

「置換基群」

水酸基、ハロゲン原子、C1～C10アルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C3～C8シクロアルキル基、C1～C10アルコキシ基、C1～C10アルコキシC1～C3アルキル基、C1～C4ハロアルコキシ基、C3～C8シクロアルキルオキシ基、C3～C8シクロアルキルC1～C10アルキル基、C1～C10アルキルチオ基、C1～C4ハロアルキルチオ基、C2～C6アルケニル基、C2～C6アルキニル基、C1～C10アルキルスルフィニル基、C1～C10アルキルスルホニル基、シアノ基

【請求項2】

Yがピラゾール-4-イル基である請求項1記載のイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

10

【請求項3】

Yがピラゾール-4-イル基で、置換基群より選択される任意の基がピラゾール環の3及び5位に置換され、更に、1位に水素原子、C1～C10アルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C3～C8シクロアルキル基、C3～C8シクロアルキルC1～C10アルキル基、C1～C10アルコキシC1～C3アルキル基、C2～C6アルケニル基、C2～C6アルキニル基が置換した請求項2記載のイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

【請求項4】

請求項1～3のいずれかに記載のイソオキサゾリン誘導体又は薬理上許容される塩を有効成分として含有する除草剤。

20

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は新規なイソオキサゾリン誘導体及びそれを有効成分として含有する除草剤に関するものである。

【背景技術】

【0002】

イソオキサゾリン環の5位にハロアルキル基を有するイソオキサゾリン誘導体が除草活性を有することは、例えば、特開平8-225548号公報、特開平9-328477号公報及び特開平9-328483号公報等により報告されている。しかしながら本発明化合物はこれらの文献や他の文献に記載されていない。

30

【0003】

又、有用作物に対して使用される除草剤は、土壌又は茎葉に施用した際に、低薬量で十分な除草効果を示し、しかも作物・雑草間に高い選択性を発揮する薬剤であることが望まれる。然しながら、これらの点で、当該公報に記載の化合物は満足すべきものとは言い難い。

【0004】

本発明者らはこの様な状況に鑑み、除草効果と作物・雑草間の選択性とを検討した結果、新規なイソオキサゾリン誘導体が、優れた除草効果と作物・雑草間の選択性を有することを見だし、本発明を完成するに至った。

40

【発明の開示】

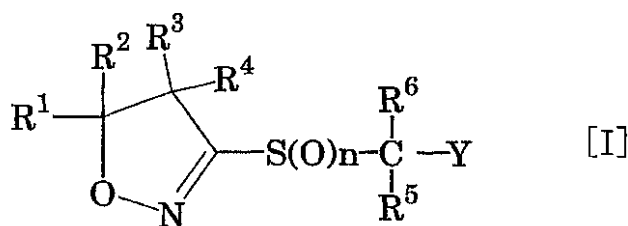
【0005】

即ち、本発明は以下の発明を提供するものである。

【0006】

(1)一般式[1]を有するイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩

【化2】



10

式中、

R^1 は、C1～C4ハロアルキル基を示し、

R^2 は、水素原子、C1～C10アルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C3～C8シクロアルキル基又はC3～C8シクロアルキルC1～C3アルキル基を示し、

R^3 及び R^4 は、同一又は異なって、水素原子、C1～C10アルキル基又はC3～C8シクロアルキル基を示すか、或いは、 R^3 と R^4 とが一緒になって、これらの結合した炭素原子と共にC3～C7のスピロ環を形成しても、さらに R^2 と R^3 とが一緒になって、これらの結合した炭素原子と共に5～8員環を形成してもよく、

20

R^5 及び R^6 は、同一又は相異なって、水素原子又はC1～C10アルキル基を示し、

Yはピロリル基、ピラゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イミダゾリル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、ベンゾチエニル基、インドリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾイソキサゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、インダゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、フサラジニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、シンノリニル基又はベンゾトリアゾリル基を示し(ここで、これらのヘテロ環基のヘテロ原子が窒素原子の時は酸化されてN-オキシドになってもよい。)、これらのヘテロ環基は置換基群より選択される1～6個の同一又は相異なる基で置換されていてもよく(ここで、ヘテロ環基の置換基は、隣接したアルキル基同士、アルコキシ基同士、アルキル基とアルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基、アルキル基とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアルキルアミノ基が結合して1～4個のハロゲン原子で置換されてもよい5～8員環を形成してもよい。)、

30

nは0～2の整数を示す。

「置換基群」

水酸基、ハロゲン原子、C1～C10アルキル基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C3～C8シクロアルキル基、C1～C10アルコキシ基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルコキシ基、C1～C4ハロアルコキシ基、C3～C8シクロアルキルオキシ基、C3～C8シクロアルキルC1～C3アルキルオキシ基、C1～C10アルキルチオ基、置換基群

40

より選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキルチオ基、C1～C4ハロアルキルチオ基、C2～C6アルケニル基、C2～C6アルケニルオキシ基、C2～C6アルキニル基、C2～C6アルキニルオキシ基、C1～C10アルキルスルフィニル基、C1～C10アルキルスルホニル基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキルスルホニル基、C1～C4ハロアルキルスルフィニル基、C1～C4ハロアルキルスルホニル基、C1～C10アルキルスルホニルオキシ基、C1～C4ハロアルキルスルホニルオキシ基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいフェニルチオ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環オキシ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環チオ基、置換され

50

ていてもよいフェニルスルフィニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルフィニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニルオキシ基、C1～C6アシル基、C1～C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、カルボキシル基、C1～C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は、同一又は異なって、C1～C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい。）、C1～C6アシルオキシ基、C1～C4ハロアルキルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンジルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいベンゾイルオキシ基、ニトロ基、

10

「置換基群」

水酸基、C3～C8シクロアルキル基（該基はハロゲン原子又はC1～C10アルキル基で置換されてもよい）、C1～C10アルコキシ基、C1～C10アルキルチオ基、C1～C10アルキルスルホニル基、C1～C10アルコキシカルボニル基、C2～C6ハロアルケニル基、

20

「置換基群」

C1～C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は、同一又は異

30

【0007】

（2）置換基群が、水酸基、ハロゲン原子、C1～C10アルキル基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C3～C8シクロアルキル基、C1～C10アルコキシ基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルコキシ基、C1～C4ハロアルコキシ基、C3～C8シクロアルキルオキシ基、C3～C8シクロアルキルC1～C3アルキルオキシ基、C1～C10アルキルチオ基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたC1～C10アルキルチオ基、C1～C4ハロアルキルチオ基、C2～C6アルケニル基、C2～C6アルケニルオキシ基、C2～C6アルキニル基、C2～C6アルキニルオキシ基、C1～C10アルキルスルホニル基、C1～C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよいフェニルチオ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環オキシ基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環チオ基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、C1～C6アシル基、C1～C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、カルボキシル基、C1～C10アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は、同一又は異なって、C1～C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい。）、ニトロ基、アミノ基（該基の窒素原子は、同一又は異なって、C1～C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、C1～C6ア

40

50

シル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい。)によって表される(1)記載のイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

【0008】

(3)置換基群 が、ハロゲン原子、C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C1~C10アルコキシC1~C3アルキル基、C3~C8シクロアルキル基(該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい)、C1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロアルコキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は、同一又は異なってC1~C10アルキル基で置換されていてもよい)によって表される(2)記載のイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

10

【0009】

(4)R¹がクロロメチル基、R²がメチル基もしくはエチル基、R³、R⁴、R⁵及びR⁶が水素原子である(1)、(2)又は(3)記載のイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

【0010】

(5)Yがピロリル基、ピラゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イミダゾリル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基である(1)、(2)、(3)又は(4)記載のイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

20

【0011】

(6)Yがピラゾリル基又はピリミジニル基である(5)記載のイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

【0012】

(7)Yがピラゾール-4-イル基又はピリミジン-5-イル基である(6)記載のイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

30

【0013】

(8)Yがピラゾール-4-イル基で、置換基群 より選択される任意の基がピラゾール環の3及び5位に置換され、更に、1位に水素原子、C1~C10アルキル基、置換基群 より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C2~C6アルケニル基、C2~C6アルキニル基、C1~C10アルキルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換基群 より選択される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジロキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カルバモイル基(該基の窒素原子は、同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい)、アミノ基(該基の窒素原子は、同一又は異なって、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい)が置換した(7)記載のイソオキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

40

50

【 0 0 1 4 】

(9) Y がピリミジン - 5 - イル基で、置換基群 より選択される任意の基がピリミジン環の 4 位及び 6 位に置換した (7) 記載のイソキサゾリン誘導体又はその薬理上許容される塩。

【 0 0 1 5 】

(1 0) (1) ~ (9) のいずれかに記載のイソキサゾリン誘導体又は薬理上許容される塩を有効成分として含有する除草剤。

【 0 0 1 6 】

尚、本明細書において、用いられる用語の定義を以下に示す。

【 0 0 1 7 】

C1 ~ C10 等の表記は、この場合ではこれに続く置換基の炭素数が、1 ~ 10 であることを示している。

【 0 0 1 8 】

ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を示す。

【 0 0 1 9 】

C1 ~ C10 アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が 1 ~ 10 の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばメチル基、エチル基、n - プロピル基、イソプロピル基、n - ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、n - ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、n - ヘキシル基、イソヘキシル基、3, 3 - ジメチルブチル基、ヘプチル基又はオクチル基等を挙げることができる。

【 0 0 2 0 】

C3 ~ C8 シクロアルキル基とは、炭素数が 3 ~ 8 のシクロアルキル基を示し、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基又はシクロヘキシル基等を挙げることができる。

【 0 0 2 1 】

C3 ~ C8 シクロアルキル C1 ~ C3 アルキル基 (該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよい) とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子 1 ~ 4 又は C1 ~ C3 アルキル基で置換されてもよい C3 ~ C8 シクロアルキル基により置換された C1 ~ C3 アルキル基を示し、例えばシクロプロピルメチル基、1 - シクロプロピルエチル基、2 - シクロプロピルエチル基、1 - シクロプロピルプロピル基、2 - シクロプロピルプロピル基、3 - シクロプロピルプロピル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基 2 - クロロシクロプロピルメチル基、2, 2 - ジクロロシクロプロピルメチル基、2 - フルオロシクロプロピルメチル基、2, 2 - ジフルオロシクロプロピルメチル基、2 - メチルシクロプロピルメチル基、2, 2 - ジメチルシクロプロピルメチル基又は 2 - メチルシクロプロピルエチル基等を挙げることができる。

【 0 0 2 2 】

C1 ~ C4 ハロアルキル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子 1 ~ 9 で置換されている炭素数が 1 ~ 4 の直鎖又は分岐鎖のアルキル基を示し、例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2 - ジフルオロエチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基又はペンタフルオロエチル基等を挙げることができる。

【 0 0 2 3 】

C2 ~ C6 アルケニル基とは、炭素数が 2 ~ 6 の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えばエテニル基、1 - プロペニル基、2 - プロペニル基、イソプロペニル基、1 - ブテニル基、2 - ブテニル基、3 - ブテニル基又は 2 - ペンテニル基等を挙げることができる。

【 0 0 2 4 】

C2 ~ C6 アルキニル基とは、炭素数が 2 ~ 6 の直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を示し、例えばエチニル基、2 - プロピニル基、1 - メチル - 2 - プロピニル基、2 - ブチニル基、3 - ブチニル基又は 2 - メチル - 3 - ブチニル基等を挙げることができる。

10

20

30

40

50

【 0 0 2 5 】

C2～C6ハロアルケニル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子1～4で置換されている炭素数が2～6の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えば3-クロロ-2-プロベニル基、又は2-クロロ-2-プロベニル基等を挙げることができる。

【 0 0 2 6 】

C1～C10アルコキシ基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)-O-基を示し、例えばメトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、tert-ブトキシ基、n-ブトキシ基、sec-ブトキシ基又はイソブトキシ基等を挙げることができる。

10

【 0 0 2 7 】

C1～C10アルコキシC1～C3アルキル基とは、アルコキシ部分、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)-O-(アルキル)基を示し、例えばメトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基又はエトキシエチル基等を挙げることができる。

【 0 0 2 8 】

C1～C4ハロアルコキシ基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である(ハロアルキル)-O-基を示し、例えばジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2,2-ジフルオロエトキシ基又は2,2,2-トリフルオロエトキシ基等を挙げることができる。

【 0 0 2 9 】

C3～C8シクロアルキルオキシ基とは、シクロアルキル部分が上記の意味である(シクロアルキル)-O-基を示し、例えばシクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基又はシクロヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

