diisopropylethylamine and polymer-bound 4-(dimethyl)aminopyridine. The coupling can be run in a suitable inert solvent such as tetrahydrofuran, dioxane, diethyl ether or dichloromethane to afford the anilide of Formula Ia.

Scheme 1

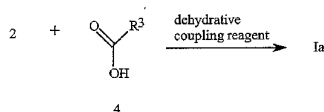


- As illustrated in Scheme 2, an alternate procedure for the preparation of compounds of Formula Ia involves coupling of an amine of Formula 2 with an acid of Formula 4 in the presence of a dehydrating agent such as 1,3-dicyclohexylcarbodiimide (DCC). Polymer supported reagents are again useful here, such as polymer-bound 1,3-cyclohexylcarbodiimide. Synthetic procedures of Schemes 1 and 2 are representative examples of useful methods for the preparation of Formula I compounds; the synthetic literature is extensive for this type of reaction.

WO 03/026415

PCT/US02/29468

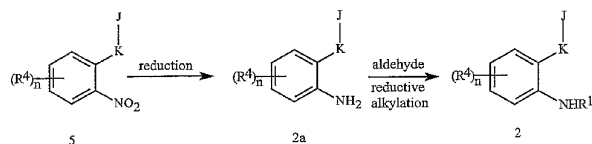
Scheme 2



One skilled in the art will also realize that acid chlorides of Formula 3 can be prepared from acids of Formula 4 by numerous well-known methods. For example, acid chlorides of Formula 3 are readily made from carboxylic acids of Formula 4 by reacting the carboxylic acid 4 with thionyl chloride or oxalyl chloride in an inert solvent such as toluene or dichloromethane in the presence of a catalytic amount of *N,N*-dimethylformamide.

Amines of Formula 2a are typically available from the corresponding nitro compounds of Formula 5 via catalytic hydrogenation of the nitro group as shown in Scheme 3. Typical procedures involve reduction with hydrogen in the presence of a metal catalyst such as palladium on carbon or platinum oxide and in hydroxylic solvents such as ethanol and isopropanol. They can also be prepared by reduction with zinc in acetic acid. These procedures are well documented in the chemical literature. R¹ substituents such as alkyl, substituted alkyl and the like can generally be introduced at this stage through the generally preferred method of reductive alkylation of the amine. A commonly employed procedure is to combine the aniline 2a with an aldehyde in the presence of a reducing agent such as sodium cyanoborohydride to produce the Formula 2 compounds where R¹ is alkyl, alkenyl, alkynyl or substituted derivatives thereof.

Scheme 3

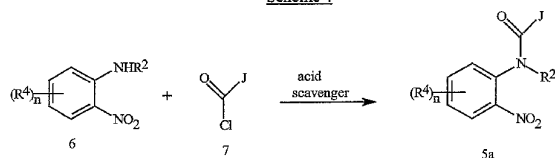


As illustrated in Scheme 4, nitrobenzenes of Formula 5a can be prepared by reaction of amines of Formula 6 with acid chlorides of Formula 7 by methods analogous to those described in Scheme 1.

WO 03/026415

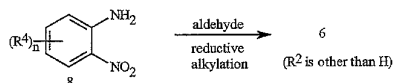
PCT/US02/29468

Scheme 4



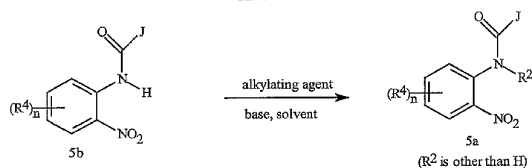
As shown in Scheme 5, amines of Formula 6 (where R² is other than H) can be prepared by reductive alkylation of primary amines of Formula 8 by methods analogous to those described in Scheme 3.

Scheme 5



5 Scheme 6 shows that compounds of Formula 5b can be alkylated with a suitable alkylation agent such as an alkyl halide in the presence of a base such as sodium hydride or *n*-butyllithium in an inert solvent such as tetrahydrofuran or *N,N*-dimethylformamide (DMF) to afford anilides of Formula 5a wherein R² is other than hydrogen. This procedure is especially applicable for preparing compounds of Formula 5a in which R² is alkyl, alkenyl or alkynyl.

Scheme 6

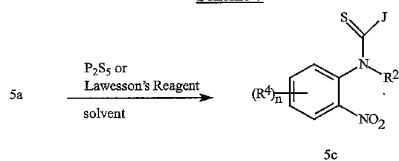


15 The preparation of thioanilides of Formula 5c is outlined in Scheme 7. Reacting an anilide of Formula 5a (where R² is H, alkyl and the like) with phosphorous pentasulfide or Lawesson's Reagent (i.e. 2,4-bis(4-methoxyphenyl)-1,3-dithia-2,4-diphosphetane-2,4-disulfide) in a suitable solvent such as pyridine at room temperature or on heating affords a thioanilide of Formula 5c.

WO 03/026415

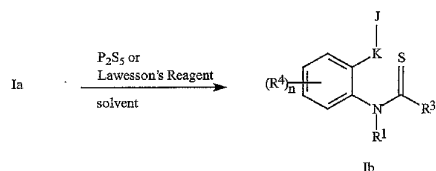
PCT/US02/29468

Scheme 7



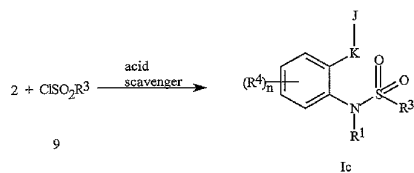
In addition, thioanilides of Formula Ib may be prepared from corresponding anilides of Formula Ia by methods described in Scheme 8.

Scheme 8



- 5 Compounds of Formula Ic can be prepared by reacting an amine of Formula 2 with a sulfonyl chloride of Formula 9 in the presence of an acid scavenger. Typical acid scavengers include amine bases such as triethylamine, *N,N*-diisopropylethylamine and pyridine; other scavengers include hydroxides such as sodium and potassium hydroxide and carbonates such as sodium carbonate and potassium carbonate. In certain instances it is
- 10 useful to use polymer-supported acid scavengers such as polymer-bound *N,N*-diisopropylethylamine and polymer-bound 4-(dimethyl)aminopyridine.

Scheme 9

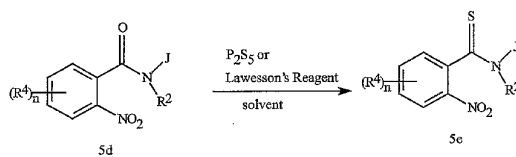


WO 03/026415

PCT/US02/29468

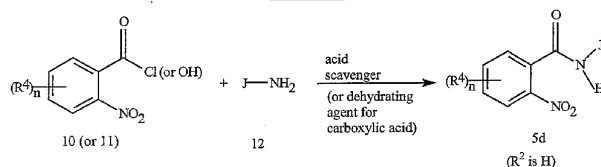
Thioamides of Formula 5e can be prepared from corresponding amides of Formula 5d by methods analogous to those illustrated in Scheme 7.

Scheme 10



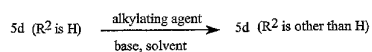
- Amides of Formula 5d wherein R² is H can be prepared from acid chlorides of Formula 10 or from carboxylic acids of Formula 11 by methods analogous to those illustrated in Schemes 1 and 2, respectively.

Scheme 11



Amides of Formula 5d (wherein R² is other than H) can be prepared from corresponding amides of Formula 5d by methods analogous to those illustrated in Scheme 6.

Scheme 12



10

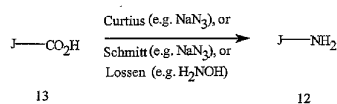
Amines of Formula 12 can be prepared from carboxylic acids of Formula 13 (or corresponding acid chloride derivatives) using Curtius, Schmitt or Lossen conditions. These name reactions are well documented in the literature. For some representative reaction conditions, refer to, e.g., R.C. Larock, *Comprehensive Organic Transformations*, 1989,

15 VCH Publishers, pp. 431-2.

WO 03/026415

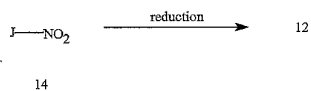
PCT/US02/29468

Scheme 13



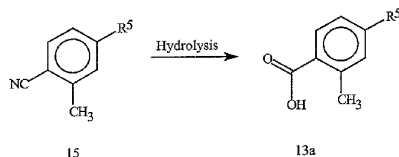
Amines of Formula 12 can also be prepared by reduction of appropriate nitro compounds of Formula 14 by methods analogous to those illustrated in Scheme 3.

Scheme 14



Benzoic acids of Formula 13a (J is optionally substituted phenyl) are generally well known in the art as are procedures for their preparation. One particularly useful subset of benzoic acids of this invention are 2-methyl-4-perfluoroalkyl benzoic acids of Formula 13a (one R⁵ is e.g. CF₃, C₂F₅, C₃F₇). The synthesis for these compounds is outlined in Schemes 15-19. Benzoic acids of Formula 13a may be prepared from the benzonitriles of Formula 15 by hydrolysis. The conditions used may involve the use of a base such as an alkaline metal hydroxide or alkoxide (e.g. potassium or sodium hydroxide) in a solvent such as water, ethanol or ethylene glycol (e.g. *J. Chem. Soc.* 1948, 1025). Alternatively, the hydrolysis may be carried out using an acid such as sulfuric acid or phosphoric acid in a suitable solvent such as water (e.g. *Org. Synth.* 1955, Coll Vol. 3, 557). The choice of the conditions is contingent on the stability of R⁵ to the reaction conditions; elevated temperatures are usually employed to achieve this transformation.

Scheme 15

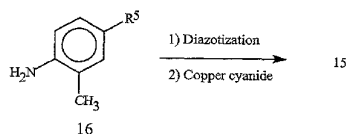


WO 03/026415

PCT/US02/29468

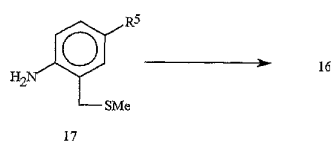
Nitriles of Formula 15 can be prepared from anilines of Formula 16 by the classical sequence involving diazotization and treatment of the intermediate diazonium salt with a copper cyanide salt (e.g. *J. Amer. Chem. Soc.* **1902**, 24, 1035).

Scheme 16



- 5 Anilines of Formula 16 may be prepared from compounds of Formula 17. This transformation may be achieved by a well-known procedure that employs Raney Nickel (*Org. Synth. Coll. Vol VI*, 581). Alternatively, the same transformation may be effected by the use of a suitable catalyst such as palladium in the presence of hydrogen. The reaction is usually conducted at pressures between 10² to 10⁵ kPa in a suitable organic solvent such as, but not limited to, toluene. Elevated temperatures of 80-110°C are usually required to achieve the transformation. As one skilled in the art will realize, numerous chemical modifications of the thioether moiety are possible and may be employed when necessary to facilitate this transformation.

Scheme 17



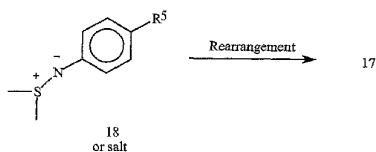
- Compounds of Formula 17 may be prepared from iminosulfuranes of Formula 18.
- 15 The transformation may be achieved in a protic solvent such as methanol or water, in a non-protic solvent such as dichloromethane or toluene in the presence of a suitable base such as triethylamine (e.g. *Org. Synth. Coll. Vol. VI*, 581) or sodium methoxide, or in a combination of a protic solvent, a protic solvent and a base. The temperature at which the reaction is conducted is usually in the range 40-110°C. As one skilled in the art will realize,
- 20 suitable salts of compounds of Formula 18 such as, but not limited to a hydrochloride, a sulfate or a bisulfate may also be employed, provided that the appropriate amount of base is first used to generate the free base 18. This may be done as a separate step or as an integral

WO 03/026415

PCT/US02/29468

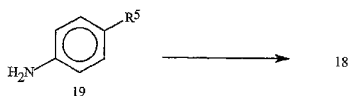
part of the step involving the transformation of compounds of Formula 18 to compounds of Formula 17.

Scheme 18



- Compounds of Formula 18 may be prepared from anilines of Formula 19 by reaction with dimethyl sulfide and a suitable chlorinating agent such as, but not limited to *N*-chlorosuccinimide (e.g. *Org. Synth. Coll. Vol. VI*, 581), chlorine or *N*-chlorobenzotriazole. Alternatively, anilines of Formula 19 may be treated with dimethyl sulfoxide which has been "activated" by treatment with an agent such as acetic anhydride, trifluoroacetic anhydride, trifluoromethanesulfonic anhydride, cyclohexylcarbodiimide, sulfur trioxide, or phosphorus pentoxide. The reaction is conducted in a suitable organic solvent such as dichloromethane or dimethyl sulfoxide. The reaction is conducted at a temperature of -70°C to 25°C ; the optimum temperature is dependent on the solvent and reagent used.

Scheme 19



- Heterocyclic acids 13, where J is equal to an optionally substituted heterocycle, can be prepared by procedures outlined in Schemes 20-25. Both general and specific references to a wide variety of heterocyclic acids including thiophenes, furans, pyridines, pyrimidines, triazoles, imidazoles, pyrazoles, thiazoles, oxazoles, isothiazoles, thiadiazoles, oxadiazoles, triazines, pyrazines, pyridazines, and isoxazoles can be found in the following compendia: *Rodd's Chemistry of Carbon Compounds*, Vol. IVa to IVI., S. Coffey editor, Elsevier Scientific Publishing, New York, 1973; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol. 1-7, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors, Pergamon Press, New York, 1984; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, Vol. 1-9, A. R. Katritzky, C. W. Rees, and E. F. Scriven editors, Pergamon Press, New York, 1996; and the series, *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*, E. C. Taylor, editor, Wiley, New York. Particularly useful

WO 03/026415

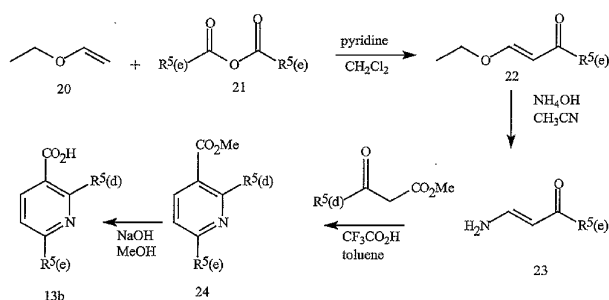
PCT/US02/29468

heterocyclic acids of this invention include pyridine acids, pyrimidine acids and pyrazole acids. Procedures for the synthesis of representative examples of each are detailed in Schemes 20-25. A variety of heterocyclic acids and general methods for their synthesis may be found in World Patent Application WO 98/57397.

- 5 The synthesis of representative pyridine acids of Formula 13b is depicted in Scheme 20. This procedure involves the known synthesis of pyridines from β -ketoesters and 4-aminobutenones of Formula 23. Substituent groups $R^{5(d)}$ and $R^{5(e)}$ include e.g. alkyl and haloalkyl. For leading references to this method see, *Synthesis*, 1999, (7), 1216-1222 and *Heterocycles*, 1997, 46, 129-132.

10

Scheme 20

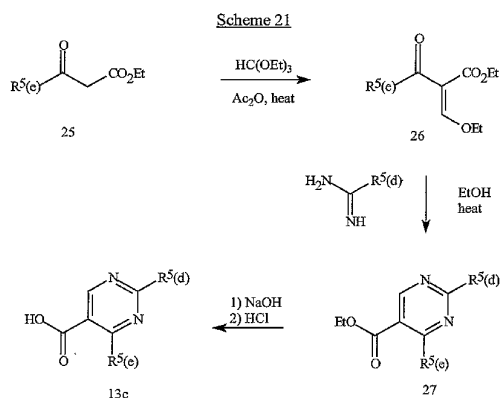


- 15 The synthesis of representative pyrimidine acids of Formula 13c is depicted in Scheme 21. This procedure involves the known synthesis of pyrimidines from vinylidene- β -ketoesters of Formula 26 and amidines. Substituent groups $R^{5(d)}$ and $R^{5(e)}$ include e.g. alkyl and haloalkyl. For a leading reference to this method see, *Bull. Soc. Chim. Fr.*, 1987, (2), 318-324.

20

WO 03/026415

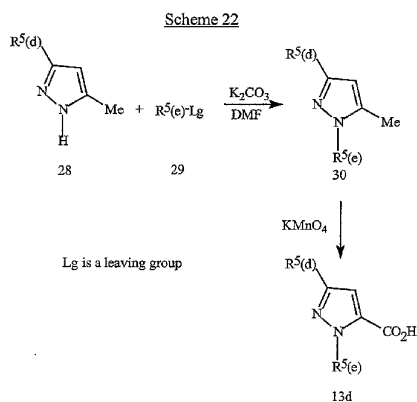
PCT/US02/29468



Syntheses of representative pyrazole acids of Formula 13d are depicted in Schemes 22-25. The synthesis of 13d in Scheme 22 involves as the key step introduction of the R⁵(e) substituent via alkylation of the pyrazole of Formula 28. The alkylating agent R⁵(e)-Lg (wherein Lg is a leaving group such as Cl, Br, I, sulfonates such as *p*-toluenesulfonate or methanesulfonate or sulfates such as -OSO₂R⁵(e)) includes R⁵(e) groups such as C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxycarbonyl, C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl, C₃-C₆ trialkylsilyl; and a phenyl, benzyl, benzoyl, 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system, each ring or ring system optionally substituted. Oxidation of the methyl group affords the pyrazole carboxylic acid. Some of the more preferred R⁵(d) groups include haloalkyl.

WO 03/026415

PCT/US02/29468



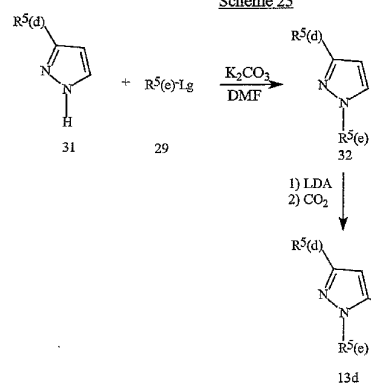
Some pyrazole acids may be prepared via metallation and carboxylation of pyrazoles of Formula 32 as the key step (Scheme 23). The $R^5(e)$ group is introduced in a manner similar to that of Scheme 22, i.e. via alkylation with a $R^5(e)$ alkylating agent. Representative $R^5(d)$ groups include such as cyano and haloalkyl.

- 5 Other pyrazoles of Formula 13d can be prepared via reaction of an optionally substituted phenyl hydrazine 33 with a pyruvate 34 to yield pyrazole esters 35 (Scheme 24). Hydrolysis of the ester affords the pyrazole acids 13d. This procedure is particularly useful for the preparation of compounds where $R^5(e)$ is optionally substituted phenyl and $R^5(d)$ is haloalkyl.

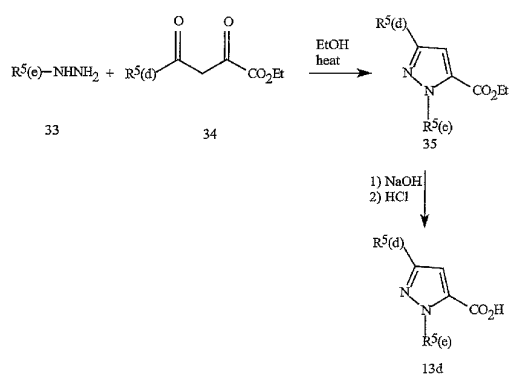
WO 03/026415

PCT/US02/29468

Scheme 23



Scheme 24



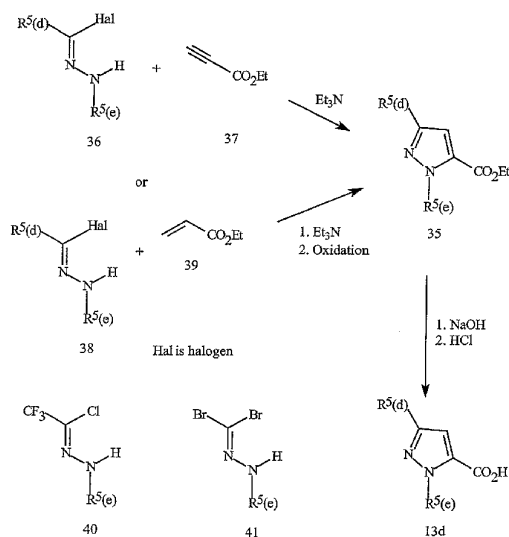
Pyrazole acids of Formula 13d can also be prepared via 3+2 cycloaddition of an appropriately substituted nitrilimine with either substituted propiolates of Formula 37 or

WO 03/026415

PCT/US02/29468

- acrylates of Formula 39 as shown in Scheme 25. Cycloaddition with acrylates requires additional oxidation of the intermediate pyrazoline to the pyrazole. Hydrolysis of the ester 35 affords the pyrazole acids 13d. Preferred iminothalides for this reaction include the trifluoromethyl iminochloride 40 and the iminodibromide (41). Compounds such as 40 are known (*J. Heterocycl. Chem.* **1985**, 22(2), 565-8). Compounds such as 41 are available by known methods (*Tetrahedron Letters* **1999**, 40, 2605). These procedures are particularly useful for the preparation of compounds where R⁵(e) is optionally substituted phenyl and R⁵(d) is haloalkyl or bromo.

Scheme 25



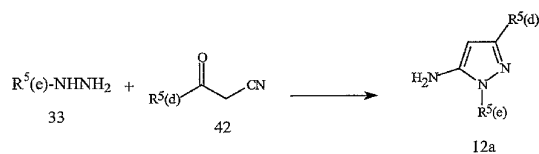
- Pyrazole amines of Formula 12a can be prepared via reaction of an optionally substituted phenyl hydrazine 33 with a ketonitrile of Formula 42. This cyclization reaction is well documented in the literature. For leading references and some representative reaction

WO 03/026415

PCT/US02/29468

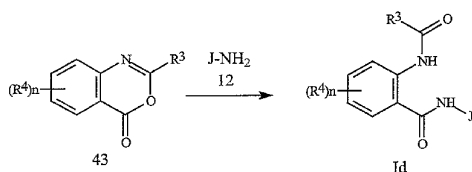
conditions see, PCT Publication WO01/004115 and *Synthesis*, **1997**, (3), 337-341. For reaction conditions also see Example 7 of this invention.

Scheme 26



Compounds of Formula Id can be prepared by treatment of a benzoxazinone 43 with an amine 12 as shown in Scheme 27. The general reaction of benzoxazinones with amines to produce anthranilamides is well documented in the chemical literature. For a review of benzoxazinone chemistry see Jakobsen et al., *Biorganic and Medicinal Chemistry* **2000**, 8, 2095-2103 and references cited within. For representative reaction methods to prepare benzoxazinones 43 see *Journal of Heterocyclic Chemistry*, **2000**, 37(4), 725-729 and *Tetrahedron*, **1995**, 51(7), 1861-6.

Scheme 27

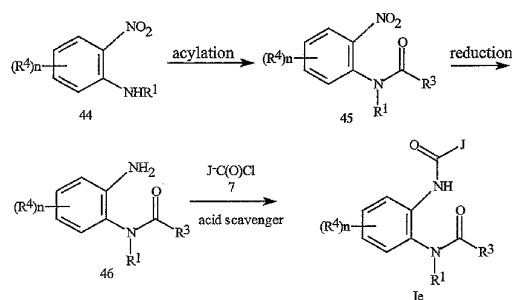


Compounds of Formula Ie can be prepared by methods depicted in Scheme 28. Acylation of amine 44 followed by reduction of the nitro group affords amine of Formula 46. Coupling of an amine 46 with an acid chloride 7 gives a compound of Formula Ie by methods analogous to those described in Scheme 1. Compounds of Formula 44 can be prepared by reduction alkylation by methods analogous to those described in Scheme 3. The acylation reaction can be achieved by coupling with acid chlorides 3 or acids 4 by methods analogous to those described in Scheme 1 and Scheme 2.

WO 03/026415

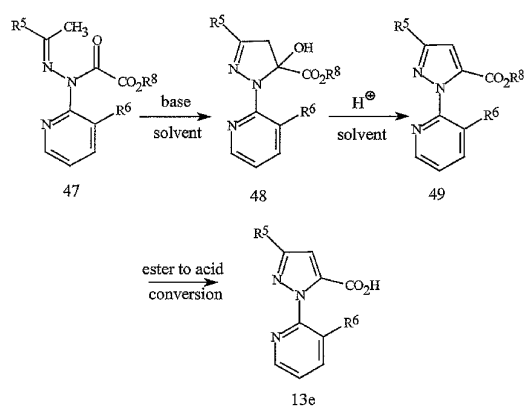
PCT/US02/29468

Scheme 28



Pyrazolecarboxylic acids of Formula 13c wherein R⁵ is CF₃ can be prepared by the method outlined in Scheme 29.

Scheme 29



5

Reaction of a compound of Formula 47 wherein R⁸ is C₁-C₄ alkyl with a suitable base in a suitable organic solvent affords the cyclized product of Formula 48 after neutralization with

WO 03/026415

PCT/US02/29468

an acid such as acetic acid. The suitable base can be, for example but not limitation, sodium hydride, potassium *t*-butoxide, dimethyl sodium ($\text{CH}_3\text{S}(\text{O})\text{CH}_2\text{Na}^+$), alkali metal (such as lithium, sodium or potassium) carbonates or hydroxides, tetraalkyl (such as methyl, ethyl or butyl)ammonium fluorides or hydroxides, or 2-*tert*-butylimino-2-diethylamino-1,3-dimethyl-perhydro-1,3,2-diazaphosphonine. The suitable organic solvent can be, for example but not limitation, acetone, acetonitrile, tetrahydrofuran, dichloromethane, dimethylsulfoxide, or *N,N*-dimethylformamide. The cyclization reaction is usually conducted in a temperature range from about 0 to 120 °C. The effects of solvent, base, temperature and addition time are all interdependent, and choice of reaction conditions is important to minimize the formation of byproducts. A preferred base is tetrabutylammonium fluoride.

Dehydration of the compound of Formula 48 to give the compound of Formula 49, followed by converting the carboxylic ester function to carboxylic acid, affords the compound of Formula 13c. The dehydration is effected by treatment with a catalytic amount of a suitable acid. This catalytic acid can be, for example but not limitation, sulfuric acid.

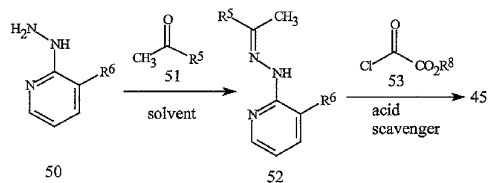
The reaction is generally conducted using an organic solvent. As one skilled in the art will realize, dehydration reactions may be conducted in a wide variety of solvents in a temperature range generally between about 0 and 200 °C, more preferably between about 0 and 100 °C. For the dehydration in the method of Scheme 9, a solvent comprising acetic acid and temperatures of about 65 °C are preferred. Carboxylic ester compounds can be converted to carboxylic acid compounds by numerous methods including nucleophilic cleavage under anhydrous conditions or hydrolytic methods involving the use of either acids or bases (see 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 for a review of methods). For the method of Scheme 9, base-catalyzed hydrolytic methods are preferred. Suitable bases include alkali metal (such as lithium, sodium or potassium) hydroxides. For example, the ester can be dissolved in a mixture of water and an alcohol such as ethanol. Upon treatment with sodium hydroxide or potassium hydroxide, the ester is saponified to provide the sodium or potassium salt of the carboxylic acid. Acidification with a strong acid, such as hydrochloric acid or sulfuric acid, yields the carboxylic acid of Formula 13c. The carboxylic acid can be isolated by methods known to those skilled in the art, including crystallization, extraction and distillation.

Compounds of Formula 47 can be prepared by the method outlined in Scheme 30.

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Scheme 30

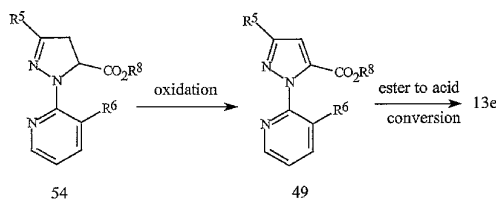


wherein R^5 is CF_3 and R^8 is $\text{C}_1\text{--C}_4$ alkyl.

Treatment of a hydrazine compound of Formula 50 with a ketone of Formula 51 in a solvent such as water, methanol or acetic acid gives the hydrazone of Formula 52. One skilled in the art will recognize that this reaction may require catalysis by an optional acid and may also require elevated temperatures depending on the molecular substitution pattern of the hydrazone of Formula 52. Reaction of the hydrazone of Formula 52 with the compound of Formula 53 in a suitable organic solvent such as, for example but not limitation, dichloromethane or tetrahydrofuran in the presence of an acid scavenger such as triethylamine provides the compound of Formula 47. The reaction is usually conducted at a temperature between about 0 and 100 °C. Further experimental details for the method of Scheme 30 are illustrated in Example 8. Hydrazine compounds of Formula 50 can be prepared by standard methods, such as by contacting the corresponding 2-halo pyridine with hydrazine.

As an alternative to the method illustrated in Scheme 29, pyrazolecarboxylic acids of Formula 13e wherein R^5 is Cl or Br can also be prepared by the method outlined in Scheme 31.

Scheme 31



wherein R^8 is $\text{C}_1\text{--C}_4$ alkyl.

25

wherein R⁸ is C₁-C₄ alkyl.

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Treatment of a compound of Formula 55 with a halogenating reagent, usually in the presence of a solvent, affords the corresponding halo compound of Formula 54. Halogenating reagents that can be used include phosphorus oxyhalides, phosphorus trihalides, phosphorus pentahalides, thionyl chloride, dihalotrialkylphosphoranes, dihalodiphenylphosphoranes, oxalyl chloride and phosgene. Preferred are phosphorus oxyhalides and phosphorus pentahalides. To obtain complete conversion, at least 0.33 equivalents of phosphorus oxyhalide versus the compound of Formula 55 should be used, preferably between about 0.33 and 1.2 equivalents. To obtain complete conversion, at least 0.20 equivalents of phosphorus pentahalide versus the compound of Formula 55 should be used, preferably between about 0.20 and 1.0 equivalents. Compounds of Formula 55 wherein R⁸ is C₁-C₄ alkyl are preferred for this reaction. Typical solvents for this halogenation include halogenated alkanes, such as dichloromethane, chloroform, chlorobutane and the like, aromatic solvents, such as benzene, xylene, chlorobenzene and the like, ethers, such as tetrahydrofuran, *p*-dioxane, diethyl ether, and the like, and polar aprotic solvents such as acetonitrile, *N,N*-dimethylformamide, and the like. Optionally, an organic base, such as triethylamine, pyridine, *N,N*-dimethylaniline or the like, can be added. Addition of a catalyst, such as *N,N*-dimethylformamide, is also an option. Preferred is the process in which the solvent is acetonitrile and a base is absent. Typically, neither a base nor a catalyst is required when acetonitrile solvent is used. The preferred process is conducted by mixing the compound of Formula 55 in acetonitrile. The halogenating reagent is then added over a convenient time, and the mixture is then held at the desired temperature until the reaction is complete. The reaction temperature is typically between 20 °C and the boiling point of acetonitrile, and the reaction time is typically less than 2 hours. The reaction mass is then neutralized with an inorganic base, such as sodium bicarbonate, sodium hydroxide and the like, or an organic base, such as sodium acetate. The desired product, a compound of Formula 54, can be isolated by methods known to those skilled in the art, including crystallization, extraction and distillation.

Alternatively, compounds of Formula 54 wherein R⁵ is Br or Cl can be prepared by treating the corresponding compounds of Formula 54 wherein R⁵ is a different halogen (e.g., Cl for making Formula 54 wherein R⁵ is Br) or a sulfonate group such as *p*-toluenesulfonate, benzenesulfonate and methanesulfonate with hydrogen bromide or hydrogen chloride, respectively. By this method the R⁵ halogen or sulfonate substituent on the Formula 54 starting compound is replaced with Br or Cl from hydrogen bromide or hydrogen chloride, respectively. The reaction is conducted in a suitable solvent such as dibromomethane, dichloromethane or acetonitrile. The reaction can be conducted at or near atmospheric pressure or above atmospheric pressure in a pressure vessel. When R⁵ in the starting compound of Formula 54 is a halogen such as Cl, the reaction is preferably conducted in

WO 03/026415

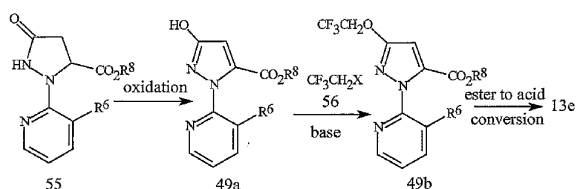
PCT/US02/29468

such a way that the hydrogen halide generated from the reaction is removed by sparging or other suitable means. The reaction can be conducted between about 0 and 100 °C, most conveniently near ambient temperature (e.g., about 10 to 40 °C), and more preferably between about 20 and 30 °C. Addition of a Lewis acid catalyst (such as aluminum tribromide for preparing Formula 54 wherein R⁵ is Br) can facilitate the reaction. The product of Formula 54 is isolated by the usual methods known to those skilled in the art, including extraction, distillation and crystallization.

Starting compounds of Formula 54 wherein R⁵ is Cl or Br can be prepared from corresponding compounds of Formula 55 as already described. Starting compounds of Formula 54 wherein R⁵ is a sulfonate group can likewise be prepared from corresponding compounds of Formula 54 by standard methods such as treatment with a sulfonyl chloride (e.g., *p*-toluenesulfonyl chloride) and base such as a tertiary amine (e.g., triethylamine) in a suitable solvent such as dichloromethane.

Pyrazolecarboxylic acids of Formula 13e wherein R⁵ is OCH₂CF₃ can be prepared by the method outlined in Scheme 33.

Scheme 33



wherein R⁸ is C₁–C₄ alkyl, and X is a leaving group.

In this method, instead of being halogenated as shown in Scheme 32, the compound of Formula 55 is oxidized to the compound of Formula 49a. The reaction conditions for this oxidation are as already described for the conversion of the compound of Formula 54 to the compound of Formula 49 in Scheme 31.

The compound of Formula 49a is then alkylated to form the compound of Formula 49b by contact with an alkylating agent CF₃CH₂X (56) in the presence of a base. In the alkylating agent 56, X is a nucleophilic reaction leaving group such as halogen (e.g., Br, I), OS(O)₂CH₃ (methanesulfonate), OS(O)₂CF₃, OS(O)₂Ph-*p*-CH₃ (*p*-toluenesulfonate), and the like; methanesulfonate works well. The reaction is conducted in the presence of at least one equivalent of a base. Suitable bases include inorganic bases, such as alkali metal (such as lithium, sodium or potassium) carbonates and hydroxides, and organic bases, such as

Compounds of Formula 55 can be prepared from compounds of Formula 50 as outlined in Scheme 34.

Nc1ccc(R6)nc1 + R8O2CCH=CHCO2R8 >> [base] Nc1ccc(R6)c(cc1CC(=O)OR8)C(=O)OR8

 50 57 58

In this method, a hydrazine compound of Formula 50 is contacted with a compound of Formula 57 (a fumarate ester or maleate ester or a mixture thereof may be used) in the presence of a base and a solvent. The base is typically a metal alkoxide salt, such as sodium methoxide, potassium methoxide, sodium ethoxide, potassium ethoxide, potassium *tert*-butoxide, lithium *tert*-butoxide, and the like. Greater than 0.5 equivalents of base versus the compound of Formula 50 should be used, preferably between 0.9 and 1.3 equivalents. Greater than 1.0 equivalents of the compound of Formula 57 should be used, preferably between 1.0 to 1.3 equivalents. Polar protic and polar aprotic organic solvents can be used, such as alcohols, acetonitrile, tetrahydrofuran, *N,N*-dimethylformamide, dimethyl sulfoxide and the like. Preferred solvents are alcohols such as methanol and ethanol. It is especially preferred that the alcohol be the same as that making up the fumarate or maleate ester and the alkoxide base. The reaction is typically conducted by mixing the compound of Formula 18 and the base in the solvent. The mixture can be heated or cooled to a desired temperature and the compound of Formula 57 added over a period of time. Typically reaction temperatures are between 0 °C and the boiling point of the solvent used. The reaction may

WO 03/026415

PCT/US02/29468

be conducted under greater than atmospheric pressure in order to increase the boiling point of the solvent. Temperatures between about 30 and 90 °C are generally preferred. The addition time can be as quick as heat transfer allows. Typical addition times are between 1 minute and 2 hours. Optimum reaction temperature and addition time vary depending upon the identities of the compounds of Formula 50 and Formula 57. After addition, the reaction mixture can be held for a time at the reaction temperature. Depending upon the reaction temperature, the required hold time may be from 0 to 2 hours. Typical hold times are 10 to 60 minutes. The reaction mass then can be acidified by adding an organic acid, such as acetic acid and the like, or an inorganic acid, such as hydrochloric acid, sulfuric acid and the like. Depending on the reaction conditions and the means of isolation, the $-\text{CO}_2\text{R}^8$ function on the compound of Formula 55 may be hydrolyzed to $-\text{CO}_2\text{H}$; for example, the presence of water in the reaction mixture can promote such hydrolysis. If the carboxylic acid ($-\text{CO}_2\text{H}$) is formed, it can be converted back to $-\text{CO}_2\text{R}^8$ wherein R^8 is $\text{C}_1\text{--C}_4$ alkyl using esterification methods well-known in the art. The desired product, a compound of Formula 55, can be isolated by methods known to those skilled in the art, such as crystallization, extraction or distillation.

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

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

Without further elaboration, it is believed that one skilled in the art using the preceding description can utilize the present invention to its fullest extent. The following Examples are, therefore, to be construed as merely illustrative, and not limiting of the disclosure in any way whatsoever. Percentages are by weight except for chromatographic solvent mixtures or

WO 03/026415

PCT/US02/29468

where otherwise indicated. Parts and percentages for chromatographic solvent mixtures are by volume unless otherwise indicated. ¹H NMR spectra are reported in ppm downfield from tetramethylsilane; s is singlet, d is doublet, t is triplet, q is quartet, m is multiplet, dd is doublet of doublets, dt is doublet of triplets, br s is broad singlet.

5

EXAMPLE 11-(2-Chlorophenyl)-N-[3-methyl-2-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamideStep A: Preparation of 1-(2-Chlorophenyl)-5-(2-furanyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole

10 To a solution of 4,4,4-trifluoro-1-(2-furyl)-1,3-butanedione (30.0 g, 146 mmol) in glacial acetic acid (65 mL) was added sodium acetate (12.1 g, 148 mmol). The mixture was cooled to about 25 °C, 2-chlorophenylhydrazine hydrochloride (25.6 g, 145 mmol) was added portionwise and, following a mild exotherm, the mixture was heated to 60 °C for 4 h, then cooled to 25 °C. The mixture was diluted with dichloromethane (400 mL), and the
15 organic phase was washed with water (3x250 mL), saturated aqueous sodium carbonate (2x250 mL) and brine, then dried over magnesium sulfate and evaporated under reduced pressure to yield 43.2 g of the title compound as a brown oil.