20

【 0 0 3 0 】

C3～C8シクロアルキルC1～C3アルキルオキシ基とは、シクロアルキルアルキル部分が上記の意味である(シクロアルキルアルキル)-O-基を示し、例えばシクロプロピルメトキシ基、1-シクロプロピリエトキシ基、2-シクロプロピリエトキシ基、1-シクロプロピルプロポキシ基、2-シクロプロピルプロポキシ基、3-シクロプロピルプロポキシ基、シクロブチルメトキシ基、シクロペンチルメトキシ基又はシクロヘキシルメトキシ基等を挙げることができる。

【 0 0 3 1 】

C2～C6アルケニルオキシ基及びC2～C6アルキニルオキシ基とは、アルケニル又はアルキニル部分が上記の意味である(アルケニル)-O-基、(アルキニル)-O-基を示し、例えば2-プロベニルオキシ基又は2-プロピニルオキシ基等を挙げることができる。

30

【 0 0 3 2 】

C1～C10アルコキシイミノ基とは、アルコキシ部分が上記の意味である(アルコキシ)-N=基を示し、例えばメトキシイミノ基又はエトキシイミノ基等を挙げることができる。

【 0 0 3 3 】

C1～C10アルキルチオ基、C1～C10アルキルスルフィニル基及びC1～C10アルキルスルホニル基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)-S-基、(アルキル)-SO-基、(アルキル)-SO₂-基を示し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、メチルスルフィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、n-プロピルスルホニル基又はイソプロピルスルホニル基等を挙げることができる。

40

【 0 0 3 4 】

C1～C10アルキルスルホニルオキシ基とは、アルキルスルホニル部分が上記の意味である(アルキルスルホニル)-O-基を示し、例えばメチルスルホニルオキシ基又はエチルスルホニルオキシ基等を挙げることができる。

【 0 0 3 5 】

50

C1~C10アルコキシカルボニル基とは、アルコキシ部分が上記の意味である（アルコキシ）-CO-基を示し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基又はイソプロポキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0036】

C1~C6アシル基とは、炭素数1~6の直鎖又は分岐鎖状の脂肪族アシル基を示し、例えばホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、イソプロピオニル基、ブチリル基又はピバロイル基等を挙げることができる。

【0037】

C1~C10アシルオキシ基とは、アシル部分が上記の意味である（アシル）-O-基、を示し、例えばアセトキシ基、プロピオニルオキシ基、イソプロピオニルオキシ基又はピバロイルオキシ基等を挙げることができる。

10

【0038】

C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C4ハロアルキルチオ基、C1~C4ハロアルキルスルフィニル基及びC1~C4ハロアルキルスルホニル基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である（ハロアルキル）-CO-基、（ハロアルキル）-S-基、（ハロアルキル）-SO-基、（ハロアルキル）-SO₂-基を示し、例えばクロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、ペンタフルオロプロピオニル基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロメチルスルフィニル基、ジフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、クロロメチルスルホニル基、ジフルオロメチルスルホニル基又はトリフルオロメチルスルホニル基等を挙げることができる。

20

【0039】

C1~C4ハロアルキルカルボニルオキシ基及びC1~C4ハロアルキルスルホニルオキシ基とは、ハロアルキルカルボニル部分及びハロアルキルスルホニル部分が上記の意味である（ハロアルキルカルボニル）-O-基、（ハロアルキルスルホニル）-O-基を示し、例えばクロロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチルオキシ基、クロロメチルスルホニルオキシ基又はトリフルオロメチルスルホニルオキシ基等を挙げることができる。

【0040】

（置換されていてもよい）フェニル基、（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環基、（置換されていてもよい）フェノキシ基、（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環オキシ基、（置換されていてもよい）フェニルチオ基、（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環チオ基、（置換されていてもよい）フェニルスルフィニル基、（置換されていてもよい）フェニルスルホニル基、（置換されていてもよい）フェニルスルホニルオキシ基、（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環スルフィニル基、（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環スルホニル基、（置換されていてもよい）ベンジルカルボニル基、（置換されていてもよい）ベンジルカルボニルオキシ基、（置換されていてもよい）ベンジルスルホニル基、（置換されていてもよい）ベンゾイル基、（置換されていてもよい）ベンゾイルオキシ基、（置換されていてもよい）ベンジルオキシカルボニル基又は（置換されていてもよい）フェノキシカルボニル基における「置換されていてもよい」とは、これらの基が、例えばハロゲン原子、C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C1~C10アルコキシC1~C3アルキル基、C1~C10アルコキシ基、C1~C10アルキルチオ基、C1~C10アルキルスルホニル基、アシル基、C1~C10アルコキシカルボニル基、シアノ基、カルバモイル基（該基の窒素原子は、同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されていてもよい）、ニトロ基、又はアミノ基（該基の窒素原子は、同一又は異なって、C1~C10アルキル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~C10アルキルスルホニル基又はC1~C4ハロアルキルスルホニル基で置換されていてもよい）等で置換されていてもよいことを示す。

30

40

【0041】

（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環基、（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環オキシ基、（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環チオ基、（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環スルフィニル基又は（置換されていてもよい）芳香族ヘテロ環スルホニ

50

ル基の芳香族ヘテロ環とは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から任意に選択されるヘテロ原子を1～3個有する5～6員の基を示し、例えばフリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イソキサゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、イミダゾリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基又はチアジアゾリル基等を挙げることができる。

【0042】

薬理上許容される塩とは、一般式[1]を有する化合物において、水酸基、カルボキシル基又はアミノ基等がその構造中に存在する場合に、一般式[1]を有する化合物と金属もしくは有機塩基との塩又は鉱酸もしくは有機酸との塩であり、例えば、金属としてはナトリウム又はカリウム等のアルカリ金属或いはマグネシウム又はカルシウム等のアルカリ土類金属を挙げることができ、有機塩基としてはトリエチルアミン又はジイソプロピルアミン等を挙げることができ、鉱酸としては塩酸又は硫酸等を挙げることができ、有機酸としては酢酸、メタンスルホン酸又はp-トルエンスルホン酸等を挙げることができる。

【0043】

上記した一般式[1]で表される化合物の中で、R¹がクロロメチル基であり、R²が、メチル基もしくはエチル基であり、R³、R⁴、R⁵及びR⁶が水素原子であり、nが2の整数であり、Yがピラゾール-4-イル基(ここで該基の3位及び5位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、シクロアルキルアルキルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は、同一又は異なって、アルキル基で置換されていてもよい)が、さらに1位に水素原子、アルキル基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキルスルホニル基、置換基群より選択される任意の基でモノ置換されたアルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は、同一又は異なって、アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい)が必ず置換する。)、或いはピリミジン-5-イル基(該基の4位及び6位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は、同一又は異なって、アルキル基で置換されていてもよい)が必ず置換する。)であるイソキサゾリン誘導体が好ましい。

【発明を実施するための最良の形態】

【0044】

次に、一般式[1]を有する本発明化合物の代表的な化合物例を表1～表57に記載する。しかしながら、本発明化合物はこれらに限定されるものではない。

【0045】

本明細書における表中の次の表記は下記の通りそれぞれ該当する基を表す。

Me	: メチル基	Et	: エチル基
Pr	: n-プロピル基	Pr-i	: イソプロピル基
Pr-c	: シクロプロピル基	Bu	: n-ブチル基
Bu-i	: イソ-ブチル基	Bu-sec	: sec-ブチル基
Bu-t	: tert-ブチル基	Bu-c	: シクロ-ブチル基
Pen-c	: シクロ-ペンチル基	Hex-c	: シクロ-ヘキシル基

10

20

30

40

50

Ph : フェニル基

【0046】

尚、一般式 [1] を有する本発明化合物は、置換基として水酸基を含む場合、ケト - エノール互変異性体を有することもあるが、何れの異性体もその混合物も、本発明化合物に包含される。

【0047】

【表1】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ¹	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Me	H	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Me	C(=O)OMe	CH ₂ C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Me	C(=O)OEt	CH ₂ C(=O)OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Me	Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	OMe	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	OEt	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	OCHF ₂	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Me	Me	H	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Me	Me	C(=O)OMe	CH ₂ C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Me	Me	C(=O)OEt	CH ₂ C(=O)OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Me	Me	Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	OMe	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	OEt	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	OCHF ₂	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Me	H	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Me	C(=O)OMe	CH ₂ C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Me	C(=O)OEt	CH ₂ C(=O)OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Me	Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	OMe	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	OEt	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	OCHF ₂	H	H
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	N-H	H	H	H

【0048】

【表 2】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	H	N-Me	Cl	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Me	Me	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Me	Cl	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Me	Cl	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Me	CF ₃	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Me	Cl	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	CN	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OMe	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OEt	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OPr-i	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OPr	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ CH=CH ₂	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ CF ₃	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OPh	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SMe	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SOMe	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ Me	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SCF ₃	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SOCF ₃	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ CF ₃	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SPh	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SOPh	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ Ph	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Ph	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₂ CF ₃	N-Me	Cl	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-H	Cl	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ OH	Cl	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ OMe	Cl	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CN	Cl	

10

20

30

40

【表 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH=CH ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ C≡CH	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Bu-t	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ C(=O)OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH(Me)C(=O)OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-C(Me) ₂ C(=O)OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ SMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-SO ₂ Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-SO ₂ CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-SO ₂ CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-SO ₂ Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-C(=O)Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-C(=O)Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-C(=O)CH ₂ Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Ph	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Pr	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Pr-i	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Bu-t	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CH ₂ OMe	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 5 0 】

【表4】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH(Me)C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OC(Me) ₂ C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OC(=O)Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OC(=O)Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OSO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OSO ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OSO ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	SMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	SOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	SO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	SPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	SOPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	SO ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	Imidazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	1,2,4-Triazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	1,2,4-Triazol-4-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	Tetrazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₂ CF ₃	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(2-Cl)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(2-F)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(2-OMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(2-Me)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(2-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(3-Cl)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(3-F)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(3-OMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(3-Me)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(3-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(4-Cl)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(4-F)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(4-OMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(4-Me)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(4-NO ₂)	Cl

10

20

30

40

【表 5】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Ph	N-Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Ph	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Ph	N-Me	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Ph	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Ph	N-Me	Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	S	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	S	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	S	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	S	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	S	OEt
CH ₂ Br	H	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	H	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	H	Me	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Me	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Et	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Pr-i	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Me	Me	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Pr	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ F	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Br	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ I	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₃	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	H	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Me	N-Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Me	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Me	Cl

10

20

30

40

【 0 0 5 2 】

【表 6】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CHF ₂	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OPr
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SOCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SOPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₂ CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ OH	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CN	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH=CH ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ C≡CH	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Pr	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Bu-t	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ C(=O)OMe	Cl

10

20

30

40

【表 7】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH(Me)C(=O)OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-C(Me) ₂ C(=O)OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ SMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-SO ₂ Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-SO ₂ CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-SO ₂ CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-SO ₂ Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-C(=O)Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-C(=O)Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-C(=O)CH ₂ Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Me	N-Ph	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Me	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Et	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Pr	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Pr-i	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Bu-t	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CH ₂ OMe	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CHF ₂	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH(Me)C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OC(Me) ₂ C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OC(=O)Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OC(=O)Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OSO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OSO ₂ CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 5 4 】

【表 8】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OSO ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	SMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	SOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	SO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	SPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	SOPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	SO ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	Imidazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	1,2,4-Triazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	1,2,4-Triazol-4-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	Tetrazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₂ CF ₃	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(2-Cl)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(2-F)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(2-OMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(2-Me)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(2-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(3-Cl)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(3-F)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(3-OMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(3-Me)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(3-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(4-Cl)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(4-F)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(4-OMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(4-Me)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(4-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Ph	N-Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Ph	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Ph	N-Me	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Ph	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Ph	N-Me	Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Me	S	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Me	S	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	S	Cl

10

20

30

40

【表 9】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	S	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	S	OEt
CH ₂ Br	H	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	H	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	H	Me	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Me	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Et	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Pr-i	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Me	Me	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Et	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Pr	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ F	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Br	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ I	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₃	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	H	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OPr

10

20

30

40

【 0 0 5 6 】

【表 10】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SOCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SOPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₂ CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ OH	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CN	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH=CH ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ C≡CH	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Bu-t	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ C(=O)OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH(Me)C(=O)OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-C(Me) ₂ C(=O)OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ SMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-SO ₂ Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-SO ₂ CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-SO ₂ CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-SO ₂ Ph	Cl

10

20

30

40

【 0 0 5 7 】

【表 1 1】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-C(=O)Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-C(=O)Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-C(=O)CH ₂ Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Ph	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Pr	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Pr-i	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Bu-t	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CH ₂ OMe	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH(Me)C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OC(Me) ₂ C(=O)OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OC(=O)Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OC(=O)Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OSO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OSO ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OSO ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	SMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	SOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	SO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	SPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	SOPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	SO ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	Imidazol-1-yl