¹H NMR (CDCl₃) δ 7.6 (m, 5H), 6.9 (1H), 5.7 (d, 1H).

Step B: Preparation of 1-(2-Chlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxylic acid

20

To a suspension containing the title compound of Step A (43.2 g, 138 mmol) in acetonitrile (415 mL) was added sodium dihydrogen phosphate monohydrate (92.4 g, 669 mmol) over about 0.25 h. After stirring at room temperature for 0.5 h, the mixture was cooled to about 5 °C and a solution containing sodium chlorite (181.7 g, 2.0 mmol) in
25 430 mL of water was added dropwise over 1 h while keeping the reaction temperature at less than 10 °C. [Note: an aqueous sodium hydroxide scrubber was attached to scrub an evolving yellow off-gas.] Following completion of addition the suspension was stirred at 5 °C for about 1 h, at 25 °C overnight, then acidified to pH 1 by dropwise addition of concentrated hydrochloric acid (150 mL), then extracted with ethyl acetate (1x500 mL, then 2x250 mL). The combined ethyl acetate extracts were added dropwise to an aqueous sodium metasilicate solution (228.5 g in 1.05 L water) at a reaction temperature of less than 20 °C. The suspension was partitioned and the aqueous layer extracted with ethyl acetate
30 (2x100 mL). The organic layers were combined, dried over magnesium sulfate and evaporated under reduced pressure. The residue was triturated with hexane:diethyl ether
35 (99:1, 100 mL) to yield 32.9 g of the title compound as a solid.

¹H NMR (DMSO-d₆) δ 13.9 (bs, 1H), 7.7 (m, 5H).

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Step C: Preparation of 1-(2-Chlorophenyl)-N-(3-methyl-2-nitrophenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide

To a mixture of the title compound of Step B (1.2 g, 3.4 mmol) in dichloromethane (15 mL) was added oxalyl chloride (0.5 g, 3.7 mmol) followed by about 2 drops of *N,N*-dimethylformamide. After an initial exotherm the suspension was stirred at room temperature under N₂ for 0.4 h, then evaporated under reduced pressure to afford an oil residue. This residue was dissolved in tetrahydrofuran (20 mL), 2-methyl-6-nitroaniline (0.5 g, 152.2 mmol) was added followed by *N,N*-diisopropylethylamine (0.7 g, 129.5 mmol), and the suspension was stirred at room temperature under N₂ overnight. The crude mixture was evaporated under reduced pressure and the residue was purified by flash column chromatography on silica gel with hexane:ethyl acetate (2:1) as eluant to yield 200 mg of the title compound as a solid; m.p. 215-220 °C.

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.3 (s,3H), 6.3-6.6 (s,1H), 7.4-7.6 (m,7H), 8.0 (d,1H).

Step D: Preparation of N-(2-Amino-3-methylphenyl)-1-(2-chlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide

The title compound of Step C (1.0 g, 2.3 mmol) was dissolved in ethyl acetate (50 mL) and hydrogenated over 10% palladium on carbon (200 mg, 1.8 mmol) in a Parr Shaker (45 psi) for 3 h. Following work up by filtering the reaction mixture through Celite® diatomaceous filter aid and evaporating the filtrate under reduced pressure, the oil residue was slurried in hexane and filtered to yield 1.0 g of the title compound as an off-white solid; m.p. 165-167 °C.

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.2 (s,3H), 3.6 (m,2H), 6.7 (m,1H), 6.9 (m,1H), 7.1 (m,1H), 7.2 (m,1H), 7.4 (m,2H), 7.5, (m,2H), 8.1 (bs,1H).

Step E: Preparation of 1-(2-Chlorophenyl)-N-[3-methyl-2-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide

To a suspension containing the title compound of Step D (0.6 g, 1.5 mmol) in tetrahydrofuran (20 mL) was added isobutryl chloride (0.25 g, 2.3 mmol) followed by *N,N*-diisopropylethylamine (0.5 g, 3.9 mmol). The suspension was stirred overnight at 25 °C then diluted with 1N HCl (100 mL) and ethyl acetate (100 mL). The organic layer was separated, washed with 1N HCl, water, saturated aqueous sodium bicarbonate and brine (each wash about 50 mL), then dried over magnesium sulfate and evaporated under reduced pressure to yield 0.6 g of the title compound, a compound of the invention, as a solid; m.p. 240-242 °C. ¹H NMR (CDCl₃) δ 1.3 (d,6H), 2.5(s,3H), 2.6 (m,1H), 7.0-7.6 (m,9H), 9.5 (s,1H).

WO 03/026415

PCT/US02/29468

EXAMPLE 2

2-Methyl-6-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]-N-[2-methyl-4-(trifluoromethyl)phenyl]benzamideStep A: Preparation of 2-Methyl-N-[2-methyl-4-(trifluoromethyl)phenyl]-6-nitrobenzamide

5 A mixture of 2-methyl-6-nitrobenzoic acid (9.0 g, 49.7 mmol) and thionyl chloride (62 mL) was heated at reflux in toluene (100 mL) for 2.5 h then cooled to 25 °C. The suspension was evaporated under reduced pressure, then azeotroped with toluene. The residue, dissolved in tetrahydrofuran (10 mL), was added dropwise to a solution containing
 10 2-amino-5-trifluoromethyltoluene (2.89 g 16.5 mmol) and triethylamine (2.02 g, 20 mmol) in tetrahydrofuran (20 mL). The suspension was stirred 72 h at 25 °C, then poured into water and extracted with ethyl acetate (2x20 mL). The combined organic extracts were evaporated onto silica gel and purified by medium pressure liquid chromatography on silica gel (gradient from 100% hexane to 1:1 hexane:ethyl acetate as eluants) to yield 1.22 g of
 15 the title compound.

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.4 (s,3H), 2.6 (s,3H), 7.5-7.7 (m,5H), 8.1 (m,1H), 8.2 (m,1H).

Step B: Preparation of 2-Amino-6-N-[2-methyl-4-(trifluoromethyl)phenyl]benzamide

The title compound of Step A (2.73 g, 7.7 mmol) was dissolved in ethanol (25 mL) and hydrogenated over palladium on carbon (0.2 g) using a Parr Shaker (350 kPa) for 16 h.
 20 After filtering the reaction suspension through Celite®, the white pad was washed with diethyl ether. The combined organic layers were evaporated under reduced pressure to yield 2.4 g of the title compound as a semi-solid.

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.4 (m,6H), 6.8 (m,3H), 7.1 (m,1H), 7.4-7.7 (m,4H), 8.3 (m,1H).

Step C: Preparation of 2-Methyl-6-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]-N-[2-methyl-4-trifluoromethyl)phenyl]benzamide

25 Isobutyryl chloride (51.8 mg, 0.5 mmol) was added to a solution containing the title compound of Step B (0.15 g, 0.5 mmol) and *N,N*-diisopropylethylamine (0.13 g, 1.0 mmol) in chloroform (5 mL). The suspension was stirred at 25 °C overnight then diluted with 1N HCl. After stirring about 1 h, the suspension was filtered through a 0.45 micron PTFE
 30 membrane, and the filtrate was evaporated under reduced pressure to yield 0.08 g of the title compound, a compound of the invention, as a solid; m.p. >230 °C.

¹H NMR (DMSO-D₆) δ 1.0 (d,6H), 2.5 (s,3H), 2.4 (s,3H), 2.6 (m,1H), 7.1 (m,1H), 7.3 (m,1H), 7.6 (m,2H), 7.9 (m,2H), 9.3 (bs,1H), 9.9 (s,1H).

EXAMPLE 3

2-Methyl-6-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]-N-[2-methyl-4-(trifluoromethoxy)phenyl]benzamideStep A: Preparation of 2-Methyl-N-[2-methyl-4-(trifluoromethoxy)phenyl]-6-nitrobenzamide

By the procedure of Example 2 (Step A), 2-methyl-4-trifluoromethoxyaniline (3.15 g, 16.5 mmol) was reacted with 2-methyl-6-nitrobenzoyl chloride (3.3 g, 16.5 mmol) and triethylamine (2.02 g, 20 mmol) in tetrahydrofuran (30 mL). Following completion of reaction the reaction suspension was poured into excess water and extracted several times with ethyl acetate. The combined extracts were dried over magnesium sulfate and evaporated under reduced pressure to afford a solid. The solid was further purified by triturating with a hexane:diethyl ether solution to yield 2.73 g of the title compound.

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.3 (s,3H), 2.6 (s,3H), 7.1 (m,3H), 7.5 (m,1H), 7.6 (m,1H), 7.9 (m,1H), 8.1 (m,1H).

Step B: Preparation of 2-Amino-6-N-[2-methyl-4-(trifluoromethoxy)-phenyl]benzamide

By the procedure of Example 2 (Step B), the title compound of Example 3 (Step A) (2.73 g, 7.7 mmol) was hydrogenated to afford 2.4 g of the title compound as a semisolid.

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.3 (s,3H), 2.5 (s,3H), 6.6 (m,2H), 7.1 (m,6H), 7.4 (bs,1H), 8.0 (m,1H).

Step C: Preparation of 2-Methyl-6-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]-N-[2-methyl-4-(trifluoromethoxy)phenyl]benzamide

Isobutyryl chloride (0.16 g, 1.2 mmol) was added to a solution containing the title compound of Step B (0.2 g, 0.6 mmol) and *N,N*-diisopropylethylamine (0.16 g, 1.2 mmol) in dichloromethane (5 mL). After the reaction was stirred at 25 °C overnight, the suspension was poured into water and extracted several times with ethyl acetate. The combined extracts were dried over magnesium sulfate and evaporated under reduced pressure to yield 0.13 g of the title compound, a compound of the invention, as a solid; m.p. > 230 °C.

¹H NMR (DMSO-*d*₆) δ 1.0 (d,6H), 2.3 (s,3H), 2.4 (s,3H), 2.6 (m,1H), 7.1 (m,1H), 7.2-7.4 (m,4H), 7.7 (m,1H), 9.3 (s,1H), 9.8 (s,1H).

EXAMPLE 4

3-Chloro-2-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]-N-[4-(trifluoromethoxy)phenyl]benzamideStep A: Preparation of 3-Chloro-2-nitro-N-[4-(trifluoromethoxy)phenyl]benzamide

Phosphorus pentachloride (2.14 g, 10.2 mmol) was added portionwise to a mixture of 3-chloro-2-nitrobenzoic acid (2.0 g, 9.7 mmol) in dichloromethane (30 mL). After the

WO 03/026415

PCT/US02/29468

addition was complete and gas evolution ceased, the solution was stirred at room temperature for 0.5 h then evaporated under reduced pressure. Residual phosphorus oxychloride was further removed under reduced pressure with toluene to yield 2.1 g of the corresponding benzoyl chloride as a solid. A solution containing the benzoyl chloride (1.0 g, 4.4 mmol) in dichloromethane (10 mL) was added dropwise to a solution containing 4-trifluoromethoxyaniline (0.79 g, 4.4 mmol) and triethylamine (0.45 g, 4.4 mmol) in dichloromethane (3 mL). The suspension was stirred at room temperature for 0.5 h then poured into excess water and extracted several times with ethyl acetate. The combined organic extracts were washed with water, dried over magnesium sulfate and evaporated under reduced pressure to yield a solid. This solid was washed with hexane:diethyl ether (1:1) to yield 1.38 g of the title compound as a solid; m.p. 171-172 °C.

¹H NMR (CDCl₃) δ 7.2 (m,3H), 7.5-7.7 (m,4H), 7.8 (bs,1H).

Step B: Preparation of 2-Amino-3-chloro-N-[4-(trifluoromethoxy)phenyl]benzamide

To a solution of sodium borohydride (26 mg, 0.68 mmol) in ethanol (1 mL) was added a suspension containing copper(II) acetylacetonate (20.0 mg, 0.08 mmol) in 2-propanol (1 mL), followed by a suspension containing the title compound of Step A (0.25 g, 0.6 mmol) in 2-propanol (3 mL), followed by a solution of sodium borohydride (2.0 mg, 78 mmol) in ethanol (2 mL). The reaction mixture was stirred at 25 °C for 7 h, then poured into dilute aqueous ammonium chloride and extracted several times with ethyl acetate. The combined organic extracts were dried over magnesium chloride and evaporated under reduced pressure to yield 0.18 g of the title compound.

¹H NMR (CDCl₃) δ 7.3 (m,5H), 7.4 (m,2H), 7.6 (m,2H), 7.8 (bs,1H).

Step C: Preparation of 3-Chloro-2-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]-N-[4-(trifluoromethoxy)phenyl]benzamide

Isobutyryl chloride (57 mg, 0.5 mmol) was added to a mixture of the title compound of Step B (0.18 g, 0.5 mmol) and triethylamine (54.0 mg, 0.5 mmol) in dichloromethane (3 mL). After stirring for 1.5 h an additional 5 drops of isobutyryl chloride and 5 drops of triethylamine were added. The suspension was stirred for 2 h then poured into water and extracted several times with ethyl acetate. The combined extracts were washed with water and then dried over magnesium sulfate and evaporated under reduced pressure. The residue was further purified by flash column chromatography on silica gel with hexane:ethyl acetate (2:1) as eluants to yield 40.0 mg of the title compound, a compound of the invention, as a solid; m.p. 230-233 °C.

¹H NMR (DMSO-D₆) δ 1.0 (d,6H), 2.6 (m,1H), 7.3-7.4 (m,3H), 7.5 (m,1H), 7.7 (m,1H), 7.8 (m,2H), 9.6 (s,1H), 10.4 (s,1H).

WO 03/026415

PCT/US02/29468

EXAMPLE 5

1-(3-Chloro-pyridinyl)-N-[2-methyl-6-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamideStep A: Preparation of 1-(3-Chloro-pyridinyl)-N-(2-methyl-6-nitrophenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide

To a suspension of 1-(3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxylic acid (2.875 g, 9.86 mmol) stirring in dichloromethane (30 mL) at 0 °C was added oxalyl chloride (5.16 mL, 59.2 mmol) dropwise followed by *N,N*-dimethylformamide (1 drop). The stirred solution was then heated to reflux and after stirring at this temperature for 1 hour, the solution was concentrated to dryness under reduced pressure. The residue was then dissolved in tetrahydrofuran (30 mL) and to the stirred solution was added 2-methyl-6-nitroaniline. The solution was then cooled to 0 °C and *N,N*-diisopropylethylamine (8.60 mL, 49.3 mmol) was added dropwise. The stirred solution was then heated to reflux, and was stirred at this temperature for 42 hours then concentrated to dryness under reduced pressure. The residue was then dissolved in ethyl acetate (30 mL), and the solution was washed with 1N HCl (10 mL), saturated aqueous sodium hydrogencarbonate (10 mL) and brine (10 mL), dried (MgSO₄) and concentrated under reduced pressure to leave a yellow solid. This product was dissolved in acetonitrile (6 mL) with stirring, aqueous ammonia (6 mL) was added and the solution was stirred at ambient temperature for 2 hours and then concentrated to dryness under reduced pressure. The product was purified by flash column chromatography over silica gel (3:1 heptanes-ethyl acetate eluent) to give the title compound as a yellow solid (1.53 g).

¹H NMR (CDCl₃) δ 2.21 (s, 3H), 7.18 (s, 1H), 7.27 (t, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 8.42 (dd, 1H), 9.16 (s, 1H).

Step B: Preparation of N-(2-Amino-6-methylphenyl)-1-(3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide

A flask containing a stirring suspension of 10% Pd on carbon (69 mg) in ethanol (5 mL) was evacuated / filled with nitrogen (x 3). To the suspension was then added a solution of 1-(3-chloro-pyridinyl)-N-(2-methyl-6-nitrophenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide (i.e. the product of Step A) (1.38 g, 3.25 mmol) in ethanol (9 mL). The flask was then evacuated / filled with nitrogen (x 3) then evacuated / filled with hydrogen (x 3). The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 18 hours then filtered through Celite® and the filter bed was washed with ethanol (2 x 3 mL). The filtrate was concentrated under reduced pressure to give the title compound as an off-white solid (1.306 g).

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Step C: Preparation of 1-(3-Chloro-pyridinyl)-N-[2-methyl-6-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide

To a stirred solution of isobutyryl chloride (0.053 mL, 0.505 mmol) in tetrahydrofuran was added *N*-(2-amino-6-methylphenyl)-1-(3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide (i.e. the product of Step B) (0.20 g, 0.505 mmol). The solution was then cooled to 0 °C, and diisopropylethylamine (0.60 mL, 3.59 mmol) was added dropwise. The stirred solution was then allowed to warm to ambient temperature over 18 hours, and was then concentrated to dryness under reduced pressure. The residue was then dissolved in ethyl acetate (10 mL), and the solution was washed with 1N HCl (10 mL), saturated aqueous sodium hydrogen carbonate (10 mL) and brine (10 mL), dried (MgSO₄) and concentrated under reduced pressure to leave a yellow solid. This product was purified by slurring in hot *tert*-butyl methyl ether (5 mL) to give the title compound, a compound of the invention, as a solid (216 mg) melting at 215-217 °C.

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.11 (s, 3H), 1.13 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.44 (m, 1H), 6.89 (dd, 1H), 7.05 (s, 1H), 7.07 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.81 (dd, 1H), 8.41 (dd, 1H), 9.06 (s, 1H).

EXAMPLE 6

1-(3-Chloro-2-pyridinyl)-N-[3-methyl-2-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide

Step A: Preparation of 2-Methyl-N-(2-methyl-6-nitrophenyl)-propanamide

To a solution of 2-methyl-6-nitroaniline (2.5 g, 16.4 mmol) stirring in dichloromethane (22.5 mL) at 0 °C was added pyridine (2.5 mL) followed by isobutyryl chloride (1.72 mL, 16.4 mmol) dropwise. The solution was allowed to warm to ambient temperature over 2 hours. After stirring at ambient temperature for a further 48 hours, dichloromethane (10 mL) was added followed by saturated aqueous sodium hydrogencarbonate (30 mL). The aqueous phase was then separated and extracted with dichloromethane (20 mL). The organic extracts were then combined, dried (MgSO₄) and concentrated under reduced pressure to give the title compound as a yellow solid (3.54 g).

Step B: Preparation of N-(2-Amino-6-methylphenyl)-2-methylpropanamide

A flask containing a stirred suspension of 10% Pd on carbon (25 mg) in ethanol (5 mL) was evacuated / filled with nitrogen (x 3). To the suspension was then added a solution of 2-methyl-N-(2-methyl-6-nitrophenyl)-propanamide (i.e. the product of Step A) (2.54 g, 11.4 mmol) in ethanol (45 mL). The flask was then evacuated / filled with nitrogen (x 3) then evacuated / filled with hydrogen (x 3). The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 35 minutes then filtered through Celite® and the filter bed was

WO 03/026415

PCT/US02/29468

washed with ethanol (2 x 5 mL). The filtrate was concentrated under reduced pressure to give the title compound as an off-white solid (2.19 g).