10

20

30

40

【 0 0 5 8 】

【表 1 2】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	1,2,4-Triazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	1,2,4-Triazol-4-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	Tetrazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₂ CF ₃	N-Ph	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(2-Cl)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(2-F)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(2-OMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(2-Me)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(2-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(3-Cl)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(3-F)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(3-OMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(3-Me)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(3-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(4-Cl)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(4-F)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(4-OMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(4-Me)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(4-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Ph	N-Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Ph	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Ph	N-Me	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Ph	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Ph	N-Me	Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	S	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	S	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	S	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	S	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	S	OEt
CH ₂ Br	H	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	H	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	H	Me	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Me	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Et	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Pr-i	H	CF ₃	N-Me	Cl

【 0 0 5 9 】

【表 1 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Me	Me	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Et	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Pr	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	H	N-H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Pr	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Bu-n	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Bu-n	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Bu-s	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Bu-s	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Bu-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Bu-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Bu-t	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ SMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ SMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ OEt	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ OEt	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CHF ₂	Cl

10

20

30

40

【表 1 4】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ CF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ OMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ COOEt	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ COOEt	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ C≡CH	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ Bu-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Bu-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ Pen-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pen-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ Hex-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Hex-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ CCl=CHCl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CCl=CHCl	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Hex-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pen-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ NMe ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ NMe ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ NHMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ NHMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ N(Me)COMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ N(Me)COMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ N(Me)COCF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ N(Me)COCF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ CONH ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CONH ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ CONHMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CONHMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ CONMe ₂	CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 6 1 】

【表 15】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CONMe ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ COMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ COMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ CH ₂ COMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ COMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ COCF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ COCF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OBu-n
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OPen-c
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OHex-c
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ Pr-c
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	NH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	NHMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	NMe ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	NHPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	NMePh
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(2-Cl)
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(3-Cl)
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-Cl)
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-F)
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-Me)
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-OMe)
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	Pr-n

10

20

30

40

【 0 0 6 2 】

【表 16】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁶	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	NH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	NHMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	NMe ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Bu-t	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(4-COMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(4-CN)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(4-COOMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Ph(4-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pyrimidin-2-yl	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Pr	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Bu-n	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Bu-n	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Bu-s	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Bu-s	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Bu-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Bu-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Bu-t	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ SMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ SMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ OEt	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ OEt	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ CF ₃	CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 6 3 】

【表 17】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ OMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ COOEt	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ COOEt	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ C≡CH	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ Bu-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Bu-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ Pen-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pen-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ Hex-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Hex-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ CCl=CHCl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CCl=CHCl	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Hex-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Pen-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ NMe ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ NMe ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ NHMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ NHMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ N(Me)COMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ N(Me)COMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ N(Me)COCF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ N(Me)COCF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ CONH ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CONH ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ CONHMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CONHMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ CONMe ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CONMe ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ COMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ COMe	Cl

10

20

30

40

【 0 0 6 4 】

【表 18】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ CH ₂ COMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ COMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ COCF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ COCF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OBu-n
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OPen-c
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OHex-c
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ Pr-c
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	NH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	NHMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	NMe ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	NHPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	NMePh
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(2-Cl)
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(3-Cl)
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-Cl)
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-F)
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-Me)
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-OMe)
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	Pr-n
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	OCHF ₂

10

20

30

40

【 0 0 6 5 】

【表 19】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	NH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	NHMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	NMe ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Bu-t	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(4-COMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(4-CN)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(4-COOMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Ph(4-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Pyrimidin-2-yl	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Pr	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Bu-n	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Bu-n	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Bu-s	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Bu-s	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Bu-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Bu-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Bu-t	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ SMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ SMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ OEt	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ OEt	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ CF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ OMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ COOEt	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ COOEt	Cl

10

20

30

40

【 0 0 6 6 】

【表 20】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ C≡CH	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ Bu-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Bu-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ Pen-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pen-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ Hex-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Hex-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ CCl=CHCl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CCl=CHCl	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Hex-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pen-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ NMe ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ NMe ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ NHMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ NHMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ N(Me)COMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ N(Me)COMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ N(Me)COCF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ N(Me)COCF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ CONH ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CONH ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ CONHMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CONHMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ CONMe ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CONMe ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ COMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ COMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ CH ₂ COMe	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ CH ₂ COMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ COCF ₃	CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 6 7 】

【表 2 1】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ COCF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OBu-n
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OPen-c
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OHex-c
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	OCH ₂ Pr-c
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	NH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	NHMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	NMe ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	NHPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	NMePh
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(2-Cl)
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(3-Cl)
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-Cl)
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-F)
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-Me)
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	O-Ph(4-OMe)
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	Pr-n
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	NH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	NHMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	NMe ₂

10

20

30

40

【 0 0 6 8 】

【表 2 2】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Bu-t	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(4-COMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(4-CN)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(4-COOMe)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Ph(4-NO ₂)	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pyrimidin-2-yl	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-NH ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-NH ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OH	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OMe	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OEt	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OPr-i	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCH ₂ CF ₃	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Me	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	CONH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	CONHMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	CONMe ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	COOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	COOEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	COOPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	COMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	COEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCH ₂ CF ₃	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	F	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OMe	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-CHF ₂	CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 6 9 】

【表 2 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-Pr	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ Pr-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ C≡CH	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl	N-CH ₂ OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Pr	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ OMe	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	F	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OMe	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-NH ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-NH ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OH	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OMe	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OEt	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OPr-i	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCH ₂ CF ₃	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-Me	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	CONH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	CONHMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	CONMe ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	COOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	COOEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	COOPr-i

10

20

30

40

【 0 0 7 0 】

【表 2 4】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	COMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-Me	COEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCH ₂ CF ₃	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	F	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OMe	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-Pr	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ Pr-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ C≡CH	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl	N-CH ₂ OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-Pr	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ OMe	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	F	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OMe	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-NH ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-NH ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OH	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OMe	N-Me	CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 7 1 】

【表 25】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OEt	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OPr-i	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCH ₂ CF ₃	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Me	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	CONH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	CONHMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	CONMe ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	COOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	COOEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	COOPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	COMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	COEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCH ₂ CF ₃	N-Ph	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	F	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OMe	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-CHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-Pr	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ Pr-c	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ C≡CH	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl	N-CH ₂ OMe	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Pr	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ Pr-c	OCHF ₂

10

20

30

40

【 0 0 7 2 】

【表 2 6】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ C≡CH	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ OMe	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	F	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OMe	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-CH ₂ Pr-c	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-(CH ₂) ₂ O- N-(CH ₂) ₃ O- N-(CH ₂) ₂ S- N-(CH ₂) ₂ SO ₂ - N-(CH ₂) ₂ O- N-(CH ₂) ₃ O- N-(CH ₂) ₂ S- N-(CH ₂) ₂ SO ₂ - N-(CH ₂) ₂ O- N-(CH ₂) ₃ O- N-(CH ₂) ₂ S- N-(CH ₂) ₂ SO ₂ - N-(CH ₂) ₂ O- N-(CH ₂) ₃ O- N-(CH ₂) ₂ S- N-(CH ₂) ₂ SO ₂ - N-(CH ₂) ₂ O- N-(CH ₂) ₃ O- N-(CH ₂) ₂ S- N-(CH ₂) ₂ SO ₂ - N-(CH ₂) ₂ O- N-(CH ₂) ₃ O- N-(CH ₂) ₂ S- N-(CH ₂) ₂ SO ₂ - N-(CH ₂) ₂ O- N-(CH ₂) ₃ O- N-(CH ₂) ₂ S- N-(CH ₂) ₂ SO ₂ -	
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃		
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Cl		
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	F	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	Br

10

20

30

40

【 0 0 7 3 】

【表 27】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Br	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CN	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OMe	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OEt	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OPr-i	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OPr
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OCH(Me)CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OCH(Me)C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SOEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SPr-i

10

20

30

40

【 0 0 7 4 】

【表 28】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁶	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SOPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ Pr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SOCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SOCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Et	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Et	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Et	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Et	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Et	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Et	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Et	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Et	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Et	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	F	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	Br
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Br	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CN	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Et	CF ₃

【 0 0 7 5 】

【表 29】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OMe	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OEt	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OPr-i	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OPr
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OCH(Me)CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OCH(Me)C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Et	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SOEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SOPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ Pr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SOCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SOCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Et	SO ₂ CHF ₂

10

20

30

40

【 0 0 7 6 】

【表 3 0】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Et	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Et	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Et	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Et	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Et	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Et	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Et	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Et	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Et	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Et	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Et	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Br
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Br	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Br
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Br	N-Me	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	F	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	Br
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Br	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CN	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Pr-i	CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 7 7 】

【表 3 1】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OMe	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OEt	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OPr-i	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OPr
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH(Me)CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH(Me)C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ Pr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ CHF ₂

10

20

30

40

【 0 0 7 8 】

【表 3 2】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Pr-i	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Pr-i	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Me	N-Pr-i	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Pr-i	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Pr-i	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Et	N-Pr-i	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	F	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	Br
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Br	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CN	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OH
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OMe	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OEt	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OPr-i	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OPr

10

20

30

40

【 0 0 7 9 】

【表 3 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OBu-t
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OPh
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ Ph
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH(Me)CH=CH ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH(Me)C≡CH
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	OCH ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCH ₂ CHF ₂	N-Pr-i	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOPr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ Pr-i
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SOCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Pr-i	SO ₂ CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CHF ₂	N-Pr-i	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Pr-i	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Pr-i	OCHF ₂

10

20

30

40

【 0 0 8 0 】

【表 3 4】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Pr-i	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Me	N-Pr-i	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Pr-i	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Pr-i	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Pr-i	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Pr-i	CN
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Et	N-Pr-i	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	OCHF ₂	N-Pr-i	Cl
CHCl ₂	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHClF	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHFMe	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHClMe	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₂ Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CH ₂ F	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CHCl ₂	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CClF ₂	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₂ CF ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CF ₂ Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CHFMe	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₃	CF ₃	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHFPr-n	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₂ Pr-n	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHCl ₂	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHF ₂	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHClF	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHFMe	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHClMe	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₂ Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl

10

20

30

40

【 0 0 8 1 】

【表 3 5】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	R ¹⁵	Z ²	R ¹⁶
CH ₂ CH ₂ F	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CHCl ₂	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CClF ₂	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CH ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₂ CF ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CF ₂ Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CH ₂ CHFMe	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₃	CF ₃	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CHFPr-n	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl
CF ₂ Pr-n	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	N-Me	Cl

10

20

【 0 0 8 2 】

【表 3 6】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ¹⁸	R ¹⁹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Pr-i	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Pr	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Bu-t	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CH ₂ Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	OMe	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	OEt	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	OCHF ₂	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	OCH ₂ CF ₃	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	CF ₃	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	OCH ₂ CH=CH ₂	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	OCH ₂ C≡CH	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(2-Cl)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(2-F)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(2-OMe)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(2-Me)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(3-Cl)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(3-F)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(3-OMe)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(3-Me)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(4-Cl)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(4-F)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(4-OMe)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph(4-Me)	Cl	Me

10

20

30

40

【 0 0 8 3 】

【表 3 7】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ¹⁸	R ¹⁹
CH ₂ Br	H	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	H	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	H	Me	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Me	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Et	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Pr-i	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Me	Me	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Pr	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ F	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Br	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ I	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CF ₃	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -		H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -		H	2	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Et	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Pr-i	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Pr	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Bu-t	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-CH ₂ Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	OMe	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	OEt	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	OCHF ₂	Me

10

20

30

40

【 0 0 8 4 】

【表 3 8】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ¹⁸	R ¹⁹
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	OCH ₂ CF ₃	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	CF ₃	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	OCH ₂ CH=CH ₂	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	OCH ₂ C≡CH	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(2-Cl)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(2-F)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(2-OMe)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(2-Me)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(3-Cl)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(3-F)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(3-OMe)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(3-Me)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(4-Cl)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(4-F)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(4-OMe)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph(4-Me)	Cl	Me
CH ₂ Br	H	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	H	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	H	Me	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Me	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Et	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Pr-i	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Me	Me	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Et	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Pr	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ F	CH ₂ Cl	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Br	CH ₂ Cl	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ I	CH ₂ Cl	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me

10

20

30

40

【 0 0 8 5 】

【表 3 9】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ¹⁸	R ¹⁹
CF ₃	CH ₂ Cl	H	H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -		H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -		H	1	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Et	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Pr-i	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Pr	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Bu-t	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-CH ₂ Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	OMe	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	OEt	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	OCHF ₂	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	OCH ₂ CF ₃	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	CF ₃	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	OCH ₂ CH=CH ₂	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	OCH ₂ C≡CH	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(2-Cl)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(2-F)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(2-OMe)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(2-Me)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(3-Cl)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(3-F)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(3-OMe)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(3-Me)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(4-Cl)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(4-F)	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(4-OMe)	Cl	Me

10

20

30

40

【 0 0 8 6 】

【表 4 0】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ¹⁸	R ¹⁹
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph(4-Me)	Cl	Me
CH ₂ Br	H	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	H	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	H	Me	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Me	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Et	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Pr-i	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Me	Me	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Et	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Pr	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ F	CH ₂ Cl	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Br	CH ₂ Cl	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ I	CH ₂ Cl	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CF ₃	CH ₂ Cl	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -	H	H	0	H	H	N-Ph	Cl	Me
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	N-H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-H	CF ₃	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	COMe	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	COMe	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	COOMe	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	COOMe	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	OCHF ₂	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	OCHF ₂	Me
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	OCHF ₂	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	CF ₃	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	CF ₃	Me

10

20

30

40

【 0 0 8 7 】

【表 4 1】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁴	R ¹⁸	R ¹⁹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	CF ₃	Et
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-CHF ₂	-(CH ₂) ₃ -	
CHCl ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CHClF	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CHFMe	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CHClMe	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CF ₂ Me	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CH ₂ F	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CHCl ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CClF ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CF ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CF ₂ CF ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CF ₂ Me	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CH ₂ CHFMe	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CF ₃	CF ₃	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CHFPr-n	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H
CF ₂ Pr-n	Me	H	H	2	H	H	N-Me	CF ₃	H

10

20

30

【 0 0 8 8 】

【表 4 2】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁵	R ²⁰	R ²¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	H	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	H	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	S	Me	H
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	H	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	H	Me	H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Me	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Et	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Pr-i	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Me	Me	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Pr	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Br	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ F	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ I	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OEt
CF ₃	Me	H	H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	2	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -		H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	2	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -		H	2	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Me	H	OMe

10

20

30

40

【 0 0 8 9 】

【表 4 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁵	R ²⁰	R ²¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Me	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Me	H	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Me	H	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	S	Me	H
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	H	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	H	Me	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Me	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Et	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Pr-i	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Me	Me	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Et	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Pr	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Br	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ F	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ I	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OEt
CF ₃	Me	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -	H	H	1	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	H	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	H	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OMe

10

20

30

40

【 0 0 9 0 】

【表 4 4】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁵	R ²⁰	R ²¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	S	Me	H
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	H	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	H	Me	H	0	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Me	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Et	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Pr-i	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Me	Me	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Et	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Pr	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Br	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ F	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ I	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OEt
CF ₃	Me	H	H	0	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	0	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -		H	0	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	0	H	H	N-Ph	H	OMe
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -		H	0	H	H	N-Ph	H	OEt
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	S	H	H
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	N-H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHCl ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHClF	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHFMe	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 9 1 】

【表 4 5】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁵	R ²⁰	R ²¹
CHClMe	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₂ Me	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CH ₂ F	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CHCl ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CClF ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₂ CF ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CF ₂ Me	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CHFMe	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₃	CF ₃	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHFPr-n	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₂ Pr-n	Me	H	H	2	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHCl ₂	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHF ₂	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHClF	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHFMe	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHClMe	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₂ Me	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CH ₂ F	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CHCl ₂	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CClF ₂	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CH ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃

10

20

30

40

【 0 0 9 2 】

【表 4 6】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Z ⁵	R ²⁰	R ²¹
CH ₂ CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₂ CF ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CF ₂ Me	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CH ₂ CHFMe	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₃	CF ₃	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CHFPr-n	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃
CF ₂ Pr-n	Me	H	H	0	H	H	N-Me	Cl	CF ₃

【 0 0 9 3 】

【表 4 7】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	1,2,4-Oxadiazol-3-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Pr-i	H	4-Trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4,6-Dichloropyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	1,4-Dimethylimidazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Methyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Phenyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Chloro-6-methylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Chloro-6-methoxypyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl
CH ₂ Cl	H	H	H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	H	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	H	Me	H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Me	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Et	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Pr-i	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Me	Me	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Et	H	H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl

10

20

30

40

【 0 0 9 4 】

【表 4 8】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	Pr	H	H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Br	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ F	Me	H	H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ I	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₃	Me	H	H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -		H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -		H	2	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4,6-Bis(difluoromethoxy)pyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	1,2,4-Oxadiazol-3-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Pr-i	H	4-Trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4,6-Dichloropyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	1,4-Dimethylimidazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4-Methyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4-Phenyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4-Chloro-6-methylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4-Chloro-6-methoxypyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl
CH ₂ Cl	H	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	H	H	H	1	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	H	Me	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl

10

20

30

40

【 0 0 9 5 】

【表 4 9】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Me	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Et	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Pr-i	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Me	Me	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Et	H	H	1	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Et	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	1	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Pr	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	1	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Br	Me	H	H	1	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ F	Me	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ I	Me	H	H	1	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₃	Me	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -	H	H	1	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -	H	H	1	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -	H	H	1	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	1,2,4-Oxadiazol-3-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	3-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Pr-i	H	4-Trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4,6-Dichloropyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4,6-Bis(difluoromethoxy)pyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	1,4-Dimethylimidazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Methyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl

10

20

30

【 0 0 9 6 】

【表 50】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Phenyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Chloro-6-methylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Chloro-6-methoxypyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl
CH ₂ Cl	H	H	H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	H	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	H	Me	H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Me	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Et	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Pr-i	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Me	Me	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Et	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Et	H	H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Pr-i	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Pr	H	H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Br	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ F	Me	H	H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ I	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₃	Me	H	H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₄ -		H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	-(CH ₂) ₆ -		H	0	H	H	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	Pyrrol-1-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	Oxazol-2-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	H	H	2	H	H	1H-Imidazol-2-yl
CH ₂ Cl	CF ₃	H	H	2	H	H	1H-Imidazol-4-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	1H-Imidazol-5-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	1H-1,3,4-Triazol-2-yl

10

20

30

40

【 0 0 9 7 】

【表 5 1】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	1H-1,3,4-Triazol-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-iso-Propoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Difluoromethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Methoxy-2-methyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-2-methyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2,4-Dimethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2,4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2-Amino-4-methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2-Amino-4-ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Methoxy-2-methylthio-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-2-methylthio-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Methoxy-2-methylsulfonyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-2-methylsulfonyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2-Difluoromethoxy-4-methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2-Difluoromethoxy-4-ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2-Cyano-4-methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2-Cyano-4-ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Methoxy-2-methylamino-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-2-methylamino-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2-Dimethylamino-4-methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	2-Dimethylamino-4-ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl

【 0 0 9 8 】

【表 5 2】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Cyano-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-iso-Propoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Difluoromethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Methoxy-2-methyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-2-methyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2,4-Dimethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2,4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2-Amino-4-methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2-Amino-4-ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Methoxy-2-methylthio-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-2-methylthio-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Methoxy-2-methylsulfonyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-2-methylsulfonyl-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2-Difluoromethoxy-4-methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2-Difluoromethoxy-4-ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2-Cyano-4-methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2-Cyano-4-ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Methoxy-2-methylamino-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-2-methylamino-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2-Dimethylamino-4-methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl

10

20

30

40

【 0 0 9 9 】

【表 5 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	2-Dimethylamino-4-ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Cyano-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHCl ₂	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHClF	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHFMe	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHClMe	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₂ Me	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CH ₂ F	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CHCl ₂	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CClF ₂	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CH ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CH ₂ CHF	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₂ CF ₂ CF ₃	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CF ₂ Me	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CHFMe	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₃	CF ₃	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHFPr-n	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₂ Pr-n	Me	H	H	2	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHCl ₂	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHF ₂	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHClF	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHFMe	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHClMe	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₂ Me	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CH ₂ F	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CHF ₂	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CHCl ₂	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CClF ₂	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl

10

20

30

40

【 0 1 0 0 】

【表 5 4】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CH ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CH ₂ CHF	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₂ CF ₂ CF ₃	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CF ₂ Me	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CH ₂ CHFMe	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₃	CF ₃	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CHFPr-n	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl
CF ₂ Pr-n	Me	H	H	0	H	H	4-Ethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-5-yl

【 0 1 0 1 】

【表 5 5】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Benzimidazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Benzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	3-Chlorobenzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Benzotriazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	1-Methylindazol-4-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Benzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	3-Methylbenzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	3-Bromobenzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Benzothiophen-7-yl
CF ₃	Me	H	H	2	H	H	Benzothiophen-7-yl
CH ₂ F	Me	H	H	2	H	H	Benzothiophen-7-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	1-Methylindazol-7-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	3-Chloro-1-methylindol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Benzimidazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Benzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	3-Chlorobenzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Benzotriazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	1-Methylindazol-4-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Benzothiophen-3-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	5-Chlorobenzothiophen-3-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Benzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	3-Methylbenzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	3-Bromobenzothiophen-2-yl
CH ₂ Br	Me	H	H	1	H	H	Benzothiophen-7-yl
CF ₃	Me	H	H	1	H	H	Benzothiophen-7-yl
CH ₂ F	Me	H	H	1	H	H	Benzothiophen-7-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	Benzothiophen-7-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	1-Methylindazol-7-yl

10

20

30

40

【 0 1 0 2 】

【表 5 6】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	H	H	3-Chloro-1-methylindol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Benzimidazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Benzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	3-Chlorobenzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Benzotriazol-1-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	1-Methylindazol-4-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Benzothiophen-3-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	5-Chlorobenzothiophen-3-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Benzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	3-Methylbenzothiophen-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	3-Bromobenzothiophen-2-yl
CH ₂ Br	Me	H	H	0	H	H	Benzothiophen-7-yl
CF ₃	Me	H	H	0	H	H	Benzothiophen-7-yl
CH ₂ F	Me	H	H	0	H	H	Benzothiophen-7-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	Benzothiophen-7-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	1-Methylindazol-7-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	H	H	3-Chloro-1-methylindol-2-yl
CH ₂ Cl	Pr-c	H	H	2	H	H	Benzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Chlorobenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	5-Chlorobenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	6-Chlorobenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	7-Chlorobenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Fluorobenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	5-Fluorobenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	6-Fluorobenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	7-Fluorobenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	4-Methylbenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	5-Methylbenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	6-Methylbenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	7-Methylbenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	4-Methoxybenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	5-Methoxybenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	6-Methoxybenzoxazol-2-yl

10

20

30

40

【 0 1 0 3 】

【表 5 7】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	7-Methoxybenzoxazol-2-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Quinolin-2-yl
CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	2	H	H	Quinolin-6-yl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	H	H	Quinoxalin-2-yl

10

【 0 1 0 4 】

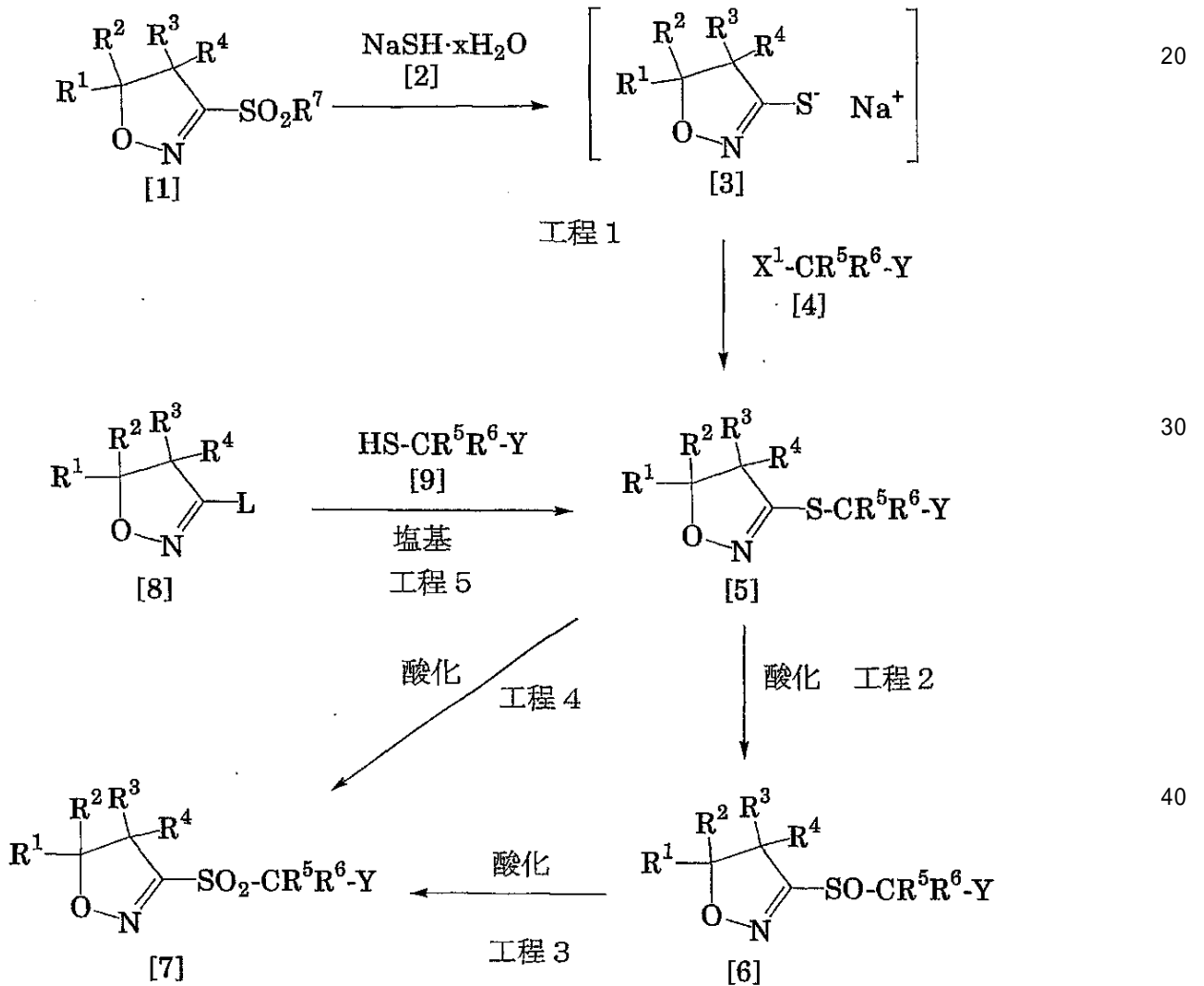
一般式 [1] を有する本発明化合物は、以下に示す方法により製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