Step C: Preparation of 1-(3-Chloro-pyridinyl)-N-[3-methyl-2-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxamide

To a suspension of 1-(3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxylic acid (0.1 g, 0.42 mmol) stirring in dichloromethane (4 mL) at 0 °C was added oxalyl chloride (0.31 g, 2.44 mmol) dropwise followed by *N,N*-dimethylformamide (1 drop). The stirred solution was then heated to reflux and after stirring at this temperature for 1 hour, the solution was concentrated to dryness under reduced pressure. The residue was then dissolved in tetrahydrofuran (10 mL) and to the stirred solution was added *N*-(2-amino-6-methylphenyl)-2-methylpropanamide (i.e. the product of Step B). The solution was then cooled to 0 °C and *N,N*-diisopropylethylamine (0.52 mL, 2.99 mmol) was added dropwise. The solution was then allowed to warm to ambient temperature over 18 hours, and concentrated to dryness under reduced pressure. The residue was then dissolved in ethyl acetate (10 mL), and the solution was washed with 1N HCl (10 mL), saturated aqueous sodium hydrogen carbonate (10 mL) and brine (10 mL), dried (MgSO₄) and concentrated under reduced pressure to leave a yellow solid. This product was purified by flash column chromatography over silica gel (1:1 heptanes-ethyl acetate eluent) then by recrystallisation from ethyl acetate to give the title compound, a compound of the invention, as a solid (70 mg) melting at 219-220 °C.

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.27 (s, 3H), 1.29 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.66 (m, 1H), 7.02 (s, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.39 (m, 1H), 7.84 (dd, 1H), 8.44 (dd, 1H), 9.50 (s, 1H).

Example 7

N-[1-(2-Chlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl]-2-methyl-6-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]benzamide

Step A: Preparation of 4,4,4-trifluoro-3-oxo-butanenitrile (alternatively named 4,4,4-trifluoroacetoacetonitrile)

To a 500 mL 3-necked-flask equipped with a nitrogen bubbler and two septa was added lithium diisopropylamide (LDA) (18.4 mL, 0.172 mol, 2M in heptanes), and the reaction mixture was cooled to -72 °C. A 0 °C solution of trifluoromethyl acetate (10.0 g, 0.078 mol), acetonitrile (6.41 g, 0.156 mol), and THF (100 mL) was added dropwise under nitrogen using an addition funnel. After 45 minutes, the solution was allowed to warm to room temperature over 1 to 2 hours, quenched with cold water (250 mL), and the organic solvents evaporated. The aqueous layer was then washed with diethyl ether (3 x 250 mL), acidified to pH 2 with concentrated HCl and washed with methylene chloride (3 x 250 mL).

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Subsequently, the aqueous layer was extracted with diethyl ether (3 x 250 mL). The diethyl ether extraction was dried with sodium sulfate and concentrated to afford the title compound as a clear, orange oil (1.38 g, 0.010 mol, 32% yield).

¹H NMR (CD₃OD, 300 MHz) δ 2.96 (2H, s).

5 **Step B:** Preparation of 1-(2-Chlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-amine

To a Personal Chemistry (Personal Chemistry Inc., Boston, MA, USA) 10 mL reaction vessel was added 2-chlorophenylhydrazine (0.392 g, 2.19 mmol), ethanol (2.5 mL), and 5 drops of glacial acetic acid. A solution of 4,4-trifluoro-3-oxo-butanenitrile (i.e. the product of Step A) (0.300 g, 2.19 mmol) in ethanol (1 mL) was added and the tube was then sealed and heated at 150 °C for 30 minutes in the microwave. The resulting crude mixture was concentrated and purified using silica gel chromatography (ethyl acetate/hexane, 1:4), to afford the title compound as a yellow solid (0.179 g, 0.684 mmol, 31% yield).

¹H NMR (CDCl₃, 300 MHz) δ 3.82 (2H, br), 5.85 (1H, s), 7.45-7.60 (4H, m).

10 **Step C:** Preparation of 5-Methyl-2-(1-methylethyl)-4H-3,1-benzoxazin-4-one

15 To a 500 mL round bottom flask was added 2-amino-6-methylbenzoic acid (5.00 g, 0.033 mol) and THF (200 mL). Isobutyl chloride (7.049 g, 0.066 mol) and triethylamine (10.04 g, 0.099 mol) were added and the reaction mixture was stirred at room temperature overnight. After removal of the solvent, the compound was purified by silica gel chromatography (ethyl acetate/hexane, 1:9), to yield the title compound as a white solid (4.85 g, 0.024 mol, 72% yield).

20 ¹H NMR (CDCl₃, 300 MHz) δ 1.35 (6H, d), 2.78 (3H, s), 2.90 (1H, septet), 7.21 (1H, d), 7.40 (1H, d), 7.64 (1H, t).

Step D: Preparation of N-[1-(2-Chlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-5-yl]-2-methyl-6-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]benzamide

25 Sodium hydride (0.2 g, 7.9 mmol, 95% purity) was added under nitrogen to a 10 mL flask charged with 1-(2-chlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-amine (i.e. the product of Step B) (0.200 g, 0.76 mmol) and DMF (5 mL). After stirring at room temperature for 5 minutes, 5-methyl-2-(1-methylethyl)-4H-3,1-benzoxazin-4-one (i.e. the product of Step C) (0.155 g, 0.76 mmol) was added. The reaction was monitored by TLC (Thin Layer Chromatography), quenched with 10 drops of water and purified directly by silica gel preparative TLC (1:4 ethyl acetate/hexane) to yield the title compound, a compound of the invention, as a white solid (0.135 g, 0.29 mmol, 38% yield).

30 ¹H NMR (CDCl₃, 300 MHz) δ 1.08 (6H, d), 2.14 (3H, s), 2.38 (1H, m), 6.91 (1H, d), 7.07 (1H, s), 7.02 (1H, t), 7.41-7.59 (5H, m), 8.28 (1H, br), 8.36 (1H, br).

35 The following Example 8 illustrates an preparation of 1-(3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxylic acid, which can be used to prepare, for example,

WO 03/026415

PCT/US02/29468

1-(3-chloro-pyridinyl)-*N*-[2-methyl-6-[(2-methyl-1-oxopropyl)amino]phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1*H*-pyrazole-5-carboxamide, by further steps illustrated in Examples 5.

EXAMPLE 8

Preparation of 1-(3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1*H*-pyrazole-5-carboxylic acid

5 Step A: Preparation of 3-chloro-2(1*H*)-pyridinone (2,2,2-trifluoro-1-methylethylidene)hydrazone

1,1,1-Trifluoroacetone (7.80 g, 69.6 mmol) was added to 3-chloro-2(1*H*)-pyridinone hydrazone (alternatively named (3-chloro-pyridin-2-yl)-hydrazine) (10 g, 69.7 mmol) at 20–25 °C. After the addition was complete, the mixture was stirred for about 10 minutes. The solvent was removed under reduced pressure and the mixture partitioned between ethyl acetate (100 mL) and saturated aqueous sodium carbonate solution (100 mL). The organic layer was dried and evaporated. Chromatography on silica gel (eluted with ethyl acetate) gave the product as an off-white solid (11 g, 66% yield), m.p. 64–64.5 °C (after crystallization from ethyl acetate/hexanes).

15 IR (nujol) ν 1629, 1590, 1518, 1403, 1365, 1309, 1240, 1196, 1158, 1100, 1032, 992, 800 cm^{-1} .

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.12 (s, 3H), 6.91–6.86 (m, 1H), 7.64–7.61 (m, 1H), 8.33–8.32 (m, 2H). MS m/z 237 (M^+).

20 Step B: Preparation of ethyl hydrogen ethanedioate (3-chloro-2-pyridinyl)(2,2,2-trifluoro-1-methylethylidene)hydrazide (alternatively named ethyl hydrogen ethanedioate (3-chloro-2-pyridinyl)(2,2,2-trifluoro-1-methylethylidene)hydrazine)

Triethylamine (20.81 g, 0.206 mol) was added to 3-chloro-2(1*H*)-pyridinone (2,2,2-trifluoro-1-methylethylidene)hydrazone (i.e. the product of Step A) (32.63 g, 0.137 mol) in dichloromethane (68 mL) at 0 °C. Ethyl chlorooxacetate (18.75 g, 0.137 mol) in dichloromethane (69 mL) was added dropwise to the mixture at 0 °C. The mixture was allowed to warm to 25 °C over about 2 hours. The mixture was cooled to 0 °C and a further portion of ethyl chlorooxacetate (3.75 g, 27.47 mmol) in dichloromethane (14 mL) was added dropwise. After about an additional 1 hour, the mixture was diluted with dichloromethane (about 450 mL), and the mixture was washed with water (2 x 150 mL). The organic layer was dried and evaporated. Chromatography on silica gel (eluted with 1:1 ethyl acetate–hexanes) gave the product as a solid (42.06 g, 90% yield), m.p. 73.0–73.5 °C (after crystallization from ethyl acetate/hexanes).

35 IR (nujol) ν 1751, 1720, 1664, 1572, 1417, 1361, 1330, 1202, 1214, 1184, 1137, 1110, 1004, 1043, 1013, 942, 807, 836 cm^{-1} .

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$, 115 °C) 1.19 (t, 3H), 1.72 (br s, 3H), 4.25 (q, 2H), 7.65 (dd, $J = 8.3$, 4.7 Hz, 1H), 8.20 (dd, $J = 7.6$, 1.5 Hz, 1H), 8.55 (d, $J = 3.6$ Hz, 1H).

WO 03/026415

PCT/US02/29468

MS m/z 337 (M^+).

Step C: Preparation of ethyl 1-(3-chloro-2-pyridinyl)-4,5-dihydro-5-hydroxy-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxylate

- 5 Ethyl hydrogen ethanedioate (3-chloro-2-pyridinyl)(2,2,2-trifluoro-1-methyl-ethylidene)hydrazide (i.e. the product of Step B) (5 g, 14.8 mmol) in dimethyl sulfoxide (25 mL) was added to tetrabutylammonium fluoride hydrate (10 g) in dimethyl sulfoxide (25 mL) over 8 hours. When the addition was complete, the mixture was poured into acetic acid (3.25 g) in water (25 mL). After stirring at 25 °C overnight, the mixture was then extracted with toluene (4 x 25 mL), and the combined toluene extracts were washed with
- 10 water (50 mL), dried and evaporated to give a solid. Chromatography on silica gel (eluted with 1:2 ethyl acetate-hexanes) gave the product as a solid (2.91 g, 50% yield, containing about 5% of 3-chloro-2(1H)-pyridinone (2,2,2-trifluoro-1-methylethylidene)hydrazone), m.p. 78–78.5 °C (after recrystallization from ethyl acetate/hexanes).
- 15 IR (nujol) ν 3403, 1726, 1618, 1582, 1407, 1320, 1293, 1260, 1217, 1187, 1150, 1122, 1100, 1067, 1013, 873, 829 cm^{-1} .
- ^1H NMR (CDCl_3) δ 1.19 (s, 3H), 3.20 (1/2 of ABZ pattern, J = 18 Hz, 1H), 3.42 (1/2 of ABZ pattern, J = 18 Hz, 1H), 4.24 (q, 2H), 6.94 (dd, J = 7.9, 4.9 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 7.7, 1.5 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 4.7, 1.5 Hz, 1H).

MS m/z 319 (M^+).

- 20 Step D: Preparation of ethyl 1-(3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxylate

- Sulfuric acid (concentrated, 2 drops) was added to ethyl 1-(3-chloro-2-pyridinyl)-4,5-dihydro-5-hydroxy-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-5-carboxylate (i.e. the product of Step C) (1 g, 2.96 mmol) in acetic acid (10 mL) and the mixture was warmed to 65 °C for
- 25 about 1 hour. The mixture was allowed to cool to 25 °C and most of the acetic acid was removed under reduced pressure. The mixture was partitioned between saturated aqueous sodium carbonate solution (100 mL) and ethyl acetate (100 mL). The aqueous layer was further extracted with ethyl acetate (100 mL). The combined organic extracts were dried and evaporated to give the product as an oil (0.66 g, 77% yield).
- 30 IR (neat) ν 3147, 2986, 1734, 1577, 1547, 1466, 1420, 1367, 1277, 1236, 1135, 1082, 1031, 973, 842, 802 cm^{-1} .
- ^1H NMR (CDCl_3) δ 1.23 (t, 3H), 4.25 (q, 2H), 7.21 (s, 1H), 7.48 (dd, J = 8.1, 4.7 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 6.6, 2 Hz, 1H), 8.53 (dd, J = 4.7, 1.5 Hz, 1H).
- MS m/z 319 (M^+).

WO 03/026415

PCT/US02/29468

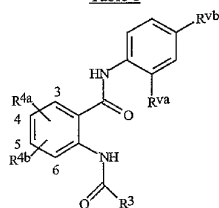
Step E: Preparation of 1-(3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1*H*-pyrazole-5-carboxylic acid

Potassium hydroxide (0.5 g, 85%, 2.28 mmol) in water (1 mL) was added to ethyl 1-(3-chloro-2-pyridinyl)-3-(trifluoromethyl)-1*H*-pyrazole-5-carboxylate (i.e. the product of Step D) (0.66 g, 2.07 mmol) in ethanol (3 mL). After about 30 minutes, the solvent was removed under reduced pressure, and the mixture was dissolved in water (40 mL). The solution was washed with ethyl acetate (20 mL). The aqueous layer was acidified with concentrated hydrochloric acid and was extracted with ethyl acetate (3 x 20 mL). The combined extracts were dried and evaporated to give the product as a solid (0.53 g, 93% yield), m.p. 178–179 °C (after crystallization from hexanes–ethyl acetate). IR (nujol) ν 1711, 1586, 1565, 1550, 1440, 1425, 1292, 1247, 1219, 1170, 1135, 1087, 1059, 1031, 972, 843, 816 cm^{-1} .

$^1\text{H NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ 7.61 (s, 1H), 7.77 (m, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.60 (s, 1H).

By the procedures described herein together with methods known in the art, the following compounds of Tables 1 to 20 can be prepared. The following abbreviations are used in the Tables which follow: *t* is tertiary, *s* is secondary, *n* is normal, *i* is iso, *c* is cyclo, Me is methyl, Et is ethyl, Pr is propyl, *i*-Pr is isopropyl, Bu is butyl, Ph is phenyl, OMe is methoxy, OEt is ethoxy, SMe is methylthio, SEt is ethylthio, CN is cyano, and $\text{S}(\text{O})_2\text{Me}$ is methylsulfonyl.

Table 1



R^3	R^{4a}	R^{4b}	R^{va}	R^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF_3
Et	3-Me	5-Me	H	OCF_3
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF_3
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>i</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>i</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>i</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>i</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>i</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>i</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OBt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et

WO 03/026415

PCT/US02/29468

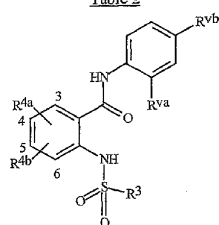
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 2



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me

WO 03/026415

PCT/US02/29468

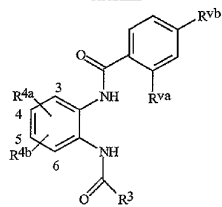
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCH ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 3



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMc
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

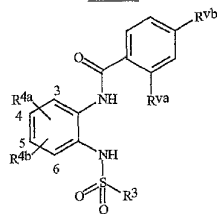
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 4



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OBt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OMe
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

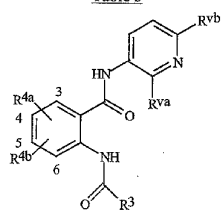
PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Table 5



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
<i>i</i> -Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>t</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMc
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl

WO 03/026415

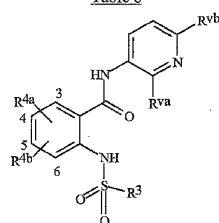
PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Table 6



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ H ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCF ₂ F ₂
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCF ₂ F ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OBt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SClF ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SClF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OBt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃

WO 03/026415

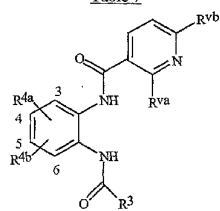
PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Table 7



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OBt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCH ₂ F ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCH ₂ F ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

113

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>i</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>i</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>i</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHE ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃

WO 03/026415

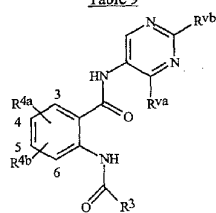
PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Table 9



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OBt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃

WO 03/026415

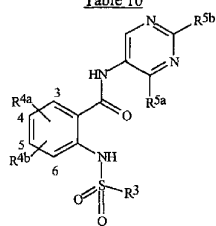
PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Table 10



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OBt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃

WO 03/026415

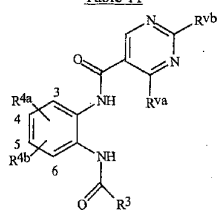
PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Table 11



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	Cl	CF ₃
Et	3-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Me	H	Me	OEt
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Et
propargyl	3-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	OCF ₃
Me	3-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	H	Br
Et	3-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Ph	Cl
Et	3-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃

WO 03/026415

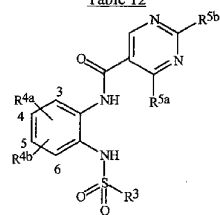
PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Table 12



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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Me	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Cl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Et	6-Me	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Me	H	Me	OEt
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Et
propargyl	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Me	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	Br
Et	6-Me	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	Cl
Et	6-Me	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	Cl
Me	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	H	CF ₃
Et	3-Br	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	Br
Me	3-Cl	H	Et	Br
Et	3-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	I
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	3-F	H	Me	SCHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	3-Br	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OMe
Me	3-Cl	H	Me	OEt
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Et
propargyl	3-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	OCHF ₂
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	OCF ₃
Me	3-F	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	Br
Et	3-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	SCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	Cl
Et	3-Cl	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	Cl
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	H	CF ₃
Et	6-Br	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	Br
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Cl	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	I
propargyl	6-Cl	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
Me	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Cl	H	Cl	CF ₃
Et	6-F	H	F	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SMe
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	OMe
Me	6-Cl	H	Me	OEt
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Et
propargyl	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SO ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
Et	6-Cl	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	OCHF ₂
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	OCF ₃
Me	6-Cl	H	H	OCF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	SCF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	H	Br
Et	6-Cl	H	H	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	SCF ₃

WO 03/026415

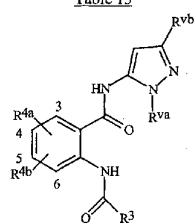
PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	Ph	Cl
Et	6-F	H	Ph	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	2-ClPh	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	Cl
Me	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
propargyl	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2-MePh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2-CNPh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
Me	6-Cl	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Table 13



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₃
Et	3-Me	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	OEi
Me	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Et	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	OCF ₂ CHF ₂
propargyl	3-Me	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Me	SO ₂ Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	CHF ₂	CF ₃
Me	3-Me	H	CHF ₂	Me
Et	3-Me	H	Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Ph	Br
cyclopropyl	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	2-ClPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	OCF ₃
Me	3-Me	H	2-ClPh	Br
Et	3-Me	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	2-ClPh	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-BrPh	CF ₃
propargyl	3-Me	H	2-MePh	CF ₃
Et	3-Me	H	2-CNPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-FPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Et	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
propargyl	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF ₂ CHF ₂
propargyl	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF ₃	Me
Me	6-Me	H	Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
propargyl	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
propargyl	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	Me	Br
Et	3-Br	5-Me	Et	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl
Me	3-Cl	H	Me	I
Et	3-Cl	H	Me	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	3-Cl	H	Me	SCF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
Me	3-F	H	Me	C ₂ F ₅
Et	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF ₃	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	CF ₃	Me
Et	3-Cl	H	Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br
Me	3-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Et	3-CN	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	3-F	H	2-MePh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
propargyl	3-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
propargyl	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
propargyl	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Et	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	Me	SMe
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

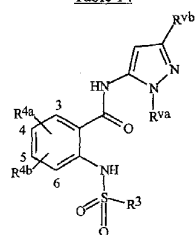
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-I	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF ₃	Me
propargyl	6-Cl	H	Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 14