【 0 1 0 5 】

< 製造法 1 >

(工程 1 ~ 工程 5)

【 化 3 】



(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びYは前記と同じ意味を表し、X¹はハロゲン原子を表し、R⁷はC1~C4のアルキル基、置換されていてもよいフェニル基又は置換されていてもよいベンジル基を表し、Lはハロゲン原子、C1~C4のアルキルスルホニル基

50

、置換されていてもよいフェニルスルホニル基又は置換されていてもよいベンジルスルホニル基等の脱離基を表し、 x は1以上の数値を表す。)

【0106】

以下、上記製造方法を各工程毎に詳説する。

【0107】

(工程1)

一般式[5]で表されるスルフィド誘導体は、一般式[1]で表される化合物と、一般式[2]で示される水硫化ナトリウム水和物を、溶媒中又は溶媒の非存在下(好ましくは適当な溶媒中で)、塩基の存在下又は非存在下で反応させることにより一般式[3]で表されるメルカプタンの塩を反応系内で製造した後、このメルカプタンの塩[3]を単離することなく、一般式[4]で表されるハロゲン誘導体と反応させる{場合によってはラジカル発生剤(例えばロンガリット[商品名]: $\text{C}_6\text{H}_5(\text{OH})\text{SO}_2\text{Na} \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ 等)を添加することもできる}ことによって製造することができる。

10

【0108】

反応温度は、いずれの反応も0 から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは0 ~ 100 の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが0.5時間 ~ 24時間である。

【0109】

反応に供される試剤の量は、一般式[1]で表される化合物1当量に対して、一般式[2]で表される化合物及び一般式[4]で表される化合物1~3当量、塩基を使用する場合は、塩基0.5~3当量である。

20

【0110】

溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類;ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類;N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類;ジメチルスルホキシド(DMSO)又はスルホラン等の硫黄化合物;ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類;メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtert-ブタノール等のアルコール類;アセトン又は2-ブタノン等のケトン類;アセトニトリル等のニトリル類;水、或いはこれらの混合物が挙げられる。

30

【0111】

塩基としては、例えば水酸化ナトリウム等の金属水酸化物類;ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロピルアミド等のアルカリ金属アミド類;ピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基類;水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物;水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物;炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩;炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩等の無機塩類、或いはナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド又はカリウムtert-ブトキシド等の金属アルコラート類が挙げられる。

【0112】

(工程2)

一般式[6]で表されるスルホキシド誘導体は、一般式[5]で表されるスルフィド誘導体と酸化剤とを、適当な溶媒中、触媒の存在下又は触媒の非存在下で反応させることにより製造することができる。

40

【0113】

反応温度は、0 から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは0 ~ 60 の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが1時間 ~ 72時間である。

【0114】

反応に供される試剤の量は、一般式[5]で表される化合物1当量に対して、酸化剤1~3当量であり、触媒を使用する場合は、触媒0.01~0.5当量である。

50

【 0 1 1 5 】

溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ジオキサン、テトラヒドロフラン（THF）、ジメトキシエタン又はジエチルエーテル等のエーテル類；N，N - ジメチルアセトアミド、N，N - ジメチルホルムアミド（DMF）又はN - メチル - 2 - ピロリジノン等のアミド類；メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtert - ブタノール等のアルコール類；アセトン又は2 - ブタノン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；酢酸；水、或いはこれらの混合物が挙げられる。

【 0 1 1 6 】

酸化剤としては、例えば、m - クロロ過安息香酸、過酸化水素、過ギ酸又は過酢酸等の有機過酸化物、或いは過マンガン酸カリウム又は過ヨウ素酸ナトリウム等の無機過酸化物が挙げられる。

【 0 1 1 7 】

触媒としては、例えば、タングステン酸ナトリウム等の金属触媒が挙げられる。

【 0 1 1 8 】

（工程3）

一般式[7]で表されるスルホン誘導体は、一般式[6]で表されるスルホキシド誘導体と酸化剤とを、適当な溶媒中、触媒の存在下又は触媒の非存在下で反応させることにより製造することができる。

【 0 1 1 9 】

反応温度は、0 から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは0 ~ 60 の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが1時間 ~ 72時間である。

【 0 1 2 0 】

反応に供される試剤の量は、一般式[6]で表される化合物1当量に対して、酸化剤1 ~ 3当量であり、触媒を使用する場合は、触媒0.01 ~ 0.5当量である。

【 0 1 2 1 】

溶媒、酸化剤及び触媒としては、工程2と同様なものが挙げられる。

【 0 1 2 2 】

（工程4）

一般式[7]で表されるスルホン誘導体は、適当な溶媒中、触媒の存在下又は触媒の非存在下で、一般式[5]で表されるスルフィド誘導体と好適な量の酸化剤により、一般式[6]で表されるスルホキシド誘導体を単離することなく製造することもできる。

【 0 1 2 3 】

反応温度は、0 から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは0 ~ 60 の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが1時間 ~ 72時間である。

【 0 1 2 4 】

反応に供される試剤の量は、一般式[5]で表される化合物1当量に対して、酸化剤1 ~ 3当量であり、触媒を使用する場合は、触媒0.01 ~ 0.5当量である。

【 0 1 2 5 】

溶媒、酸化剤及び触媒としては、工程2と同様なものが挙げられる。

【 0 1 2 6 】

（工程5）

一般式[5]で示されるスルフィド誘導体は、一般式[8]で表される化合物と、一般式[9]で示されるメルカプタン誘導体とを、溶媒中又は溶媒の非存在下（好ましくは適当な溶媒中）、塩基の存在下で反応させることにより製造することもできる。

【 0 1 2 7 】

反応温度は、0 から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは0 ~ 100 の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが0.5時間 ~ 24時間である。

10

20

30

40

50

【 0 1 2 8 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [8] で表される化合物 1 当量に対して、一般式 [9] で表される化合物 1 ~ 3 当量、塩基 0 . 5 ~ 3 当量である。

【 0 1 2 9 】

溶媒としては、例えばジエチルエーテル、ジメトキシエタン、ジオキサン又はテトラヒドロフラン (T H F) 等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；N , N - ジメチルアセトアミド、N , N - ジメチルホルムアミド (D M F) 又はN - メチル - 2 - ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド (D M S O) 又はスルホラン等の硫黄化合物；ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類；メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又は t e r t - ブタノール等のアルコール類；アセトン又は 2 - ブタノン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；水、或いはこれらの混合物が挙げられる。

10

【 0 1 3 0 】

塩基としては、例えば水素化ナトリウム等の金属水素化物類；ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロピルアミド等のアルカリ金属アミド類；ピリジン、トリエチルアミン又は 1 , 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] - 7 - ウンデセン等の有機塩基類；水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物；炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩等の無機塩基類、或いはナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド又はカリウム t e r t - ブトキシド等の金属アルコキシドが挙げられる。

20

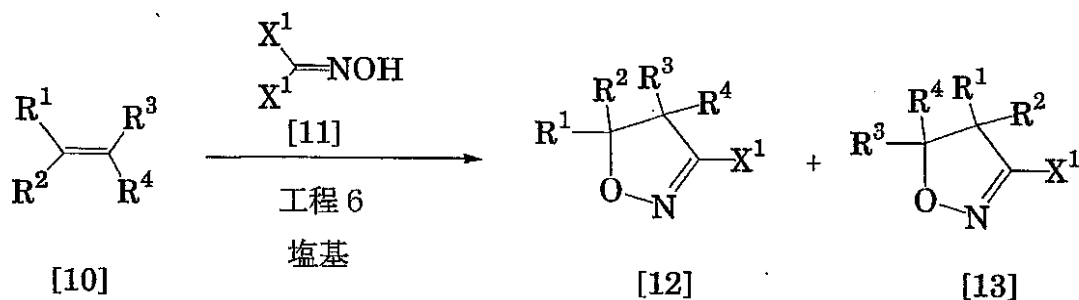
【 0 1 3 1 】

一般式 [8] で示される化合物のうち L がハロゲン原子で表される一般式 [1 2] 及び [1 3] で示される化合物は、以下に示す方法により製造することができる。

【 0 1 3 2 】

(工程 6)

【 化 4 】



30

(式中、X¹、R¹、R²、R³及びR⁴は前記と同じ意味を表す。)

40

【 0 1 3 3 】

一般式 [1 2] 及び [1 3] で表されるイソオキサゾリン化合物は、一般式 [1 0] で表されるオレフィン誘導体と、一般式 [1 1] で示されるオキシム誘導体とを、溶媒中又は溶媒の非存在下 (好ましくは適当な溶媒中)、塩基の存在下で反応させることにより製造することができ、必要に応じ一般式 [1 2] と [1 3] を分離精製する。但し、R³、R⁴の両者が水素原子の場合には一般式 [1 2] で表されるイソオキサゾリン化合物が優先的に得られる。

【 0 1 3 4 】

反応温度は、0 から反応系における還流温度までの任意の温度、好ましくは 1 0 ~ 8 0 の温度範囲であり、反応時間は、化合物により異なるが 0 . 5 時間 ~ 2 週間である

50

【 0 1 3 5 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [1 1] で表される化合物 1 当量に対して、一般式 [1 0] で表される化合物 1 ~ 3 当量である。

【 0 1 3 6 】

溶媒としては、例えばエチレングリコールジメチルエーテル、エチレングリコールジエチルエーテル、ジエチルエーテル、ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類；ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類；酢酸エチル又は酢酸ブチル等の酢酸エステル類；水、或いはこれらの混合物等が挙げられる。

10

【 0 1 3 7 】

塩基としては、例えば水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物類；水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物類；炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩類；酢酸ナトリウム又は酢酸カリウム等のアルカリ金属酢酸塩類；フッ化ナトリウム又はフッ化カリウム等のアルカリ金属フッ素化塩類、或いはピリジン、トリエチルアミン又は 1, 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] - 7 - ウンデセン等の有機塩基類等が挙げられる。

【 0 1 3 8 】

尚、上記製造方法で用いる製造中間体である一般式 [1 0] で表される化合物は、市販のものを用いるか、又はウィッティヒ (Wittig) 反応等の公知の反応により製造することができる。又、一般式 [1 1] で示される化合物は、例えば、Liebig's Annalen der Chemie, 985(1989)に記載の方法に準じて製造することができる。