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	OCF ₃
Et	3-Me	H	Me	SMe

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF ₂ CHF ₂
propargyl	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF ₃	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF ₃	Me
Me	6-Me	H	Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
propargyl	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
propargyl	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	Me	Br
Et	3-Br	5-Me	Et	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl
Me	3-Cl	H	Me	I

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Cl	H	Me	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	Me	SCF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
Me	3-F	H	Me	C ₂ F ₅
Et	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OBt
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF ₃	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	CF ₃	Me
Et	3-Cl	H	Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br
Me	3-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Et	3-CN	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	3-F	H	2-MePh	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
propargyl	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
propargyl	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Et	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	Me	SMe
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OMe

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-I	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF ₃	Me
propargyl	6-Cl	H	Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
propargyl	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
propargyl	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF ₃	Me
Me	6-Me	H	Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
propargyl	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
propargyl	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	Me	Br
Et	3-Br	5-Me	Et	Br

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl
Me	3-Cl	H	Me	I
Et	3-Cl	H	Me	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	Me	SCF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
Me	3-F	H	Me	C ₂ F ₅
Et	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF ₃	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	CF ₃	Me
Et	3-Cl	H	Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br
Me	3-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Et	3-CN	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	3-F	H	2-MePh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
propargyl	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
propargyl	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Et	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

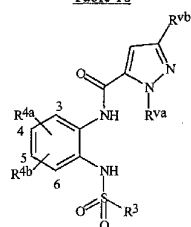
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	Me	SMe
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-I	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF ₃	Me
propargyl	6-Cl	H	Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 16



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CF ₃
Et	3-Me	5-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	Br
Me	3-Me	H	Et	Br
Et	3-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	I
propargyl	3-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	SCF ₃
Me	3-Me	5-CN	Me	SCHF ₂
Et	3-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Me	5-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
propargyl	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Me	H	H	CF ₃
Et	6-Me	4-Me	H	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	Br
Me	6-Me	H	Et	Br
Et	6-Me	H	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	I
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	SCF ₃
Me	6-Me	H	Me	SCHF ₂
Et	6-Me	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CF ₃
Me	6-Me	H	Me	SMe
Et	6-Me	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Me	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	SCF ₂ CHF ₂
propargyl	6-Me	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-Me	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	CF ₃	Me
Me	6-Me	H	Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	2-pyridyl	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	2-ClPh	Br
Me	6-Me	H	2-ClPh	Cl
Et	6-Me	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-MePh	CF ₃
propargyl	6-Me	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Me	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Me	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-Me	4-Cl	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
propargyl	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Br

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	3-Cl	H	Me	Br
Et	3-Br	5-Me	Et	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Et	Cl
Me	3-Cl	H	Me	I
Et	3-Cl	H	Me	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Me	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	Me	SCF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	OCHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
Me	3-F	H	Me	C ₂ F ₅
Et	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Et	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	SMe
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	OMe
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Me	OEt
Me	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Et	3-Br	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	Et
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	OCF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	Me	SCF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	SO ₂ Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	CF ₃	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	CF ₃	Me
Et	3-Cl	H	Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Ph	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Ph	Br
Me	3-Cl	H	2-pyridyl	CF ₃
Et	3-CN	H	2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	2-ClPh	Br
Et	3-Cl	H	2-ClPh	Cl
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
Me	3-F	H	2-MePh	CF ₃
Et	3-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	2-FPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
Et	3-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
Me	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Cl	5-Cl	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-I	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
Me	3-Cl	5-Me	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
propargyl	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl
Me	6-Cl	H	Et	Br
Et	6-Br	4-Me	Me	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	I
Me	6-Cl	H	Me	CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	OCF ₃
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	SCF ₃
propargyl	6-Cl	H	Me	SCHF ₂
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

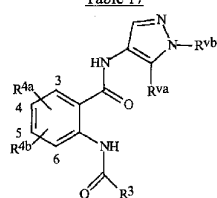
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
Et	6-Cl	H	Et	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	Me	SMe
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	OMe
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OEt
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
Me	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
Et	6-F	H	Me	Et
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	OCF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	SCF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	SO ₂ Me
Et	6-I	H	Me	SO ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	CF ₃	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	CF ₃	Me
propargyl	6-Cl	H	Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Ph	Br
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-pyridyl	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	OCF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	2-ClPh	Br
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	2-ClPh	Cl
Et	6-Cl	H	2-ClPh	SCHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-BrPh	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	2-MePh	CF ₃
Me	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-FPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	2,6-F ₂ Ph	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₃
Et	6-Cl	H	2-MeOPh	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	OCF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
cyclopropyl	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	Br
Et	6-F	H	3-Cl-2-pyridyl	Cl
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	SCHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
Me	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Br	4-Cl	3-Me-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	OCF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Br
propargyl	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	Cl

Table 17



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CHF ₂
Et	3-Me	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF ₂
propargyl	3-Me	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	3-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	3-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF ₂
Me	3-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Me	H	Et	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
Me	3-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF ₂
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
Me	6-Me	H	H	CHF ₂
Et	6-Me	4-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF ₂
propargyl	6-Me	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	6-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF ₃
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	6-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF ₂
Me	6-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	H	CHF ₂
Et	3-Br	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF ₂
propargyl	3-Cl	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	3-Cl	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	3-Br	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF ₂
Me	3-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	3-F	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF ₂
<i>i</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>i</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Et	CHF ₂
Et	6-Br	4-Me	Me	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF ₂
<i>i</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF ₂
propargyl	6-Cl	H	Me	CBtF ₂
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	Cl	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	F	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-F	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>i</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	CF ₃	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Bu	6-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅

WO 03/026415

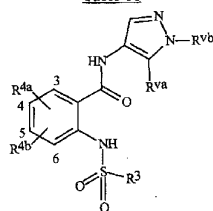
PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Et	6-F	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBtF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-pyridyl	CBtF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Table 18



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CHF ₂
Et	3-Me	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF ₂
propargyl	3-Me	H	Me	CBtF ₂
cyclopropyl	3-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	3-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF ₂
Me	3-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Me	H	Et	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
Me	3-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF ₃
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
Me	6-Me	H	H	CHF ₂
Et	6-Me	4-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF ₂
propargyl	6-Me	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	6-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF ₃
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	6-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBtF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	H	CHF ₂
Et	3-Br	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF ₂
propargyl	3-Cl	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	3-Cl	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	3-Br	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF ₂
Me	3-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	3-F	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CBF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Et	CHF ₂
Et	6-Br	4-Me	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF ₂
propargyl	6-Cl	H	Me	CBF ₂
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH ₂ C ₂ F ₅

WO 03/026415

PCT/US02/29468

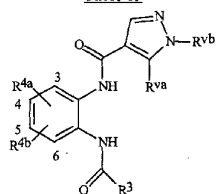
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	Cl	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	F	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-F	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	CF ₃	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Et	6-F	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂

Table 19



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Me	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF ₂
propargyl	3-Me	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	3-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	3-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF ₂
Me	3-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Me	H	Et	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
Me	3-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF ₂
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
Me	6-Me	H	H	CHF ₂
Et	6-Me	4-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF ₂
propargyl	6-Me	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	6-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF ₃
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	6-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF ₂
Me	6-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	H	CHF ₂
Et	3-Br	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF ₂
propargyl	3-Cl	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	3-Cl	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	3-Br	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF ₂
Me	3-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	3-F	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	Et	CHF ₂
Et	6-Br	4-Me	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF ₂
propargyl	6-Cl	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	Cl	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	F	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-F	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl

WO 03/026415

PCT/US02/29468

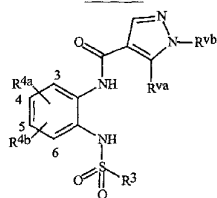
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	CF ₃	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Et	6-F	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂

Table 20



R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	H	H	CHF ₂
Et	3-Me	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CHF ₂
propargyl	3-Me	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	3-Me	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	Et

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	3-Me	5-CN	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Me	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	3-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	Me	CClF ₂
Me	3-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	3-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Me	H	Et	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	Et	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	<i>n</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Cl	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Me	5-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	C ₂ F ₅
Me	3-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	<i>i</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	Ph	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	5-Br	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
cyclopropyl	3-Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-ClPh	CHF ₂
Me	3-Me	H	2-ClPh	Et
Et	3-Me	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-CN	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Et	3-Me	H	2-MeOPh	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Me	5-I	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Et	3-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Me	5-Me	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-F-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	5-Br	3-Me-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
Me	6-Me	H	H	CHF ₂
Et	6-Me	4-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	Et	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CHF ₂
propargyl	6-Me	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	6-Me	H	Me	CH ₂ F

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{Va}	R ^{Vb}
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	Et
Me	6-Me	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Me	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-CN	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	Me	CF ₃
propargyl	6-Me	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Me	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	6-Me	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CClF ₂
Me	6-Me	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	6-Me	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Me	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	H	CF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	H	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-Br	Ph	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Me	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	Et
Et	6-Me	4-Cl	2-ClPh	CBF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	4-CN	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Me	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	6-Me	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Me	4-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CBF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Me	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	6-Me	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CCF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Me	4-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Me	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	H	CHF ₂
Et	3-Br	5-Me	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	Et	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CHF ₂
propargyl	3-Cl	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	3-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	Et
Me	3-F	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	3-Cl	H	Me	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-CN	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	Me	CF ₃
propargyl	3-Cl	H	Me	C ₂ F ₅
cyclopropyl	3-Cl	H	Et	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	<i>i</i> -Pr	CHF ₂
Me	3-Cl	H	Cl	CH ₂ CF ₃
Et	3-Br	H	F	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CClF ₂
Me	3-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	3-Cl	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-F	Me	Allyl
propargyl	3-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Cl	Me	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	3-CN	H	CF ₃	Me
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	OMe	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	5-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	C ₂ F ₅
Me	3-F	H	H	CF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Et	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	H	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	H	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-Br	Ph	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	3-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Br	H	2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	2-pyridyl	CHF ₂
Me	3-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	3-Cl	5-Cl	2-ClPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-I	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-Me	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Cl	H	2-BrPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	2-MePh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	5-CN	2-CNPh	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
Et	3-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Br	2,4-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-F	H	2,5-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
Me	3-Cl	5-I	2-MeOPh	CF ₃
Et	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	3-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	3-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	5-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-F-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Br	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
Me	3-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CClF ₂
<i>i</i> -Pr	3-Cl	5-Cl	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>i</i> -Pr	3-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Cl	H	Et	CHF ₂
Et	6-Br	4-Me	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Et	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	Cl	Me	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Me	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-F	4-Br	Me	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	CHF ₂
propargyl	6-Cl	H	Me	CBrF ₂
cyclopropyl	6-Cl	H	Me	CH ₂ F
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Me	Et
Me	6-Cl	H	Me	<i>n</i> -Pr
Et	6-Cl	H	Et	CH ₂ C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-I	4-CN	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃
propargyl	6-Cl	H	Cl	C ₂ F ₅
cyclopropyl	6-Cl	H	F	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	Me	CHF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
Et	6-F	H	Me	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	CH ₂ Cl
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	Me	CClF ₂
Me	6-Cl	H	Me	CH ₂ CH ₂ Cl
Et	6-I	H	Me	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	Me	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-F	Me	Allyl
propargyl	6-Cl	H	CF ₃	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	CF ₃	<i>i</i> -C ₃ F ₇
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	OMe	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Cl	H	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	Me
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Br	H	H	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
cyclopropyl	6-Cl	4-Br	H	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	H	C ₂ F ₅
<i>t</i> -Bu	6-F	4-Me	H	C ₂ F ₅
Me	6-Cl	H	H	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-CN	4-Cl	H	<i>n</i> -C ₃ F ₇
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	Ph	<i>i</i> -C ₃ F ₇
propargyl	6-Cl	H	Ph	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-pyridyl	CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-Br	2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
cyclopropyl	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
Et	6-F	H	2-ClPh	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-ClPh	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-ClPh	CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-ClPh	Et
Et	6-Br	4-Cl	2-BrPh	CBrF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	2-MePh	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	2-CNPh	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	H	2-FPh	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Cl	H	2,6-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	2,4-F ₂ Ph	CF ₂ CHF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	4-CN	2,5-F ₂ Ph	CH ₂ CF ₃
Me	6-Cl	H	2-MeOPh	CH ₂ CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Cl	4-Br	3-Cl-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-CN	H	3-Cl-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Me	6-Cl	4-I	3-Cl-2-pyridyl	CF ₃
Et	6-Cl	H	3-Cl-2-pyridyl	CHF ₂
<i>i</i> -Pr	6-Br	H	3-F-2-pyridyl	CBrF ₂
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-CF ₃ -2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
propargyl	6-Cl	H	3-Me-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂
Et	6-Cl	4-Br	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃
<i>i</i> -Pr	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₃
<i>t</i> -Bu	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CH ₂ CF ₃

WO 03/026415

PCT/US02/29468

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{va}	R ^{vb}
Me	6-Cl	H	3-Br-2-pyridyl	CF ₂ CHF ₂

BIOLOGICAL EXAMPLES OF THE INVENTION**Formulation/Utility**

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

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

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

Typical solid diluents are described in Watkins, et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Typical liquid diluents are described in Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950. McCutcheon's *Detergents and Emulsifiers Annual*, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, as well as Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ.

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Co., Inc., New York, 1964, list surfactants and recommended uses. All formulations can contain minor amounts of additives to reduce foam, caking, corrosion, microbiological growth and the like, or thickeners to increase viscosity.

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

Solutions, including emulsifiable concentrates, can be prepared by simply mixing the ingredients. Dusts and powders can be prepared by blending and, usually, grinding as in a hammer mill or fluid-energy mill. Suspensions are usually prepared by wet-milling; see, for example, U.S. 3,060,084. Granules and pellets can be prepared by spraying the active material upon preformed granular carriers or by agglomeration techniques. See Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 and following, and PCT Publication WO 91/13546. Pellets can be prepared as described in U.S. 4,172,714. Water-dispersible and water-soluble granules can be prepared as taught in U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 and DE 3,246,493. Tablets can be prepared as taught in U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 and U.S. 5,208,030. Films can be prepared as taught in GB 2,095,558 and U.S. 3,299,566.

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; and Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989.

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

5	<u>Example A</u>	
	<u>Wettable Powder</u>	
	Compound 1	65.0%
	dodecylphenol polyethylene glycol ether	2.0%
	sodium ligninsulfonate	4.0%
10	sodium silicoaluminate	6.0%
	montmorillonite (calcined)	23.0%
	<u>Example B</u>	
	<u>Granule</u>	
	Compound 7	10.0%
15	attapulgit granules (low volatile matter, 0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25-50 sieves)	90.0%
	<u>Example C</u>	
	<u>Extruded Pellet</u>	
	Compound 1	25.0%
20	anhydrous sodium sulfate	10.0%
	crude calcium ligninsulfonate	5.0%
	sodium alkyl naphthalenesulfonate	1.0%
	calcium/magnesium bentonite	59.0%
	<u>Example D</u>	
25	<u>Emulsifiable Concentrate</u>	
	Compound 7	20.0%
	blend of oil soluble sulfonates and polyoxyethylene ethers	10.0%
	isophorone	70.0%
30	<u>Example E</u>	
	<u>Granule</u>	
	Compound 1	0.5%
	cellulose	2.5%
	lactose	4.0%
35	cornmeal	93.0%

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Compounds of this invention are characterized by favorable metabolic and/or soil residual patterns and exhibit activity controlling a spectrum of agronomic and non-agronomic invertebrate pests. (In the context of this disclosure "invertebrate pest control" means inhibition of invertebrate pest development (including mortality) that causes significant reduction in feeding or other injury or other damage caused by the pest; related expressions are defined analogously.) As referred to in this disclosure, the term "invertebrate pest" includes arthropods, gastropods and nematodes of economic importance as pests. The term "arthropod" includes insects, mites, spiders, scorpions, centipedes, millipedes, pill bugs and symphylans. The term "gastropod" includes snails, slugs and other Stylommatophora. The term "nematode" includes all of the helminths, such as: roundworms, heartworms, and phytophagous nematodes (Nematoda), flukes (Trematoda), Acanthocephala, and tapeworms (Cestoda). Those skilled in the art will recognize that not all compounds are equally effective against all pests. Compounds of this invention display activity against economically important agronomic, forest, greenhouse, nursery, ornamentals, food and fiber, public and animal health, domestic and commercial structure, household, and stored product pests. These include larvae of the order Lepidoptera, such as armyworms, cutworms, loopers, and heliothines in the family Noctuidae (e.g., fall armyworm (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), beet armyworm (*Spodoptera exigua* Hübner), black cutworm (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), cabbage looper (*Trichoplusia ni* Hübner), tobacco budworm (*Heliothis virescens* Fabricius)); borers, casebearers, webworms, coneworms, cabbageworms and skeletonizers from the family Pyralidae (e.g., European corn borer (*Ostrinia nubilalis* Hübner), navel orangeworm (*Amyelois transitella* Walker), corn root webworm (*Crambus caliginosellus* Clemens), sod webworm (*Herpetogramma licarsialis* Walker)); leafrollers, budworms, seed worms, and fruit worms in the family Tortricidae (e.g., codling moth (*Cydia pomonella* Linnaeus), grape berry moth (*Endopiza viteana* Clemens), oriental fruit moth (*Grapholita molesta* Busck)); and many other economically important lepidoptera (e.g., diamondback moth (*Plutella xylostella* Linnaeus), pink bollworm (*Pectinophora gossypiella* Saunders), gypsy moth (*Lymantria dispar* Linnaeus)); nymphs and adults of the order Blattodea including cockroaches from the families Blattellidae and Blattidae (e.g., oriental cockroach (*Blatta orientalis* Linnaeus), Asian cockroach (*Blattella asahinai* Mizukubo), German cockroach (*Blattella germanica* Linnaeus), brownbanded cockroach (*Supella longipalpa* Fabricius), American cockroach (*Periplaneta americana* Linnaeus), brown cockroach (*Periplaneta brunnea* Burmeister), Madeira cockroach (*Leucophaea maderae* Fabricius)); foliar feeding larvae and adults of the order Coleoptera including weevils from the families Anthribidae, Bruchidae, and Curculionidae (e.g., boll weevil (*Anthonomus grandis* Boheman), rice water weevil (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), granary weevil (*Sitophilus granarius* Linnaeus), rice

WO 03/026415

PCT/US02/29468

- weevil (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)); flea beetles, cucumber beetles, rootworms, leaf beetles, potato beetles, and leafminers in the family Chrysomelidae (e.g., Colorado potato beetle (*Leptinotarsa decemlineata* Say), western corn rootworm (*Diabrotica virgifera* LeConte)); chafers and other beetles from the family Scarabaeidae (e.g., Japanese beetle
- 5 (*Popillia japonica* Newman) and European chafer (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); carpet beetles from the family Dermestidae; wireworms from the family Elateridae; bark beetles from the family Scolytidae and flour beetles from the family Tenebrionidae. In addition it includes: adults and larvae of the order Dermaptera including earwigs from the family Forficulidae (e.g., European earwig (*Forficula auricularia* Linnaeus), black earwig
- 10 (*Chelisoches morio* Fabricius)); adults and nymphs of the orders Hemiptera and Homoptera such as, plant bugs from the family Miridae, cicadas from the family Cicadidae, leafhoppers (e.g. *Empoasca* spp.) from the family Cicadellidae, planthoppers from the families Fulgoroidea and Delphacidae, treehoppers from the family Membracidae, psyllids from the family Psyllidae, whiteflies from the family Aleyrodidae, aphids from the family Aphididae,
- 15 phylloxera from the family Phylloxeridae, mealybugs from the family Pseudococcidae, scales from the families Coccidae, Diaspididae and Margarodidae, lace bugs from the family Tingidae, stink bugs from the family Pentatomidae, cinch bugs (e.g., *Blissus* spp.) and other seed bugs from the family Lygaeidae, spittlebugs from the family Cercopidae squash bugs from the family Coreidae, and red bugs and cotton stainers from the family Pyrrhocoridae.
- 20 Also included are adults and larvae of the order Acari (mites) such as spider mites and red mites in the family Tetranychidae (e.g., European red mite (*Panonychus ulmi* Koch), two spotted spider mite (*Tetranychus urticae* Koch), McDaniel mite (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)), flat mites in the family Tenuipalpidae (e.g., citrus flat mite (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), rust and bud mites in the family Eriophyidae and other foliar feeding mites and
- 25 mites important in human and animal health, i.e. dust mites in the family Epidermoptidae, follicle mites in the family Demodicidae, grain mites in the family Glycyphagidae, ticks in the order Ixodidae (e.g., deer tick (*Ixodes scapularis* Say), Australian paralysis tick (*Ixodes holocyclus* Neumann), American dog tick (*Dermacentor variabilis* Say), lone star tick (*Amblyomma americanum* Linnaeus) and scab and itch mites in the families Psoroptidae,
- 30 Pyemotidae, and Sarcoptidae; adults and immatures of the order Orthoptera including grasshoppers, locusts and crickets (e.g., migratory grasshoppers (e.g., *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), American grasshoppers (e.g., *Schistocerca americana* Drury), desert locust (*Schistocerca gregaria* Forskal), migratory locust (*Locusta migratoria* Linnaeus), house cricket (*Acheta domesticus* Linnaeus), mole crickets
- 35 (*Gryllotalpa* spp.)); adults and immatures of the order Diptera including leafminers, midges, fruit flies (Tephritidae), frit flies (e.g., *Oscinella frit* Linnaeus), soil maggots, house flies (e.g., *Musca domestica* Linnaeus), lesser house flies (e.g., *Fannia canicularis* Linnaeus, *F.*

- femoralis* Stein), stable flies (e.g., *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), face flies, horn flies, blow flies (e.g., *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), and other muscoid fly pests, horse flies (e.g., *Tabanus* spp.), bot flies (e.g., *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), cattle grubs (e.g., *Hypoderma* spp.), deer flies (e.g., *Chrysops* spp.), keds (e.g., *Melophagus ovinus* Linnaeus) and other
- 5 Brachycera, mosquitoes (e.g., *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), black flies (e.g., *Simulium* spp., *Simulium* spp.), biting midges, sand flies, sciarids, and other Nematocera; adults and immatures of the order Thysanoptera including onion thrips (*Thrips tabaci* Lindeman) and other foliar feeding thrips; insect pests of the order Hymenoptera including ants (e.g., red carpenter ant (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), black carpenter ant
- 10 (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), Pharaoh ant (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), little fire ant (*Wasmannia auropunctata* Roger), fire ant (*Solenopsis geminata* Fabricius), red imported fire ant (*Solenopsis invicta* Buren), Argentine ant (*Iridomyrmex humilis* Mayr), crazy ant (*Paratrechina longicornis* Latreille), pavement ant (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), cornfield ant (*Lasius alienus* Förster), odorous house ant (*Tapinoma sessile* Say),
- 15 bees (including carpenter bees), hornets, yellow jackets and wasps; insect pests of the order Isoptera including the eastern subterranean termite (*Reticulitermes flavipes* Kollar), western subterranean termite (*Reticulitermes hesperus* Banks), Formosan subterranean termite (*Coptotermes formosanus* Shiraki), West Indian drywood termite (*Incisitermes immigrans* Snyder) and other termites of economic importance; insect pests of the order Thysanura such
- 20 as silverfish (*Lepisma saccharina* Linnaeus) and firebrat (*Thermobia domestica* Packard); insect pests of the order Mallophaga and including the head louse (*Pediculus humanus capitis* De Geer), body louse (*Pediculus humanus humanus* Linnaeus), chicken body louse (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), dog biting louse (*Trichodectes canis* De Geer), fluff louse (*Gonicocotes gallinae* De Geer), sheep body louse (*Bovicola ovis* Schrank), short-nosed
- 25 cattle louse (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), long-nosed cattle louse (*Linognathus vituli* Linnaeus) and other sucking and chewing parasitic lice that attack man and animals; insect pests of the order Siphonoptera including the oriental rat flea (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), cat flea (*Ctenocephalides felis* Bouche), dog flea (*Ctenocephalides canis* Curtis), hen flea (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), sticktight flea (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), human flea (*Pulex irritans* Linnaeus) and other fleas afflicting mammals and
- 30 birds. Additional arthropod pests covered include: spiders in the order Araneae such as the brown recluse spider (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) and the black widow spider (*Latrodectus mactans* Fabricius), and centipedes in the order Scutigeraomorpha such as the house centipede (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). Activity also includes members of the
- 35 Classes Nematoda, Cestoda, Trematoda, and Acanthocephala including economically important members of the orders Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida, and Enoplida such as but not limited to economically important agricultural pests (i.e. root

WO 03/026415

PCT/US02/29468

knot nematodes in the genus *Meloidogyne*, lesion nematodes in the genus *Pratylenchus*, stubby root nematodes in the genus *Trichodorus*, etc.) and animal and human health pests (i.e. all economically important flukes, tapeworms, and roundworms, such as *Strongylus vulgaris* in horses, *Toxocara canis* in dogs, *Haemonchus contortus* in sheep, *Dirofilaria immitis* Leidy in dogs, *Anoplocephala perfoliata* in horses, *Fasciola hepatica* Linnaeus in ruminants, etc.).

Compounds of the invention show particularly high activity against pests in the order Lepidoptera (e.g., *Alabama argillacea* Hübner (cotton leaf worm), *Archips argyrospila* Walker (fruit tree leaf roller), *A. rosana* Linnaeus (European leaf roller) and other *Archips* species, *Chilo suppressalis* Walker (rice stem borer), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (rice leaf roller), *Crambus caliginosellus* Clemens (corn root webworm), *Crambus teterrellus* Zincken (bluegrass webworm), *Cydia pomonella* Linnaeus (codling moth), *Earias insulana* Boisduval (spiny bollworm), *Earias vittella* Fabricius (spotted bollworm), *Helicoverpa armigera* Hübner (American bollworm), *Helicoverpa zea* Boddie (corn earworm), *Heliothis virescens* Fabricius (tobacco budworm), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (sod webworm), *Lobesia botrana* Denis & Schiffmüller (grape berry moth), *Pectinophora gossypiella* Saunders (pink bollworm), *Phyllocnistis citrella* Stainton (citrus leafminer), *Pieris brassicae* Linnaeus (large white butterfly), *Pieris rapae* Linnaeus (small white butterfly), *Plutella xylostella* Linnaeus (diamondback moth), *Spodoptera exigua* Hübner (beet armyworm), *Spodoptera litura* Fabricius (tobacco cutworm, cluster caterpillar), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (fall armyworm), *Trichoplusia ni* Hübner (cabbage looper) and *Tuta absoluta* Meyrick (tomato leafminer)). Compounds of the invention also have commercially significant activity on members from the order Homoptera including: *Acyrtosiphon pisum* Harris (pea aphid), *Aphis craccivora* Koch (cowpea aphid), *Aphis fabae* Scopoli (black bean aphid), *Aphis gossypii* Glover (cotton aphid, melon aphid), *Aphis pomi* De Geer (apple aphid), *Aphis spiraecola* Patch (spirea aphid), *Aulacorthum solani* Kaltentbach (foxglove aphid), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (strawberry aphid), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (Russian wheat aphid), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (rosy apple aphid), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (woolly apple aphid), *Hyalopteris pruni* Geoffroy (mealy plum aphid), *Lipaphis erysimi* Kaltentbach (turnip aphid), *Metopolophium dirrhodum* Walker (cereal aphid), *Macrosipum euphorbiae* Thomas (potato aphid), *Myzus persicae* Sulzer (peach-potato aphid, green peach aphid), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (lettuce aphid), *Pemphigus* spp. (root aphids and gall aphids), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (corn leaf aphid), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (bird cherry-oat aphid), *Schizaphis graminum* Rondani (greenbug), *Sitobion avenae* Fabricius (English grain aphid), *Therioaphis maculata* Buckton (spotted alfalfa aphid), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (black citrus aphid), and *Toxoptera citricida* Kirkaldy (brown citrus

WO 03/026415

PCT/US02/29468

- aphid); *Adelges* spp. (adelgids); *Phylloxera devastatrix* Pergande (pecan phylloxera); *Bemisia tabaci* Gennadius (tobacco whitefly, sweetpotato whitefly), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (silverleaf whitefly), *Dialeurodes citri* Ashmead (citrus whitefly) and *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (greenhouse whitefly); *Empoasca fabae* Harris
- 5 (potato leafhopper), *Laodelphax striatellus* Fallen (smaller brown planthopper), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (aster leafhopper), *Nephotettix cincticeps* Uhler (green leafhopper), *Nephotettix nigropictus* Stål (rice leafhopper), *Nilaparvata lugens* Stål (brown planthopper), *Peregrinus maidis* Ashmead (corn planthopper), *Sogatella furcifera* Horvath (white-backed planthopper), *Sogatodes orizicola* Muir (rice delphacid), *Typhlocyba pomaria* McAtee white
- 10 apple leafhopper, *Erythroneura* spp. (grape leafhoppers); *Magacidada septendecim* Linnaeus (periodical cicada); *Icerya purchasi* Maskell (cottony cushion scale), *Quadraspidiolus perniciosus* Comstock (San Jose scale); *Planococcus citri* Risso (citrus mealybug); *Pseudococcus* spp. (other mealybug complex); *Cacopsylla pyricola* Foerster (pear psylla), *Trioza diospyri* Ashmead (persimmon psylla). These compounds also have
- 15 activity on members from the order Hemiptera including: *Acrosternum hilare* Say (green stink bug), *Anasa tristis* De Geer (squash bug), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (chinch bug), *Corythucha gossypii* Fabricius (cotton lace bug), *Cyrtopeltis modesta* Distant (tomato bug), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (cotton stainer), *Euchistus servus* Say (brown stink bug), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (one-spotted stink bug), *Graptostethus* spp. (complex of seed bugs), *Leptoglossus corculus* Say (leaf-footed pine seed bug), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (tarnished plant bug), *Nezara viridula* Linnaeus (southern green stink bug), *Oebalus pugnax* Fabricius (rice stink bug), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (large milkweed bug), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (cotton fleahopper). Other insect
- 20 orders controlled by compounds of the invention include Thysanoptera (e.g., *Frankliniella occidentalis* Pergande (western flower thrip), *Scirtothrips citri* Moulton (citrus thrip), *Sericothrips variabilis* Beach (soybean thrip), and *Thrips tabaci* Lindeman (onion thrip); and the order Coleoptera (e.g., *Leptinotarsa decemlineata* Say (Colorado potato beetle), *Epilachna varivestis* Mulsant (Mexican bean beetle) and wireworms of the genera *Agriotes*, *Athous* or *Limonius*).
- 30 Compounds of this invention can also be mixed with one or more other biologically active compounds or agents including insecticides, fungicides, nematocides, bactericides, acaricides, growth regulators such as rooting stimulants, chemosterilants, semiochemicals, repellents, attractants, pheromones, feeding stimulants, other biologically active compounds or entomopathogenic bacteria, virus or fungi to form a multi-component pesticide giving an
- 35 even broader spectrum of agricultural utility. Thus compositions of the present invention can further comprise a biologically effective amount of at least one additional biologically active compound or agent. Examples of such biologically active compounds or agents with

WO 03/026415

PCT/US02/29468

which compounds of this invention can be formulated are: insecticides such as abamectin, acephate, acetamiprid, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, bifenthrin, binfenazate, buprofezin, carbofuran, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chromafenozide, clothianidin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, 5 cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, diflubenzuron, dimethoate, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, fenothicarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenproximate, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flucythrinate, tau-fluvalinate, flufenoxuron, fonophos, halofenozide, hexaflumuron, imidacloprid, indoxacarb, isofenphos, lufenuron, malathion, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, 10 methoxychlor, monocrotophos, methoxyfenozide, nithiazin, novaluron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, pymetrozine, pyridalyl, pyriproxyfen, rotenone, spinosad, sulprofos, tebufenozide, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tralomethrin, trichlorfon and triflumuron; 15 fungicides such as acibenzolar, azoxystrobin, benomyl, blastidicid-S, Bordeaux mixture (tribasic copper sulfate), bromuconazole, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, chloroneb, chlorothalonil, copper oxychloride, copper salts, cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, (S)-3,5-dichloro-N-(3-chloro-1-ethyl-1-methyl-2-oxopropyl)-4-methylbenzamide (RH 7281), diclocymet (S-2900), diclomezine, dicloran, difenoconazole, 20 (S)-3,5-dihydro-5-methyl-2-(methylthio)-5-phenyl-3-(phenylamino)-4H-imidazol-4-one (RP 407213), dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazole, diniconazole-M, dodine, edifenphos, epoxiconazole, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fenbuconazole, fencaramid (SZX0722), fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin acetate, fentin hydroxide, fluazinam, fludioxonil, flumetover (RPA 403397), fluquinconazole, flusilazole, flutolanil, 25 flutriafol, folpet, fosetyl-aluminum, furalaxyl, furametapir (S-82658), hexaconazole, ipconazole, iprobenfos, iprodione, isoprothiolane, kasugamycin, kresoxim-methyl, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepronil, metalaxyl, metconazole, metomino-strobin/fenominostrobin (SSF-126), myclobutanil, neo-asozin (ferric methanearsonate), oxadixyl, penconazole, pencycuron, probenazole, prochloraz, propamocarb, propiconazole, 30 pyrifenoxy, pyraclostrobin, pyrimethanil, pyroquilon, quinoxifen, spiroxamine, sulfur, tebuconazole, tetraconazole, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate-methyl, thiram, tiadinil, triadimefon, triadimenol, tricyclazole, trifloxystrobin, triticonazole, validamycin and vinclozolin; nematocides such as aldicarb, oxamyl and fenamiphos; bactericides such as streptomycin; acaricides such as amitraz, chinomethionat, chlorobenzilate, cyhexatin, 35 dicofol, dienochlor, etoxazole, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben and tebufenpyrad; and biological agents such as *Bacillus*

WO 03/026415

PCT/US02/29468

thuringiensis including ssp. *atzawai* and *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin, baculovirus, and entomopathogenic bacteria, virus and fungi.

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

Of note are compositions comprising (in addition to the Formula I component and any surfactant and/or diluent) at least one additional biologically active compound or agent selected from the group consisting of abamectin, acephate, acetamiprid, amidothymol, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, bifenthrin, binfenazate, buprofezin, carbofuran, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chromafenozide, clothianidin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, diflubenzuron, dimethoate, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, fenothicarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flucythrinate, tau-fluvalinate, flufenoxuron, fonophos, halo-fenozide, hexaflumuron, imidacloprid, indoxacarb, isofenphos, lufenuron, malathion, methaldehyde, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, monocrotophos, methoxyfenozide, nithiazin, novaluron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, pymetrozine, pyridalyl, pyriproxyfen, rotenone, spinosad, sulprofos, tebufenozide, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tralomethrin, trichlorfon and triflumuron, aldicarb, oxamyl, fenamiphos, amitraz, chinomethionat, chlorobenzilate, cyhexatin, dicofol, dienochlor, etoxazole, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben, tebufenpyrad, *Bacillus thuringiensis* including ssp. *atzawai* and *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin, baculovirus, and entomopathogenic bacteria, virus and fungi.

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

WO 03/026415

PCT/US02/29468

endotoxin as well as naturally occurring and genetically modified viral insecticides including members of the family Baculoviridae as well as entomophagous fungi.

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

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

Invertebrate pests are controlled in agronomic and nonagronomic applications by applying one or more of the compounds of this invention, in an effective amount, to the environment of the pests including the agronomic and/or nonagronomic locus of infestation, to the area to be protected, or directly on the pests to be controlled. Thus, the present invention further comprises a method for controlling an invertebrate pest, comprising contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of one or more of the compounds of the invention, or with a composition comprising at least one such compound, or with a composition comprising at least one such compound and an effective amount of at least one additional biologically active compound or agent. Examples of suitable compositions comprising a compound of the invention and an effective amount of at least one additional biologically active compound or agent include granular compositions wherein the additional biologically active compound or agent is present on the same granule

WO 03/026415

PCT/US02/29468

as the compound of the invention or on granules separate from those of the compound of this invention.

A preferred method of contact is by spraying. Alternatively, a granular composition comprising a compound of the invention can be applied to the plant foliage or the soil.

5 Compounds of this invention are also effectively delivered through plant uptake by contacting the plant with a composition comprising a compound of this invention applied as a soil drench of a liquid formulation, a granular formulation to the soil, a nursery box treatment or a dip of transplants. Compounds are also effective by topical application of a composition comprising a compound of this invention to the locus of infestation. Other
10 methods of contact include application of a compound or a composition of the invention by direct and residual sprays, aerial sprays, gels, seed coatings, microencapsulations, systemic uptake, baits, ear tags, boluses, foggers, fumigants, aerosols, dusts and many others. The compounds of this invention may also be impregnated into materials for fabricating invertebrate control devices (e.g., insect netting).

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

The compounds of this invention can be applied in their pure state, but most often application will be of a formulation comprising one or more compounds with suitable carriers, diluents, and surfactants and possibly in combination with a food depending on the contemplated end use. A preferred method of application involves spraying a water
25 dispersion or refined oil solution of the compounds. Combinations with spray oils, spray oil concentrations, spreader stickers, adjuvants, other solvents, and synergists such as piperonyl butoxide often enhance compound efficacy.

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

WO 03/026415

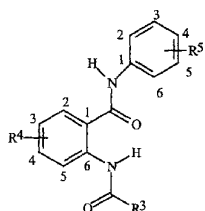
PCT/US02/29468

One skilled in the art can easily determine the biologically effective amount necessary for the desired level of invertebrate pest control.

The following Tests in the Biological Examples of the Invention demonstrate the efficacy of methods of the invention for protecting plants from specific arthropod pests.

- 5 “Control efficacy” represents inhibition of arthropod development (including mortality) that causes significantly reduced feeding. The pest control protection afforded by the compounds is not limited, however, to these species. See Index Table A for compound descriptions. The following abbreviations are used in the Index Table which follows: *t* is tertiary, *n* is normal, *i* is iso, *s* is secondary, *c* is cyclo, Me is methyl, Et is ethyl, Pr is propyl and
- 10 Bu is butyl; accordingly *i*-Pr is isopropyl, *s*-Bu is secondary butyl, etc. The abbreviation “Ex.” stands for “Example” and is followed by a number indicating in which example the compound is prepared.