20

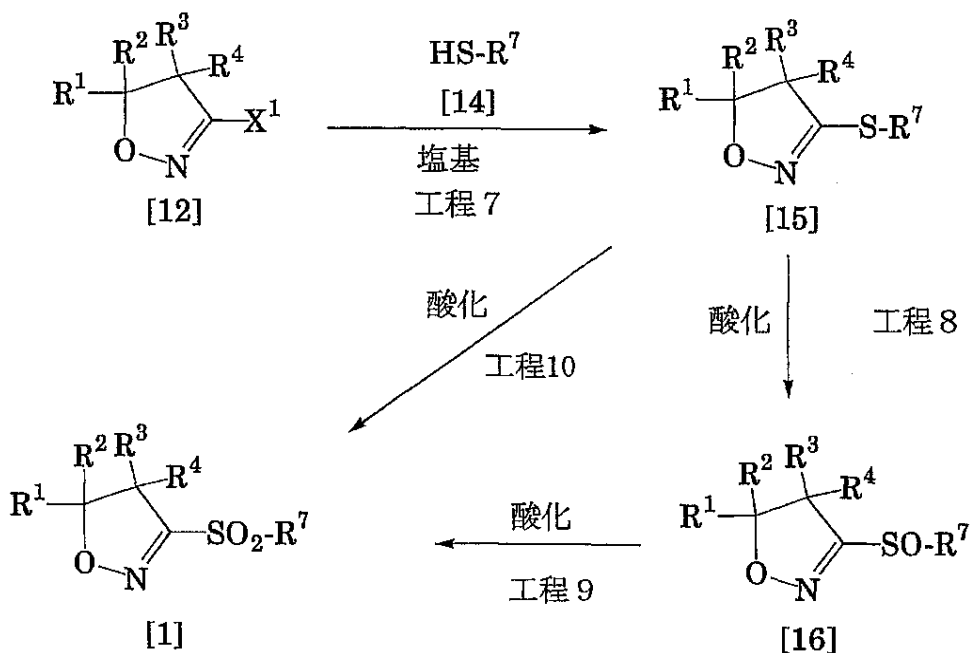
【 0 1 3 9 】

一般式 [1] で表される化合物は、前記に示した一般式 [1 2] で表される化合物から、以下の方法により製造することができる。

【 0 1 4 0 】

(工程 7 ~ 工程 1 0)

【 化 5 】



30

40

(式中、 X^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^7 は前記と同じ意味を表す。)

50

【0141】

一般式[15]で表される化合物は、前記工程5に示した方法に準じ(工程7)、一般式[16]で表される化合物は、前記工程2に示した方法に準じ(工程8)、一般式[1]で表される化合物は、一般式[15]から前記工程4に示した方法(工程10)、又は、一般式[16]から前記工程3に示した方法に準じ(工程9)、それぞれ製造することができる。溶媒、塩基、酸化剤及び触媒としては工程2、工程3、工程4又は工程5で記載したものと同一ものが挙げられる。

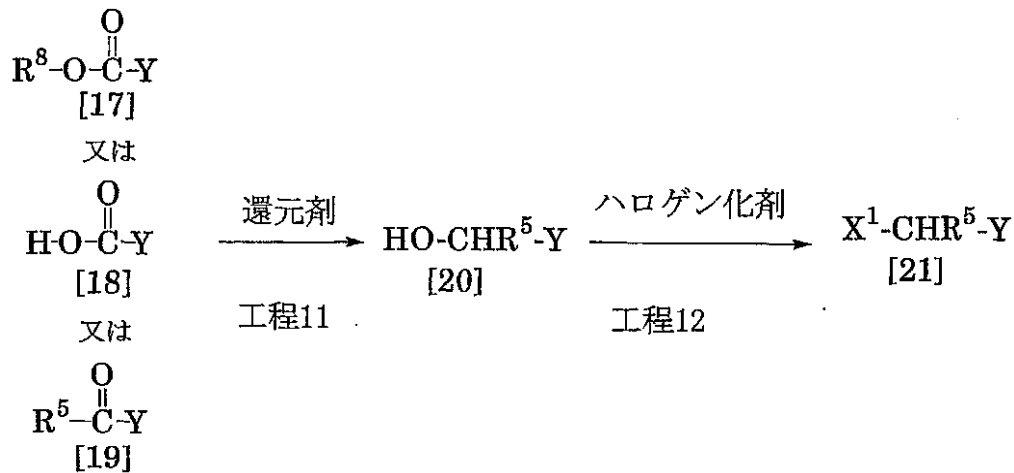
【0142】

一般式[4]で表される化合物中、一般式[21]で表される化合物は、以下に示す方法により製造することができる。

【0143】

(工程11、12)

【化6】



(式中、R⁵、X¹及びYは前記と同じ意味を表し、R⁸はアルキル基を表す。)

【0144】

(工程11)

一般式[20]で表される化合物は、一般式[17]、[18]又は[19]と還元剤とを溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【0145】

この反応は通常、反応温度 - 60 ~ 150 で10分~24時間行う。

【0146】

反応に供される試剤の量は、一般式[17]、[18]又は[19]1当量に対して、還元剤0.5~2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0147】

還元剤としては、一般式[17]から一般式[20]の製造では、例えば水素化ジイソブチルアルミニウム等の金属水素化物類、又は水素化ホウ素ナトリウム又は水素化リチウムアルミニウム等の金属水素錯化合物類が挙げられ、一般式[18]又は[19]から一般式[20]の製造では、例えば水素化ジイソブチルアルミニウム等の金属水素化物類、水素化ホウ素ナトリウム又は水素化リチウムアルミニウム等の金属水素錯化合物類、或いはジボラン等が挙げられる。

【0148】

溶媒としては、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、或いはメタノール又はエタノール等のアルコール類が挙げられる。

【 0 1 4 9 】

(工 程 1 2)

一般式 [2 1] で表される化合物は、一般式 [2 0] とハロゲン化剤とを溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【 0 1 5 0 】

この反応は通常、反応温度 - 5 0 ~ 1 0 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

【 0 1 5 1 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [2 0] 1 当量に対して、ハロゲン化剤 1 ~ 3 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【 0 1 5 2 】

ハロゲン化剤としては、例えば塩化水素、臭化水素、三塩化リン、三臭化リン又は塩化チオニル等が挙げられる。

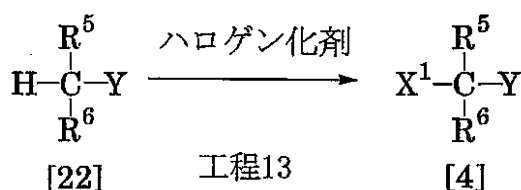
【 0 1 5 3 】

溶媒としては、例えばジクロロエタン又は四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；酢酸等の酸類、或いはテトラヒドロフラン等のエーテル類が挙げられる。

【 0 1 5 4 】

一般式 [4] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【 化 7 】



(式中、R⁵、R⁶、X¹及びYは前記と同じ意味を表す。)

【 0 1 5 5 】

(工 程 1 3)

一般式 [4] で表される化合物は、一般式 [2 2] で表される化合物とハロゲン化剤とを溶媒中、触媒の存在下又は非存在下で反応させることにより製造することができる。本工程では光照射下で反応をおこなってもよい。

【 0 1 5 6 】

この反応は通常、反応温度 3 0 ~ 1 5 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

【 0 1 5 7 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [2 2] 1 当量に対して、ハロゲン化剤 1 ~ 1 0 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。触媒は 0 . 0 1 ~ 0 . 5 当量である。

【 0 1 5 8 】

ハロゲン化剤としては、例えば臭素又は塩素等のハロゲン類；N - プロモコハク酸イミド等のN - ハロコハク酸イミド、或いは過臭化ピリジニウム等のピリジン塩等が挙げられる。

【 0 1 5 9 】

溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、或いはギ酸又は酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

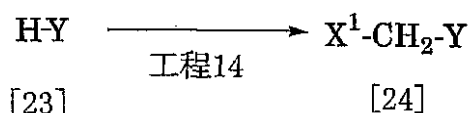
【 0 1 6 0 】

触媒としては、例えば過酸化ベンゾイル、
、
 - アゾビスイソブチロニトリル又はこれらの混合物が挙げられる。

【 0 1 6 1 】

一般式 [4] で表される化合物中、一般式 [2 4] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【化 8】



(式中、 X^1 及び Y は前記と同じ意味を表す。)

【 0 1 6 2 】

(工程 1 4)

一般式 [2 4] で表される化合物は、Org.Synth., III, 557(1955) 又は J. Am. Chem. Soc., 72, 2216(1950) に記載の方法に準じて、一般式 [2 3] で表される化合物とハロゲン化水素及びホルムアルデヒドもしくはパラホルムとを、溶媒中、ルイス酸存在下もしくは非存在下で反応させるか、或いは J. Am. Chem. Soc., 97, 6155(1975) に記載の方法に準じて、一般式 [2 3] で表される化合物とハロゲノメチルエーテルとを、溶媒中、ルイス酸存在下で反応させる方法により製造することができる。

【 0 1 6 3 】

この反応は通常、反応温度 - 4 0 ~ 1 5 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

【 0 1 6 4 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [2 3] 1 当量に対して、ハロゲン化水素 1 ~ 2 当量、ホルムアルデヒドもしくはパラホルム 1 ~ 2 当量、ルイス酸 1 ~ 2 当量、及びハロゲノメチルエーテル 1 ~ 2 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【 0 1 6 5 】

ルイス酸としては、例えば四塩化チタン、塩化亜鉛、塩化アルミニウム又は臭化亜鉛等が挙げられる。

【 0 1 6 6 】

ハロゲン化水素としては、塩化水素、臭化水素又はヨウ化水素が挙げられる。

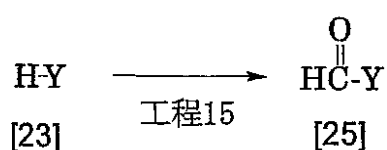
【 0 1 6 7 】

溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類；ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類；ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類；酢酸等のカルボン酸類；二硫化炭素、或いはこれらの混合物が挙げられる。

【 0 1 6 8 】

一般式 [1 9] で表される化合物中、一般式 [2 5] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【化 9】



(式中、Y は前記と同じ意味を表す。)

【 0 1 6 9 】

(工程15)

一般式[25]で表される化合物は、Org.Synth., IV, 831(1963)に記載のビルスマイヤー(Vilsmeier)法に準じて、一般式[23]とN,N-ジメチルホルムアミド(DMF)とを溶媒中又は溶媒の非存在下、塩化ホスホリル、ホスゲン又は塩化チオニル存在下で反応させるか、或いはChem.Ber., 93, 88(1960)に記載の方法に準じて、一般式[23]とジハロゲノメチルエーテルとを溶媒中、ルイス酸存在下で反応させた後、加水分解する方法により製造することができる。

【0170】

この反応は通常、反応温度 - 40 ~ 150 で10分 ~ 24時間行う。

【0171】

反応に供される試剤の量は、一般式[23]で表される化合物1当量に対して、塩化ホスホリル、ホスゲン又は塩化チオニル1 ~ 2当量、N,N-ジメチルホルムアミド1 ~ 2当量、ルイス酸1 ~ 2当量、ジハロゲノメチルエーテル1 ~ 2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0172】

ルイス酸としては、例えば四塩化チタン、四塩化スズ、塩化亜鉛、塩化アルミ又は臭化亜鉛等が挙げられる。

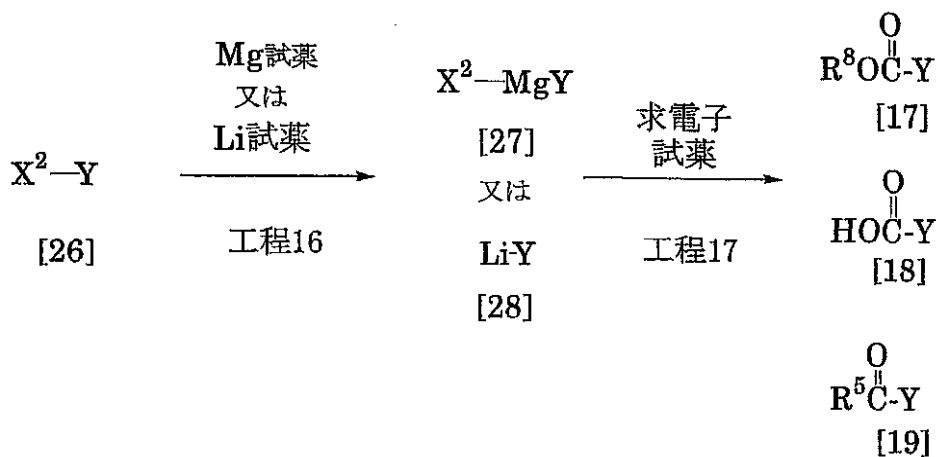
【0173】

溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類；ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類；ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類；酢酸等のカルボン酸類；N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド類；二硫化炭素等の硫黄化合物類、或いはこれらの混合物が挙げられる。

【0174】

一般式[17]、[18]及び[19]で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【化10】



(式中、 X^2 は塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表し、 R^5 、 R^8 及びYは前記と同じ意味を表す。)

【0175】

(工程16、17)

一般式[17]、[18]又は[19]で表される化合物は、J.Org.Chem., 65, 4618(2000)に記載の方法に準じて、一般式[26]で表される化合物とマグネシウム試薬とを溶媒中又は溶媒の非存在下、反応させることによって一般式[27]を得た後、一般式[27]と求電子試薬とを反応させるか、或いはSynth.Comm., 24(2), 253(1994)に記載の方