Index Table A

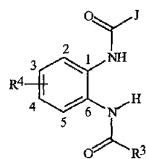


Compound	R ³	R ⁴	R ⁵	m.p. °C
1	<i>t</i> -Bu	H	2,3- <i>di</i> Me	208-209
2	<i>i</i> -Pr	H	4-OCF ₃	160-161
3 (Ex. 4)	<i>i</i> -Pr	5-Cl	4-OCF ₃	230-233
4	Me	5-Me	4-OCF ₃	224-225
5	Me	5-Me	2-Me,4-Cl	114-116
6	<i>i</i> -Pr	5-Cl	2-Me,4-Cl	>250
7 (Ex. 3)	<i>i</i> -Pr	2-Me	2-Me,4-OCF ₃	230
8	<i>t</i> -Bu	2-Me	2-Me,4-OCF ₃	200-203
9 (Ex. 2)	<i>i</i> -Pr	2-Me	2-Me,4-CF ₃	230
10	<i>i</i> -Pr	5-NO ₂	4-CF ₃	Solid
11	4-CF ₃ -Ph	5-Me	2-Me	>250

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Index Table B

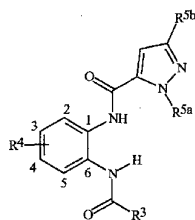


Compound	R ³	R ⁴	J	m.p.°C
12	<i>t</i> -Bu	H	2,3- <i>di</i> Me-Ph	161-164
13	<i>t</i> -Bu	H	2-CF ₃ -Ph	173-174
14	<i>i</i> -Pr	H	2,4-F-Ph	148
15	<i>i</i> -Pr	H	2,3- <i>di</i> Me-Ph	169-171
16	<i>t</i> -Bu	H	2,4- <i>di</i> F-Ph	146-149
17	<i>i</i> -Pr	5-Me	2,3- <i>di</i> Me-Ph	202-203
18	<i>i</i> -Pr	5-Me	2,6- <i>di</i> Cl-Ph	230
19	<i>i</i> -Pr	5-Me	2,4- <i>di</i> F-Ph	196
20	Me	H	2-F-Ph	Solid
21	<i>i</i> -Pr	5-Cl	2-Me,4-Cl,6-NC(O)CF ₃	203
22	<i>i</i> -Pr	5-Cl	2-Me,4-Cl,6-NC(O)CH ₃	>250
23	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-CF ₃ -Ph	solid
24	<i>t</i> -Bu	5-Me	2-F,5-CF ₃ -Ph	solid
25	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-CF ₃ -Ph	solid
26	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-OCF ₃ -Ph	solid
27	<i>i</i> -Pr	5-Me	4-CF ₃ -Ph	solid
28	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-CF ₃ -Ph	solid
29	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-CF ₃ -Ph	solid
30	<i>t</i> -Bu	5-Me	4-OCF ₃ -Ph	solid
31	<i>i</i> -Pr	5-Me	2-F,5-CF ₃ -Ph	solid
32	<i>i</i> -Pr	5-Me	4-OCF ₃ -Ph	solid
33	<i>i</i> -Pr	5-Me	4-CF ₃ -Ph	solid
34	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-CF ₃ -Ph	solid

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Index Table C

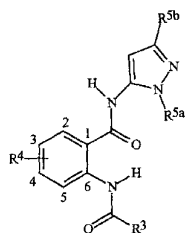


Compound	R ³	R ⁴	R ^{5a}	R ^{5b}	m.p.°C
35 (Ex. 1)	<i>i</i> -Pr	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	Solid
36	Me	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	204-205
37 (Ex. 6)	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	219-220
38	NHEt	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	185-186
39	NH <i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	191-192
40	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	205-206
41	Me	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	201-202
42	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	229-230
43	NHEt	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	187-188
44	NH <i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	195-196
45	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	201-202
46	Me	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	176-177
47	<i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	237-238
48	NHEt	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	176-177
49	NH <i>i</i> -Pr	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	192-193
50	<i>t</i> -Bu	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	196-197
51	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Br	190-191
52	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	Cl	185-186
53 (Ex. 5)	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	215-217
54	Me	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	167-168

WO 03/026415

PCT/US02/29468

Index Table D



Compound	R ³	R ⁴	R ^{5a}	R ^{5b}	m.p. °C
55	Me	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	194-195
56	<i>i</i> -Pr	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	244-246
57	<i>t</i> -Bu	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	260
58	Et	5-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	236-237
59	<i>i</i> -Pr	2-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	203-205
60	<i>t</i> -Bu	2-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	232-233
61	Et	2-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	170-172
62	Me	2-Me	2-Cl-Ph	CF ₃	212-213
63	Me	5-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	192-193
64	Me	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	236
65 (Ex. 7)	<i>i</i> -Pr	2-Me	3-Cl-2-Pyridyl	CF ₃	198

BIOLOGICAL EXAMPLES OF THE INVENTION

TEST

For evaluating control of diamondback moth (*Plutella xylostella*) the test unit consisted of a small open container with a 12-14-day-old radish plant inside. This was pre-infested with 10-15 neonate larvae on a piece of insect diet by use of a core sampler to remove a plug from a sheet of hardened insect diet having many larvae growing on it and transfer the plug containing larvae and diet to the test unit. The larvae moved onto the test plant as the diet plug dried out.

Test compounds were formulated using a solution containing 10% acetone, 90% water and 300 ppm X-77® Spreader Lo-Foam Formula non-ionic surfactant containing alkylarylpolyoxyethylene, free fatty acids, glycols and isopropanol (Loveland Industries, Inc.). The formulated compounds were applied in 1 mL of liquid through a SUJ2 atomizer

WO 03/026415

PCT/US02/29468

- nozzle with 1/8 JJ custom body (Spraying Systems Co.) positioned 1.27 cm (0.5 inches) above the top of each test unit. All experimental compounds in this screen were sprayed at 50 ppm and replicated three times. After spraying of the formulated test compound, each test unit was allowed to dry for 1 hour and then a black, screened cap was placed on top.
- 5 The test units were held for 6 days in a growth chamber at 25 °C and 70% relative humidity. Plant feeding damage was then visually assessed.

Of the compounds tested, the following provided excellent levels of plant protection (30% or less feeding damage): 11, 37, 39, 43, 47, 48, 51, 52, 53 and 63.

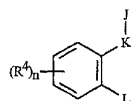
WO 03/026415

PCT/US02/29468

CLAIMS

What is claimed is:

1. A method for controlling an invertebrate pest comprising:
 - contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective
 - 5 amount of a compound of Formula I including all geometric and stereoisomers, an *N*-oxide thereof or an agriculturally suitable salt thereof



I

wherein

- J is a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or
- 10 an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is optionally substituted with 1 to 4 R⁵;
- K is —C(=A)NR²— or —NR²C(=A)—;
- L is —NR¹C(=B)—R³ or —NR¹SO₂—R³;
- A and B are independently O or S;
- 15 R¹ is H; or C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl, each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxycarbonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino and C₃-C₆ cycloalkylamino; or
- 20 R¹ is C₂-C₆ alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxycarbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl or C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl;
- R² is H, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₂-C₆ alkoxycarbonyl or C₂-C₆ alkylcarbonyl;
- 25 R³ is C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl, each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₂-C₆ alkoxycarbonyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl, C₃-C₆ trialkylsilyl, phenyl, phenoxy and 5- or 6-membered
- 30 heteroaromatic rings, each phenyl, phenoxy and 5- or 6-membered

- heteroaromatic ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R⁶; C₁-C₄ alkoxy; C₁-C₄ alkylamino; C₂-C₈ dialkylamino; C₁-C₄ alkoxy(C₁-C₄ alkyl)amino; C₃-C₆ cycloalkylamino; C₂-C₆ alkoxycarbonyl or C₂-C₆ alkylcarbonyl; or
- 5 R¹ and R³ can be taken together with -NC(=B)- or -NSO₂- moiety to which they are attached to form a ring comprising 2 to 6 atoms of carbon and optionally one additional atom of nitrogen, sulfur or oxygen, said ring optionally substituted with 1 to 4 substituents selected from the group consisting of C₁-C₂ alkyl, halogen, CN, NO₂ and C₁-C₂ alkoxy;
- 10 each R⁴ is independently H, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₃-C₆ trialkylsilyl, or a phenyl ring
- 15 optionally substituted with one to three substituents independently selected from R⁶;
- each R⁵ is independently C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₂-C₆ haloalkenyl, C₂-C₆ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, CO₂H, CONH₂, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₂-C₆ alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxycarbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl,
- 20 C₃-C₆ trialkylsilyl; or
- each R⁵ is independently a phenyl, benzyl, benzoyl, phenoxy, 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system, each phenyl, benzyl, benzoyl, phenoxy, heteroaromatic ring and aromatic fused heterobicyclic ring system optionally substituted with one to three
- 25 substituents independently selected from R⁶; or
- two R⁵ groups when attached to adjacent carbon atoms can be taken together as -OCF₂O-, -CF₂CF₂O- or -OCF₂CF₂O-;
- each R⁶ is independently C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C₂-C₄ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₃-C₆ (alkyl)cycloalkylamino, C₂-C₄
- 30
- 35

WO 03/026415

PCT/US02/29468

alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl or C₃-C₆ trialkylsilyl; and

n is 1, 2, 3 or 4;

provided that L is other than —NHC(=O)— and R³ is other than C₁-C₆ alkyl

substituted with one or more fluorine moieties.

2. The method of Claim 1 wherein K is —C(=A)NR²— and A and B are both O.

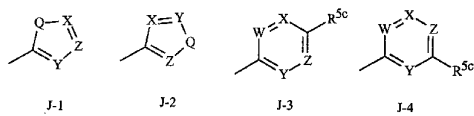
3. The method of Claim 1 wherein K is —NR²C(=A)— and A and B are both O.

4. The method of Claim 2 or Claim 3 wherein

J is a phenyl ring or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring selected from the group

consisting of J-1, J-2, J-3 and J-4, each J ring optionally substituted with 1 to 3

R⁵



Q is O, S or NR^{5c};

W, X, Y and Z are independently N or CR^{5c}, provided that in J-3 and J-4 at least one of W, X, Y or Z is N;

R¹ and R² are each independently H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl or C₂-C₆ alkoxy carbonyl;

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

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

each R⁵ is independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxy carbonyl or C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl; or

each R⁵ is independently a phenyl, benzyl or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R⁶; or

WO 03/026415

PCT/US02/29468

two R⁵ groups when attached to adjacent carbon atoms can be taken together as

-OCF₂O-, -CF₂CF₂O- or -OCF₂CF₂O-;

R^{5c} is H or R⁵;

each R⁶ is independently C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C₂-C₄ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₈ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₃-C₆ (alkyl)cycloalkylamino, C₂-C₄ alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxycarbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl or C₃-C₆ trialkylsilyl; and

n is 1 or 2.

5. The method of Claim 4 wherein

each R⁵ is R^{5a} or R^{5b};

J is substituted with R^{5a} and optionally substituted with 1 to 2 R^{5b};

R¹ and R² are each independently H or C₁-C₄ alkyl;

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

R^{5a} group is attached to the J at the position *ortho* to K;

R^{5a} and R^{5b} are each independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂,

C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄

alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄

haloalkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxycarbonyl or C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl; or a

phenyl, benzyl, or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally

substituted with one to three substituents independently selected from R⁶;

each R⁶ is independently halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄

alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ haloalkoxy;

and

p is 0, 1 or 2.

6. The method of Claim 5 wherein J is phenyl, pyrazole, pyrrole, pyridine or pyrimidine.

7. The method of Claim 6 wherein

R¹ and R² are each H;

one R⁴ is selected from the group consisting of C₁-C₃ alkyl, CF₃, OCF₃, OCHF₂,

S(O)_pCF₃, S(O)_pCHF₂ and halogen and an optional second R⁴ is selected from

the group consisting of halogen, C₁-C₃ alkyl and C₁-C₃ haloalkyl.

8. The method of Claim 7 wherein

J is J-1;

Q is NR^{5a};

WO 03/026415

PCT/US02/29468

X is N or CH;

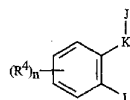
Y is CH;

Z is CR^{5b};

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

R^{5b} is halogen or CF₃.

9. A compound of Formula I including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides or agriculturally suitable salts thereof



I

10

wherein:

J is a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is substituted with one R^{5a} and optionally substituted with 1 to 3 R^{5b};

K is $—C(=A)NR^2—$ or $—NR^2C(=A)—$;

L is $—NR^1C(=B)—R^3$ or $—NR^1SO_2—R^3$;

A and B are independently O or S;

R¹ is H or C₁-C₄ alkyl;

R² is H or C₁-C₄ alkyl;

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

each R⁴ is independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄

alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄

alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl or C₁-C₄

haloalkylsulfonyl;

R^{5a} and R^{5b} are each independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN,

NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-

C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄

haloalkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxycarbonyl or C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl; or a

phenyl, benzyl, or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each phenyl, benzyl,

WO 03/026415

PCT/US02/29468

and heteroaromatic ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from R⁶;

R^{5a} is attached to the J at a position *ortho* to K;

each R⁶ is independently halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ haloalkoxy;

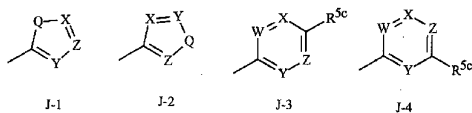
n is 1, 2, 3 or 4; and

p is 0, 1 or 2;

provided that L is other than —NHC(=O)— and R³ is other than C₁-C₆ alkyl substituted with one or more fluorine moieties.

10. The compound of Claim 9 wherein

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



15 Q is O, S or NR^{5c};

W, X, Y and Z are independently N or CR^{5c}, provided that in J-3 and J-4 at least one of W, X, Y or Z is N;

R¹ and R² are each independently H or C₁-C₄ alkyl;

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

20 each R⁴ is independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl or C₁-C₄ haloalkylsulfonyl;

R^{5a} is attached to the J at the position *ortho* to K;

25 R^{5a} and R^{5b} are each independently C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, C₂-C₄ alkoxycarbonyl or C₃-C₈ dialkylaminocarbonyl; or a phenyl, benzyl, or a 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally

30 substituted with one to three substituents independently selected from R⁶;

R^{5c} is H or one of the R^{5b} substituents;

WO 03/026415

PCT/US02/29468

each R⁶ is independently halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ haloalkoxy;
and

n is 1 or 2.

5 11. The compound of Claim 10 wherein J is J is phenyl, pyrazole, pyrrole, pyridine or pyrimidine.

12. The compound of Claim 11 wherein

R¹ and R² are each H;

one R⁴ is selected from the group consisting of C₁-C₃ alkyl, CF₃, OCF₃, OCHF₂,

10 S(O)_pCF₃, S(O)_pCHF₂ and halogen and an optional second R⁴ is selected from the group consisting of halogen, C₁-C₃ alkyl and C₁-C₃ haloalkyl.

13. The compound of Claim 12 wherein

J is J-1;

Q is NR^{5a};

15 X is N or CH;

Y is CH;

Z is CR^{5b};

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

20 haloalkoxy; and

R^{5b} is halogen or CF₃.

14. A composition for controlling an invertebrate pest comprising:

a biologically effective amount of a compound of Formula I according to Claim 1, an
N-oxide thereof or an agriculturally suitable salt thereof; and

25 at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents.

15. The composition of Claim 14 further comprising an effective amount of at least one additional biologically active compound or agent.

30 16. The composition of Claim 15 wherein the at least one additional biologically active compound or agent is selected from the group consisting of pyrethroids, carbamates, neonicotinoids, neuronal sodium channel blockers, insecticidal macrocyclic lactones, γ-aminobutyric acid (GABA) antagonists, insecticidal ureas and juvenile hormone mimics.

35 17. The composition of Claim 14 further comprising at least one additional biologically active compound or agent selected from the group consisting of abamectin, acephate, acetamiprid, amidoflumet, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, bifenthrin, binfenazate, buprofezin, carbofuran, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chromafenozide, clothianidin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin,

WO 03/026415

PCT/US02/29468

- lambda-cyhalothrin, cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, diflubenzuron, dimethoate, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, fenothicarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flucythrinate, tau-fluvalinate, flufenoxuron, fonophos, halofenozide, hexaflumuron, imidacloprid, 5 indoxacarb, isofenphos, lufenuron, malathion, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, monocrotophos, methoxyfenozide, nithiazin, novaluron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, pymetrozine, pyridalyl, pyriproxyfen, rotenone, spinosad, sulprofos, tebufenozide, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, 10 thiachloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tralomethrin, trichlorfon and triflumuron, aldicarb, oxamyl, fenamiphos, amitraz, chinomethionat, chlorobenzilate, cyhexatin, dicofol, dienochlor, etoxazole, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben, tebufenpyrad; and biological agents such as *Bacillus thuringiensis* including ssp. *aizawai* and *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* delta 15 endotoxin, baculovirus, and entomopathogenic bacteria, virus and fungi.
18. The composition of Claim 14 further comprising at least one additional biologically active compound or agent selected from the group consisting of cypermethrin, cyhalothrin, cyfluthrin and beta-cyfluthrin, esfenvalerate, fenvalerate, tralomethrin, fenothicarb, methomyl, oxamyl, thiodicarb, clothianidin, imidacloprid, thiachloprid, 20 indoxacarb, spinosad, abamectin, avermectin, emamectin, endosulfan, ethiprole, fipronil, flufenoxuron, triflumuron, diofenolan, pyriproxyfen, pymetrozine, amitraz, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin and entomophagous fungi.

【国際公開パンフレット（コレクトバージョン）】

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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
3 April 2003 (03.04.2003)

PCT

(10) International Publication Number
WO 03/026415 A3(51) International Patent Classification: C07D 231/14,
231/40, 213/61, 213/40, A01N 43/56, 37/22, 37/30

(21) International Application Number: PCT/US02/29468

(22) International Filing Date:
17 September 2002 (17.09.2002)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

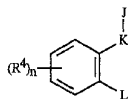
(30) Priority Data:
60/324,083 21 September 2001 (21.09.2001) US(71) Applicant (for all designated States except US): E.I. DU
PONT DE NEMOURS AND COMPANY [US/US]; 1007
Market Street, Wilmington, DE 19808 (US).(72) Inventors; and
(75) Inventors/Applicants (for US only): LAHM, George,
Philip [US/US]; 148 Fairhill Drive, Wilmington, DE
19808 (US); SELBY, Thomas, Paul [US/US]; 116 Hunter
Court, Wilmington, DE 19808 (US).(74) Agent: HEISER, David, E.; E.I. du Pont de Nemours and
Company, Legal Patent Records Center, 4417 Lancaster
Pike, Wilmington, DE 19805 (US).(81) Designated States (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GH, GM,
HN, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,
MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG,
SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) Designated States (regional): ARIPO patent (GH, GM,
KE, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, HU, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK,
TR), OAPI patent (BF, BJ, CI, CG, CL, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Declarations under Rule 4.17:

— as to applicant's entitlement to apply for and be granted
a patent (Rule 4.17(ii)) for the following designations: AE,
AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI,
GB, GD, GH, GM, HN, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KP,
KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD,
SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW; ARIPO patent (GH, GM, KE, LS,
MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian patent
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI patent (BF,
BJ, CI, CG, CL, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG)— as to the applicant's entitlement to claim the priority of the
earlier application (Rule 4.17(iii)) for all designations
of inventorship (Rule 4.17(iv)) for US onlyPublished:
with international search report(88) Date of publication of the international search report:
30 October 2003For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

WO 03/026415 A3

(54) Title: INSECTICIDAL DIAMIDES



(I)

(57) Abstract: This invention pertains to a method for controlling an invertebrate pest comprising contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a compound of Formula I including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof (e.g. in a composition comprising a compound of Formula I) wherein J is a phenyl ring, a naphthyl ring system, a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is optionally substituted with 1 to 4 R₁; K is C(=O)N(R₂) or NR₂C(=O)A; L is NR₂C(=O)B; R₃ or —NR₂SO₂— R₄; A and B are independently O or S; and R₁, R₂, R₃, R₄, and n are as defined in the disclosure. Also disclosed are certain compositions for controlling an invertebrate pest comprising a biologically effective amount of a compound of Formula I, an *N*-oxide thereof or an agriculturally suitable salt thereof. Also disclosed are certain compounds of Formula I, *N*-oxides and agriculturally suitable salts thereof.

【手続補正書】

【提出日】平成15年10月23日(2003.10.23)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

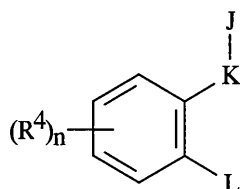
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

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

【化1】



I

(式中、

Jはフェニル環、ナフチル環系、5員環もしくは6員環の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の芳香族縮合複素二環系であり、ここで各環または環系は場合により1～4個の R^5 で置換されていてもよく、

Kは $-C(=A)NR^2-$ または $-NR^2C(=A)-$ であり、

Lは $-NR^1C(=B)-R^3$ または $-NR^1SO_2-R^3$ であり、

AおよびBは独立してOまたはSであり、

R^1 はHであるか、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、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ及び $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノよりなる群から選択される1またはそれ以上の置換基で各々置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ 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か、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または $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルであり、

R^2 は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、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルであり、

R^3 は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、 $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリル、フェニル、フェノキシ、5員環もしくは6員環の複素芳香環(フェニル、フェノキシおよび5員環もしくは6員環の複素芳香環の各々は場合により R^6 から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい)よりなる群から選択される1個またはそれ以上の置換基で各々置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ 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； $C_1 \sim C_4$ アルコキシ； $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ； $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミ

ノ； $C_1 \sim C_4$ アルコキシ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノ； $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノ； $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルであるか、あるいは

R^1 および R^3 は、それらが結合している $-NC(=B)-$ または $-NSO_2-$ 部分と一緒に、2～6 個の炭素原子と場合によりさらに 1 個の窒素、硫黄または酸素原子を含んでなる環を形成することができ、該環は場合により $C_1 \sim C_2$ アルキル、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシからなる群より選択される 1～4 個の置換基で置換されていてよく、

各 R^4 は独立して 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、 $C_3 \sim C_6$ トリアルキルシリル、または場合により R^6 から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてよいフェニル環であり、

各 R^5 は独立して $C_1 \sim C_6$ 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、 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るか、または

各 R^5 は独立してフェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシ、5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環または 8 員環、9 員環もしくは 10 員環の芳香族縮合複素二環系であり、フェニル、ベンジル、ベンゾイル、フェノキシ、複素芳香環および芳香族縮合複素二環系の各々は場合により R^6 から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてよく、あるいは

2 個の R^5 基は隣接する炭素原子と結合している場合には一緒になって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ または $-OCF_2CF_2O-$ であることができ、

各 R^6 は独立して $C_1 \sim C_4$ 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あり、

n は 1、2、3 または 4 であり、

ただし、 L は $-NHC(=O)-R^3$ 以外であり、そして R^3 は 1 個もしくはそれ以上のフッ素部分で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル以外である)

で示される、そのすべての幾何異性体および立体異性体、 N -オキシドまたは農業的に適する塩を含む化合物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。

【請求項 2】

K が $-C(=A)NR^2-$ であり、 A と B がいずれも O である、請求項 1 に記載の方法。

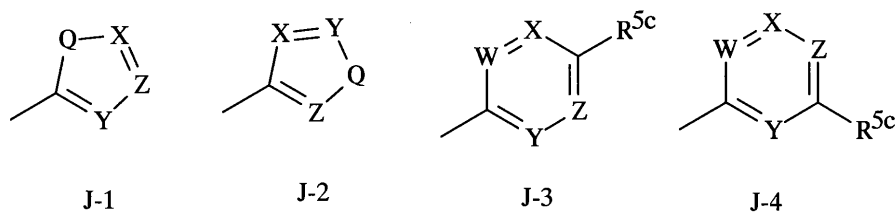
【請求項 3】

K が $-NR^2C(=A)-$ であり、A と B とがいずれも O である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

J がフェニル環であるか、J-1、J-2、J-3、J-4

【化 2】



よりなる群から選択される 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であり、各 J 環は場合により 1~3 個の R^5 で置換されていてもよく、

Q が O、S または NR^{5c} であり、

W、X、Y および Z が独立して N または CR^{5c} (ただし、J-3 および J-4 では、W、X、Y または Z のうちの少なくとも 1 つが N である) であり、

R^1 および R^2 がそれぞれ独立して 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、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニルであり、

R^3 が場合によりハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニルよりなる群から選択される 1 個またはそれ以上の置換基で各々置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ 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、

各 R^4 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または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

各 R^5 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、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルであるか、または

各 R^5 が独立してフェニル環、ベンジル環、または 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であり、各環が場合により R^6 から独立して選択される 1~3 個の置換基で置換されていてもよく、あるいは

2 個の R^5 基は隣接する炭素原子と結合している場合には一緒になって $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2CF_2O-$ または $-OCF_2CF_2O-$ であることができ、

R^{5c} が H または R^5 であり、

各 R^6 が独立して $C_1 \sim C_4$ 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

～C₈ ジアルキルアミノ、C₃～C₆ シクロアルキルアミノ、C₃～C₆ (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が1または2である、

請求項2または請求項3に記載の方法。

【請求項5】

各R^{5a}がR^{5a}またはR^{5b}であり、
JがR^{5a}で置換され、場合により1～2個のR^{5b}で置換されていてもよく、
R¹およびR²がそれぞれ独立して、HまたはC₁～C₄ アルキルであり、
R³が場合によりハロゲン、CN、OCH₃またはS(O)_pCH₃で置換されていてもよいC₁～C₄ アルキルであり、
R^{5a}基がKに対するオルト位でJに結合され、
R^{5a}およびR^{5b}が各々独立して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またはC₃～C₈ ジアルキルアミノカルボニル；あるいは各環が場合によりR⁶から独立して選択される置換基1～3個で置換されていてもよい、フェニル環、ベンジル環、または5員環もしくは6員環の複素芳香環であり、
各R⁶が独立してハロゲン、CN、NO₂、C₁～C₄ アルキル、C₂～C₄ アルケニル、C₂～C₄ アルキニル、C₃～C₆ シクロアルキル、C₁～C₄ ハロアルキル、C₁～C₄ アルコキシまたはC₁～C₄ ハロアルコキシであり、
pが0、1または2である、
請求項4に記載の方法。

【請求項6】

Jがフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンである、請求項5に記載の方法。

【請求項7】

R¹およびR²が各々Hであり、
1個のR⁴がC₁～C₃ アルキル、CF₃、OCF₃、OCHF₂、S(O)_pCF₃、S(O)_pCHF₂、ハロゲンよりなる群から選択され、任意の2番目のR⁴がハロゲン、C₁～C₃ アルキル、C₁～C₃ ハロアルキルよりなる群から選択される、請求項6に記載の方法。

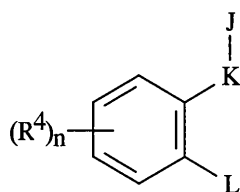
【請求項8】

JがJ-1であり、
QがNR^{5a}であり、
XがNまたはCHであり、
YがCHであり、
ZがCR^{5b}であり、
R^{5a}がハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₁～C₄ ハロアルキルまたはC₁～C₄ ハロアルコキシよりなる群から選択される1個または2個の置換基で置換されたフェニル環または2-ピリジル環であり、
R^{5b}がハロゲンまたはCF₃である、
請求項7に記載の方法。

【請求項9】

式I

【化 3】



I

(式中、

Jはフェニル環、ナフチル環系、5員環もしくは6員環の複素芳香環または8員環、9員環もしくは10員環の芳香族縮合複素二環系であり、ここで各環または環系は1個の R^{5a} で置換され、場合により1~3個の R^{5b} で置換されていてもよく、

Kは $-C(=A)NR^2-$ または $-NR^2C(=A)-$ であり、

Lは $-NR^1C(=B)-R^3$ または $-NR^1SO_2-R^3$ であり、

AおよびBは独立してOまたはSであり、

R^1 はHまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

R^2 はHまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

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

各 R^4 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または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、

R^{5a} および R^{5b} は各々独立して $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニル；あるいはフェニル環、ベンジル環、または5員環もしくは6員環の複素芳香環（フェニル、ベンジルおよび複素芳香環の各々が、場合により R^6 から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）であり、

R^{5a} はKに対するオルト位でJに結合され、

各 R^6 は独立してハロゲン、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 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり、

nは1、2、3または4であり、

pは0、1または2であり、

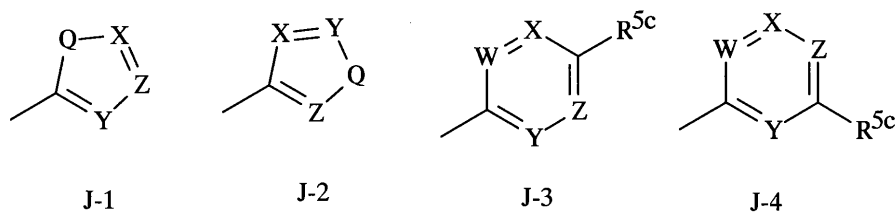
ただし、Lは $-NH C(=O)-R^3$ 以外であり、 R^3 は1またはそれ以上のフッ素部分で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル以外である）

で示される、そのすべての幾何異性体および立体異性体、N-オキシドまたは農業的に適した塩を含む化合物。

【請求項10】

Jがフェニル環であるか、J-1、J-2、J-3、J-4

【化 4】



よりなる群から選択される 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であって、各 J 環は R^{5a} で置換され、場合により 1 ~ 2 個の R^{5b} で置換されていてもよく、Q が O、S または NR^{5c} であり、W、X、Y および Z が独立して N または CR^{5c} （ただし、J-3 および J-4 では、W、X、Y または Z のうちの少なくとも 1 つが N である）であり、 R^1 および R^2 が各々独立して H または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、 R^3 が場合によりハロゲン、CN、 OCH_3 または $S(O)_pCH_3$ で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、各 R^4 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または $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルであり、 R^{5a} が K に対するオルト位で J に結合され、 R^{5a} および R^{5b} が各々独立して $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルまたは $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノカルボニルである；あるいは各環が場合により R^6 から独立して選択される置換基 1 ~ 3 個で置換されていてもよい、フェニル環、ベンジル環、または 5 員環もしくは 6 員環の複素芳香環であり、 R^{5c} が H または R^{5b} 置換基のうちのひとつであり、各 R^6 が独立してハロゲン、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 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシであり、n が 1 または 2 である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

J がフェニル、ピラゾール、ピロール、ピリジンまたはピリミジンである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

R^1 および R^2 が各々 H であり、1 個の R^4 が $C_1 \sim C_3$ アルキル、 CF_3 、 $O CF_3$ 、 $O CHF_2$ 、 $S(O)_pCF_3$ 、 $S(O)_pCHF_2$ 、ハロゲンよりなる群から選択され、任意の 2 番目の R^4 がハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルよりなる群から選択される、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

J が J-1 であり、

Qが NR^{5a} であり、

XがNまたはCHであり、

YがCHであり、

Zが CR^{5b} であり、

R^{5a} がハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルコキシよりなる群から選択される1個または2個の置換基で置換されたフェニル環または2-ピリジル環であり、

R^{5b} がハロゲンまたは CF_3 である、

請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

生物学的に有効な量の請求項1に記載の式Iの化合物、そのN-オキシドまたはその農業的に適した塩と、

界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤よりなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分と、

を含んでなる、無脊椎有害生物を防除するための組成物。

【請求項15】

少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤を有効量でさらに含んでなる、請求項14に記載の組成物。

【請求項16】

少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤が、ピレスロイド、カルバメート、ネオニコチノイド、神経ナトリウムチャンネル遮断剤、殺虫性大環状ラクトン、 γ -アミノ酪酸(GABA)拮抗剤、殺虫性尿素及び幼若ホルモンミミックよりなる群から選択される、請求項15に記載の組成物。

【請求項17】

アバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、アミドフルメト、エパーメクチン、アザジラクチン、アジノホス-メチル、ピフェントリン、ビンフェナゼート、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、エンドスルファン、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、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルシトリネート、 τ -フルバリネート、フルフェノクスロン、フェノホス、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、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メソミル、メソプレン、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、オキサミル、パラチオン、パラチオン-メチル、ペルメトリン、フォレート、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、スルプロホス、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、チオスルタッパ-ナトリウム、トラロメトリン、トリクロルホンおよびトリフルムロン、アルジカルブ、オキサミル、フェナミホス、アミトラズ、キノメチオネート、クロルベンジレート、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、酸化フェンブタズ、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、テブフェンピラドならびに、aizawaiおよびkurstakiの種を含むバチルス・チューリングゲンシス、バチルス・チューリングゲンシスの δ 内毒素、バキュロウイルスおよび昆虫病原性細菌、ウイルスおよび真菌などの生物剤よりなる群から選択される、少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤をさらに含んでなる、請求項14に記載の組成物。

【請求項18】

シペルメトリン、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、トラロメトリン、フェノチカルブ、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、クロチアニジン、イミダクロプリド、チアクロプリド、インドキサカルブ、スピノサド、アバメクチン、エバーメクチン、エマメクチン、エンドスルファン、エチプロール、フィプロニル、フルフェノクスロン、トリフルムロン、ジオフェノラン、ピリプロキシフェン、ピメトロジン、アミトラズ、バチルス・チューリングエンシス、バチルス・チューリングエンシスの δ 内毒素、食虫性真菌よりなる群から選択される、少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または薬剤をさらに含んでなる、請求項14に記載の組成物。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International Application No. PCT/US 02/29468
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 C07D231/14 C07D231/40 C07D213/61 C07D213/40 A01N43/56 A01N37/22 A01N37/30		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 C07D A01N C07C		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) CHEM ABS Data, EPO-Internal, INSPEC, PAJ		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CH 373 028 A (GEIGY AG J R) 15 November 1963 (1963-11-15) page 4, left-hand column, line 1-11; examples page 4, right-hand column, line 80 - line 89 page 4, left-hand column, line 30 - line 38	1,2,4-18
X	US 3 907 892 A (O'DOHERTY GEORGE O P) 23 September 1975 (1975-09-23) cited in the application column 8, line 56 - line 65; claim 1 column 16, line 19 - line 59 --- -/--	1,3-18
☒ Further documents are listed in the continuation of box C. ☒ Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubt on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "Z" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 7 January 2003		Date of mailing of the international search report 25.06.2003
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 6818 Patentkanal 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel: (+31-70) 940-9040, Tx: 31 651 apo nl, Fax: (+31-70) 940-9016		Authorized officer DE JONG B.S.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/US 02/29468

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 3 989 840 A (O'DOHERTY GEORGE OLIVER PLUNK) 2 November 1976 (1976-11-02) column 8, line 12 - line 31; claim 1; example 4 ---	1,3-18
X	EL-HASHASH, M. A. ET AL: "Synthesis of new sulfamoyl anilides. 4H-3,1-benzoxazin-4-one and 4-quinazoline derivatives of agricultural interest" REV. ROUM. CHIM. (1979), 24(11-12), 1509-20. XP001128751 compound 7a ---	1,3-18
X	FR 1 491 502 A (SUMITOMO CHEMICAL CO) 11 August 1967 (1967-08-11) page 7, right-hand column, line 5-12; claim 1 ---	9
X	DE 15 93 975 A (SUMITOMO CHEMICAL CO) 9 March 1972 (1972-03-09) claim 1; examples 6-10 ---	9
X	JP 63 010777 A (HOKURIKU SEIYAKU CO LTD) 18 January 1988 (1988-01-18) claims; table 2 ---	9
X	DE 11 69 918 B (MONSANTO CHEMICALS) 14 May 1964 (1964-05-14) claim 1; example 5 ---	9
X	US 4 004 029 A (COLLINS ROBERT JAMES ET AL) 18 January 1977 (1977-01-18) claim 1; example 3 ---	9
A	NL 9 202 078 A (RIJKS LANDBOUW HOGESCHOOL) 16 June 1994 (1994-06-16) cited in the application claims ---	1,2,4-18
A	WO 92 06964 A (ICI PLC) 30 April 1992 (1992-04-30) claims -----	1,2,4-18

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT	International application No. PCT/US 02/29468
Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)	
This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:	
1. ☐ Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:	
2. ☐ Claims Nos.: because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:	
3. ☐ Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).	
Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)	
This International Searching Authority found multiple inventions in this International application, as follows:	
see additional sheet	
1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.	
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.	
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:	
4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.: 1,2,4-18 (all in part)	
Remark on Protest	
☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.	
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.	

International Application No. PCT/US 02/29468

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

This International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

1. Claims: 1,2,4-18 (all in part)

A method for controlling an invertebrate pest using compounds of formula I in which K is -C(=A)NR₂- and L is -NR₁C(=B)-R₃. Compounds according to claim 9 in which K and L are as defined above and compositions containing them.

2. Claims: 1,2,4-18 (all in part)

A method for controlling an invertebrate pest using compounds of formula I in which K is -C(=A)NR₂- and L is -NR₁SO₂-R₃. Compounds according to claim 9 in which K and L are as defined above and compositions containing them.

3. Claims: 1,3-18 (all in part)

A method for controlling an invertebrate pest using compounds of formula I in which K is -NR₂C(=A)- and L is -NR₁C(=B)-R₃. Compounds according to claim 9 in which K and L are as defined above and compositions containing them.

4. Claims: 1,3-18 (all in part)

A method for controlling an invertebrate pest using compounds of formula I in which K is -NR₂C(=A)- and L is -NR₁SO₂-R₃. Compounds according to claim 9 in which K and L are as defined above and compositions containing them.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
 Information on patent family members

 International Application No.
 PCT/US 02/29468

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
CH 373028	A	15-11-1963	NONE
US 3907892	A	23-09-1975	AT 341507 B 10-02-1978 NL 7508283 A 13-01-1977 US 4011341 A 08-03-1977 US 4108631 A 22-08-1978 US RE29508 E 03-01-1978 DE 2531597 A1 03-02-1977
US 3989840	A	02-11-1976	NONE
FR 1491502	A	11-08-1967	DE 1620385 A1 26-02-1970 GB 1138235 A 27-12-1968 GB 1138236 A 27-12-1968
DE 1593975	A	09-03-1972	DE 1593975 A1 09-03-1972
JP 63010777	A	18-01-1988	NONE
DE 1169918	B	14-05-1964	NONE
US 4004029	A	18-01-1977	NONE
NL 9202078	A	16-06-1994	NONE
WO 9206964	A	30-04-1992	AU 8616691 A 20-05-1992 EP 0553119 A1 04-08-1993 WO 9206964 A1 30-04-1992 JP 6502625 T 24-03-1994 US 5187176 A 16-02-1993

フロントページの続き

(81)指定国 AP(GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,IE,IT,LU,MC,NL,PT,SE,SK,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,EC,EE,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MZ,N O,NZ,OM,PH,PL,PT,RO,RU,SD,SE,SG,SI,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,YU,ZA,ZM,ZW

(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

Fターム(参考) 4C063 AA01 BB02 CC22 DD12 EE03

4H006 AA01 AA03 AB02 BJ50 BV74

4H011 AC01 BA01 BB06 BB09 DA02 DA15 DA16 DE15

【要約の続き】

R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ およびnは、開示内容で定義したとおりである)の化合物(そのすべての幾何異性体および立体異性体、N-オキシドおよび農業的に適した塩を含んでなる(式Iの化合物を含む組成物中など))と接触させることを含んでなる、無脊椎有害生物の防除無脊椎有害生物を防除するための方法方法に関する。また、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農業的に適した塩を含んでなる、無脊椎有害生物を防除するための特定の組成物も開示される。さらに、特定の式Iの化合物、そのN-オキシド類および農業的に適した塩類も開示される。