10

20

30

40

50

法に準じて、一般式 [2 6] とリチウム試薬とを溶媒中で反応させ一般式 [2 8] を得た後、一般式 [2 8] と求電子試薬とを反応させる方法により製造することができる。

【 0 1 7 6 】

この反応は通常、反応温度 - 1 0 0 ~ 1 5 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

【 0 1 7 7 】

反応に供される試薬の量は、一般式 [2 6] 1 当量に対して、マグネシウム試薬 1 ~ 5 当量及び求電子試薬 1 ~ 5 当量、或いはリチウム試薬 1 ~ 5 当量及び求電子試薬 1 ~ 5 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【 0 1 7 8 】

マグネシウム試薬としては、例えば金属マグネシウム、臭化イソプロピルマグネシウム又はジイソプロピルマグネシウム等が挙げられる。

10

【 0 1 7 9 】

リチウム試薬としては、例えば n - ブチルリチウム又は n - ヘキシルリチウム等が挙げられる。

【 0 1 8 0 】

求電子試薬としては、例えばギ酸エチル、シアノギ酸エチル又は酢酸エチル等のエステル類；アセチルクロリド又はクロロギ酸メチル等の酸ハライド類；N, N - ジメチルホルムアミド等のアミド類、或いは二酸化炭素等が挙げられる。

【 0 1 8 1 】

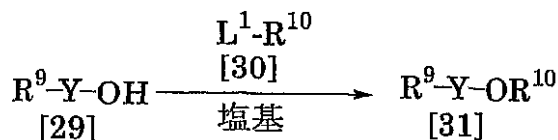
溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類；ヘキサン又はペンタン等の脂肪族炭化水素類；ジオキサン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、或いはそれらの混合物が挙げられる。

20

【 0 1 8 2 】

一般式 [3 1] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【 化 1 1 】



工程18

30

(式中、Y は前記と同じ意味を表し、R⁹ は水素原子、アルキル基、アシル基又はアルコキシカルボニル基を表し、R¹⁰ はアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、置換されていてもよいベンジル基、置換されていてもよいヘテロ環アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基又は置換されていてもよいベンゾイル基を表し、L¹ はハロゲン原子、C1~C4アルキルスルホニルオキシ基、C1~C4アルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基、置換されていてもよいフェニルスルホニルオキシ基又は置換されていてもよいベンジルスルホニルオキシ基等の脱離基を表す。但し、R¹⁰ がハロアルキル基の場合は、L¹ はハロアルキル化して残ったハロゲン原子より反応性の高い脱離基を表す。例えばR¹⁰ がCH₂F₂基の場合、L¹ は塩素原子又は臭素原子を表し、R¹⁰ がCH₂CF₃基の場合はL¹ は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、p - トルエンスルホニルオキシ基、メチルスルホニルオキシ基又はトリフルオロメチルスルホニルオキシ等を表す。)

40

【 0 1 8 3 】

(工程 1 8)

50

一般式 [3 1] で表される化合物は、一般式 [2 9] で表される化合物と一般式 [3 0] で表される化合物とを溶媒中、塩基存在下で反応させることにより製造することができる。

【 0 1 8 4 】

この反応は通常、反応温度 0 ~ 1 2 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

【 0 1 8 5 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [2 9] で表される化合物 1 当量に対して、一般式 [3 0] で表される化合物は 1 ~ 2 0 当量、塩基は 1 ~ 3 当量である。

【 0 1 8 6 】

塩基としては、例えば炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類；水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物類；水素化カリウム又は水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類；ナトリウムエトキシド又はナトリウムメトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、或いは 1 , 8 - ジアザピシクロ [5 . 4 . 0] - 7 - ウンデセン等の有機塩基類が挙げられる。

10

【 0 1 8 7 】

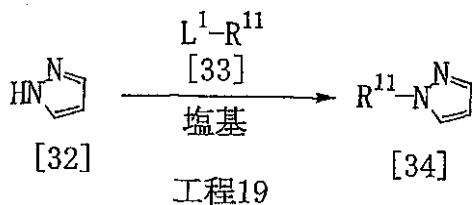
溶媒としては例えばクロロホルム又はジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類；ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類；ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類；アセトン又はメチルイソブチルケトン等のケトン類；酢酸エチル等のエステル類；N - メチルピロリドン又は N , N - ジメチルホルムアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物；アセトニトリル、或いはそれらの混合物が挙げられる。

20

【 0 1 8 8 】

一般式 [3 4] で表される化合物は、以下の方法により製造することができる。

【 化 1 2 】



30

(式中、L¹、
、
又は
は前記と同じ意味を表し、R¹¹はアルキル基、置換基群
より選択される任意の基でモノ置換されたアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、置換基群
より選択される任意の基でモノ置換されたアルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カルバモイル基 (該基の窒素原子は同一又は異なって、アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい) を表す。この場合、ピラゾール環の炭素原子は、置換基群
より選択される、1 ~ 2 個の同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

40

【 0 1 8 9 】

(工程 1 9)

一般式 [3 4] で表される化合物は、一般式 [3 2] で表される化合物を溶媒中、塩基存在下、一般式 [3 3] で表される化合物と反応させることにより製造することができる。

50

【 0 1 9 0 】

この反応は通常、反応温度 0 ~ 1 2 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

【 0 1 9 1 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [3 2] で表される化合物 1 当量に対して、一般式 [3 3] で表される化合物は 1 ~ 2 0 当量、塩基は 1 ~ 3 当量である。

【 0 1 9 2 】

塩基及び溶媒としては、例えば工程 1 8 と同様なものが挙げられる。

【 0 1 9 3 】

又、Y にトリフルオロメチル基を導入する方法として、J.Chem. Soc. PerkinTrans.1,8, 2293-2299(1990)、J.Fluorine Chem.,50(3),411-426 (1990)、J.Chem.Soc. Chem.Commun.,18,1389-1391(1993)、J.Chem.Soc. Chem.Commun., 1,53-54(1992)、Chem.Lett., 1719-1720(1981)、Chem. Pharm.Bull., 38(9), 2446-2458(1990)、J.Chem. Soc. Perkin Trans.1, 921-926(1988)、Heterocycles, 37(2),775-782(1994)、Tetrahedron Lett., 30(16), 2133-2136(1989)、J.Chem.Soc.Perkin TRans.1, 2755-2761 (1980)、Heterocycles, 22(1), 117-124(1984)、Eur.J.Med.Chem.Chim. Ther.,24,249-258(1989)、Acta Chem.Scand.Ser.B, 38(6),505-508(1984)、J.Fluorine Chem.,21,495-514(1982)、J.Chem.Soc.Chem.Commun., 10,638-639(1988)、J.Fluorine Chem.,67(1),5-6(1994)、J.Heterocycl. Chem., 31(6), 1413-1416(1994)、Chem.Heterocycl.Comp., 30(5), 576-578(1994)、J.Fluorine Chem., 78(2),177-182(1996)、J.Heterocycl. Chem., 34(2),551-556(1997)、Tetrahedron, 55(52),15067-15070(1999)、Synthesis, 11,932-933(1980)に記載の方法又は準じた方法等が挙げられる。

【 0 1 9 4 】

又、一般式 [4]、[1 7]、[1 8]、[1 9]、[2 0]、[2 1]、[2 2]、[2 3]、[2 4]、[2 5]、[2 6]、[2 9] 及び [3 1] で表される化合物は、Y がピロリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E6a, 556-798 (1994)、Y がピラゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie,E8b,399-763 (1994)もしくは特開平2000-219679号公報明細書、Y がイソチアゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8a, 668-798 (1993)、Y がオキサゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8a, 891-1019 (1993)、Y がイミダゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8c, 1-215 (1994)、Y がピリダジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9a, 557-682 (1997)、Y がピリミジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9b/1, 1-249(1998)、Y がピラジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9b/1, 250-372 (1998)、Y がトリアジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9c, 530-796(1998)、Y がトリアゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie,E8d, 305-405,479-598(1994)、Y がオキサジアゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8c, 397-818 (1994)、Y がベンゾチエニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E6b1, 217-322項(1994)、Y がインドリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie,E6b1, 546-848 (1994)、Methoden der Organischen Chemie,E6b2, 849-1336(1994)もしくは国際公開番号W097/42188号公報明細書、Y がベンゾオキサゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8a,1020-1194 (1993)、Y がベンゾイミダゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8c, 216-391 (1994)、Y がベンゾイソキサゾリル基の場合は (Methoden der Organischen Chemie, E8a,226-348 (1993))、Y がベンゾイソチアゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8a, 799-852(1993)、Y がインダゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8b, 764-864 (1994)、Y がキノリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E7a, 290-570 (1991)、Y がイソキノリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E7a, 571-758 (1991)、Y がフサラジニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9a, 744-789 (1997)、Y がキノキサリニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9b/2, 93-65 (1998)、Y がキナゾリニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9b/2, 1-192 (1998)、Y がシンノリニル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E9a, 683-7

10

20

30

40

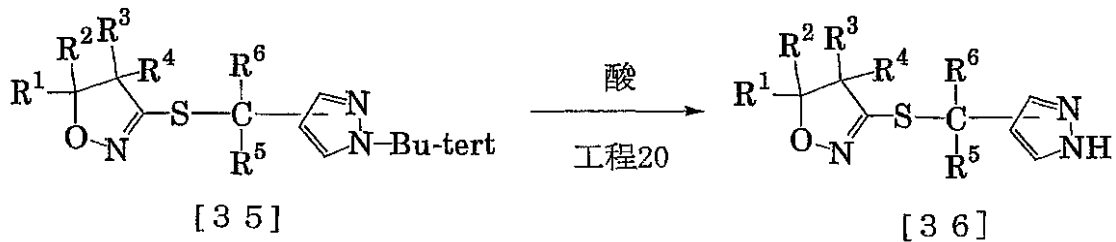
50

43 (1997)、又はYがベンゾトリアゾリル基の場合はMethoden der Organischen Chemie, E8d, 406-478 (1994) 記載の方法又は準じた方法等で製造することができる。

【0195】

<製造法2>

【化13】



10

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及び は前記と同じ意味を表す。この場合、ピラゾール環の炭素原子は、置換基群 より選択される、1~2個の同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

【0196】

(工程20)

一般式[36]で表される本発明化合物は、製造法1により製造することができる、一般式[35]で表される本発明化合物と酸とを、溶媒中で反応させることにより製造することができる。

20

【0197】

この反応は通常、反応温度0~120 で10分~24時間行う。

【0198】

反応に供される試剤の量は、一般式[35]で表される本発明化合物1当量に対して、酸1~10当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0199】

酸としては、例えば塩酸、臭化水素酸又はトリフルオロ酢酸等が挙げられる。

30

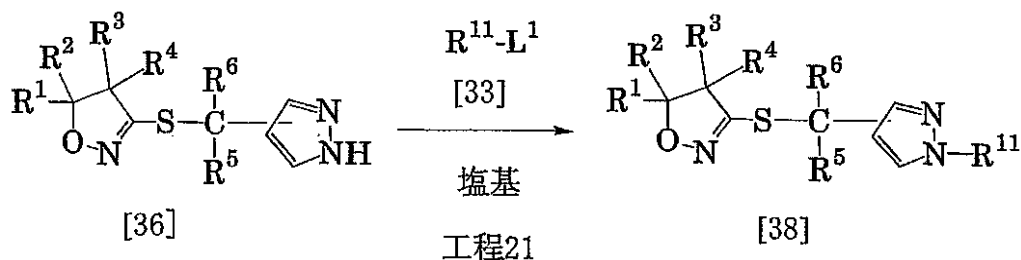
【0200】

溶媒としては、例えばジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド(DMSO)又はスルホラン等の硫黄化合物；ギ酸、酢酸等のカルボン酸類、或いは水等が挙げられる。

【0201】

<製造法3>

【化14】



40

(式中、 L^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{11} 及び は前記と同じ意味を表す。こ

50

の場合、ピラゾール環の炭素原子は、置換基群より選択される、1～2個の同一又は異なる基で置換されていてもよい。）

【0202】

(工程21)

一般式[38]で表される本発明化合物は、製造法2により製造することができる、一般式[36]で表される本発明化合物と一般式[33]で表される化合物とを溶媒中、塩基存在下で反応させることにより製造することができる。

【0203】

反応に供される試剤の量は、一般式[36]で表される化合物1当量に対して、一般式[33]で表される化合物1～3当量、塩基1～3当量である。

10

【0204】

溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類；ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)又はN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド(DMSO)又はスルホラン等の硫黄化合物；ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類；メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtert-ブタノール等のアルコール類；アセトン又は2-ブタノン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；水、或いはこれらの混合物が挙げられる。

【0205】

20

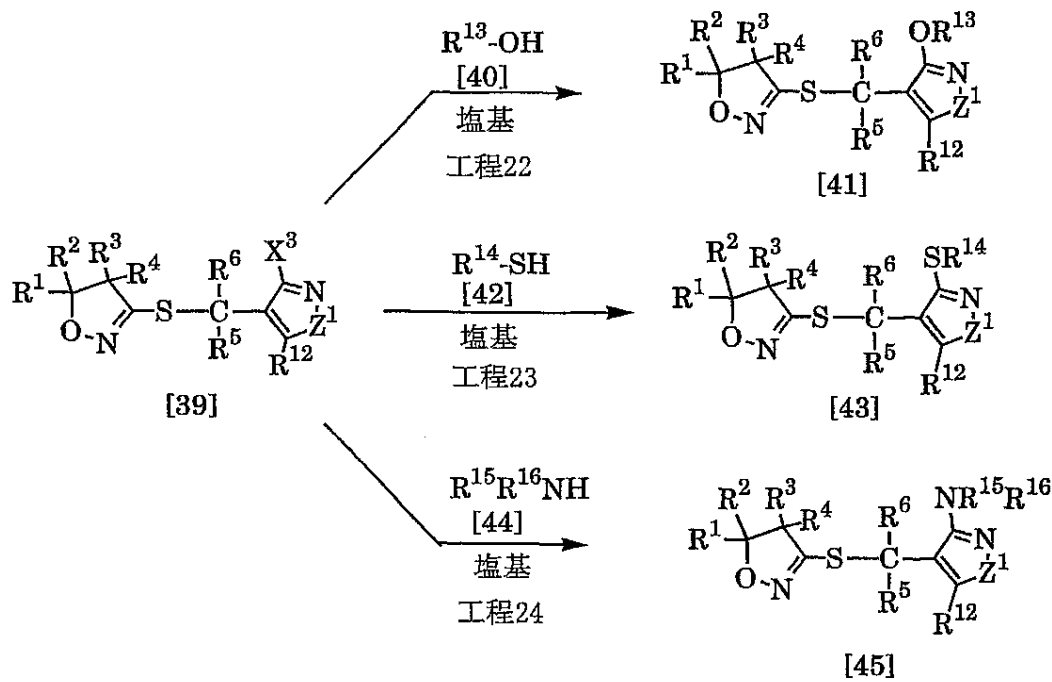
塩基としては、例えば水素化ナトリウム等の金属水素化物類；ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロピルアミド等のアルカリ金属アミド類；ピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基類；水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物類；水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物類；炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩類、或いはナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド又はカリウムtert-ブトキシド等の金属アルコキシド類が挙げられる。

【0206】

<製造法4>

30

【化 15】



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及び R^{10} は前記と同じ意味を表し、 R^{12} はトリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基又はジフルオロメトキシ基を表し、 X^3 は塩素原子又はフッ素原子を表し、 R^{13} はアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、アルコキシカルボニルアルキル基、置換されていてもよいヘテロアルキル基、又は置換されていてもよいベンジル基を表し、 R^{14} はアルキル基、ハロアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳香族ヘテロ環基、アルコキシカルボニルアルキル基又は置換されていてもよいベンジル基を表し、 R^{15} 及び R^{16} は、同一又は異なって、水素原子、アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、アルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニル基を表し、 Z^1 はイオウ原子又は $N-R^{17}$ を表し、 R^{17} は水素原子又は R^{10} を表す。)

【0207】

一般式 [41]、一般式 [43] 又は一般式 [45] で表される本発明化合物は、一般式 [39] で表される本発明化合物と、それぞれ一般式 [40] (工程22)、一般式 [42] (工程23) 又は一般式 [44] (工程24) で表される化合物を、無溶媒又は溶媒中、必要に応じ塩基存在下で反応させることにより製造することができる。

【0208】

この反応は通常、反応温度 $20 \sim 200$ 、好ましくは $30 \sim 180$ で、 10 分 ~ 48 時間、必要に応じ加圧下で行う。

【0209】

反応に供される試剤の量は、一般式 [39] で表される本発明化合物 1 当量に対して、一般式 [40]、一般式 [42] 又は一般式 [44] で表される化合物 $1 \sim 20$ 当量である。

【0210】

塩基としては、例えば炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水素化カリウム、水素化ナト

リウム等の無機塩基；ナトリウムエトキシド、ナトリウムメトキシド等のアルカリ金属アルコキシド、或いは 1, 8 - ジアザピシクロ [5 . 4 . 0] - 7 - ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

【 0 2 1 1 】

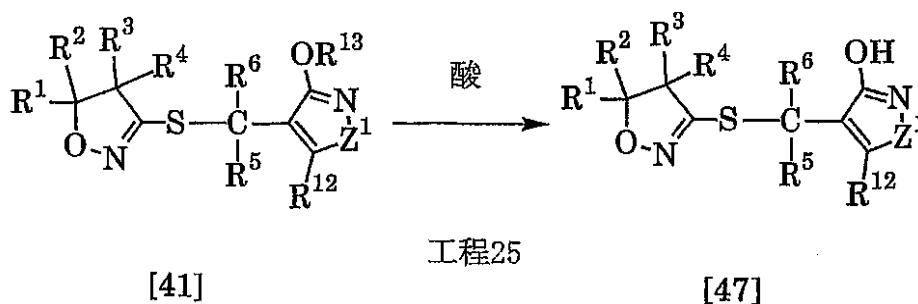
溶媒としては例えばクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類；ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類；アセトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；酢酸エチル等のエステル類；N - メチルピロリドン、N, N - ジメチルホルムアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄化合物；アセトニトリル等のニトリル類、或いはそれらの混合物が挙げられる。

10

【 0 2 1 2 】

< 製造法 5 >

【 化 1 6 】



20

(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹²、R¹³及びZ¹は前記と同じ意味を表す。)

【 0 2 1 3 】

(工程 2 5)

一般式 [4 7] で表される本発明化合物は、一般式 [4 1] で表される本発明化合物を溶媒中、酸と反応させることにより製造することができる。

30

【 0 2 1 4 】

この反応は通常、反応温度 0 ~ 1 2 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

【 0 2 1 5 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [4 1] で表される本発明化合物 1 当量に対して、酸 1 ~ 1 0 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【 0 2 1 6 】

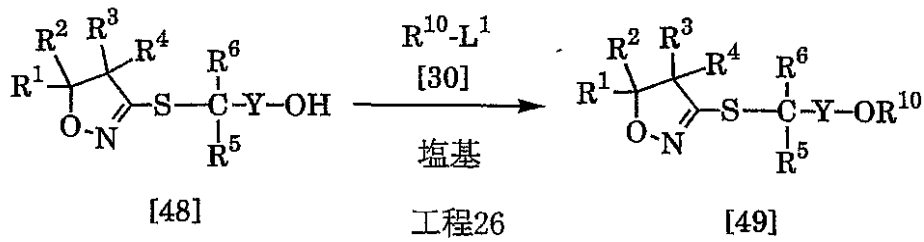
酸及び溶媒としては、製造法 2 と同様なものが挙げられる。

【 0 2 1 7 】

< 製造法 6 >

40

【化17】



10

(式中、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、L¹及びは前記と同じ意味を表す。この場合、Yは置換基群より選択される、1～5個までの同一又は相異なる基で置換されていてよい。)

【0218】

(工程26)

一般式[49]で表される本発明化合物は、一般式[48]で表される本発明化合物を溶媒中、塩基存在下で一般式[30]で表される化合物と反応させることにより製造することができる。

20

【0219】

この反応は通常、反応温度0～150で10分～24時間行う。

【0220】

反応に供される試剤の量は一般式[48]で表される本発明化合物1当量に対して、塩基1～1.2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

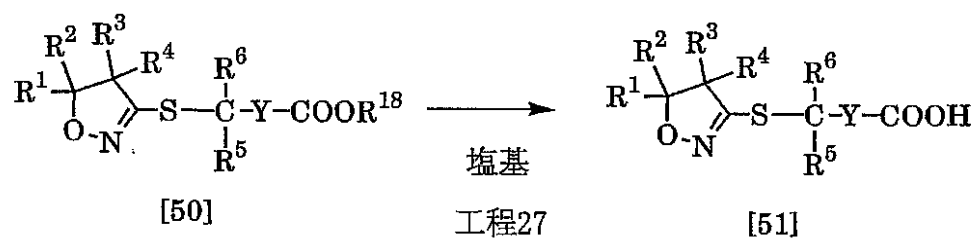
【0221】

塩基及び溶媒としては、製造法3と同様なものが挙げられる。

【0222】

<製造法7>

【化18】



30

(式中、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びは前記と同じ意味を表し、R¹⁸はアルキル基、置換されていてよいベンジル基及び置換されていてよいフェニル基を表す。この場合、Yは置換基群より選択される、1～5個までの同一又は相異なる基で置換されていてよい。)

40

【0223】

(工程27)

一般式[51]で表される本発明化合物は、一般式[50]で表される本発明化合物を、水又は水と混合した溶媒中、塩基存在下又は非存在下で加水分解することにより製造することができる。

【0224】

50

この反応は通常、反応温度 0 ~ 100 で 10 分 ~ 24 時間行う。

【0225】

反応に供される試剤の量は、一般式 [50] で表される本発明化合物 1 当量に対して、塩基を使用する場合 1 ~ 2 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0226】

塩基としては、例えば炭酸カリウム、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基、1, 8 - ジアザビシクロ [5.4.0] - 7 - ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

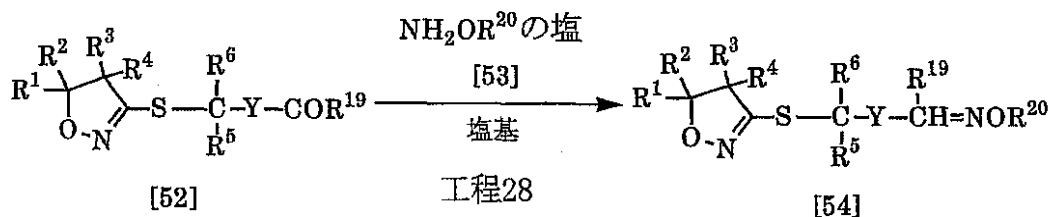
【0227】

水と混合する溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類；テトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；N, N - ジメチルホルムアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄化合物；アセトニトリル等のニトリル類、或いはそれらの混合物が挙げられる。

【0228】

< 製造法 8 >

【化 19】



(式中、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びは前記と同じ意味を表し、R¹⁹は水素原子又はアルキル基を表す。R²⁰はアルキル基を表す。この場合、Yは置換基群より選択される、1 ~ 5 個までの同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

【0229】

(工程 28)

一般式 [54] で表される本発明化合物は、一般式 [52] で表される本発明化合物を溶媒中、塩基存在下で、一般式 [53] で表される化合物と反応することにより製造することができる。

【0230】

この反応は通常、反応温度 0 ~ 100 で 10 分 ~ 24 時間行う。

【0231】

反応に供される試剤の量は、一般式 [52] で表される本発明化合物 1 当量に対して、一般式 [53] で表される化合物 1 ~ 5 当量、塩基 1 ~ 10 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0232】

塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の金属炭酸塩類；酢酸カリウム、酢酸ナトリウム等の金属酢酸塩類、或いはトリエチルアミン、ジメチルアミン、1, 8 - ジアザビシクロ [5.4.0] - 7 - ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。

【0233】

NH₂OR²⁰の塩としては、NH₂OR²⁰の塩酸塩又はNH₂OR²⁰の硫酸塩等が挙げられる。

【0234】

溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類；テトラヒドロフラン等のエーテル類；N, N - ジメチルホルムアミド等のアミド類、水或いはそれらの混合物が挙げられる。

10

20

30

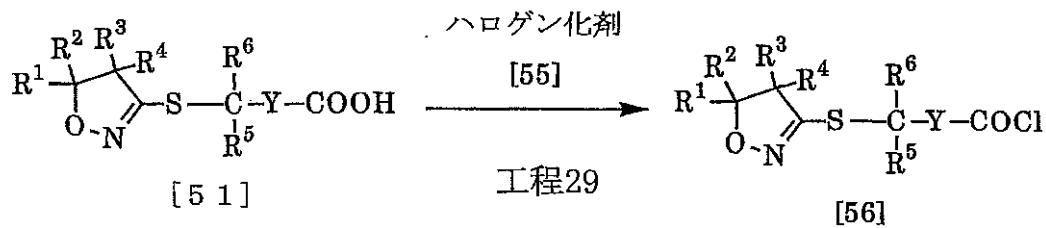
40

50

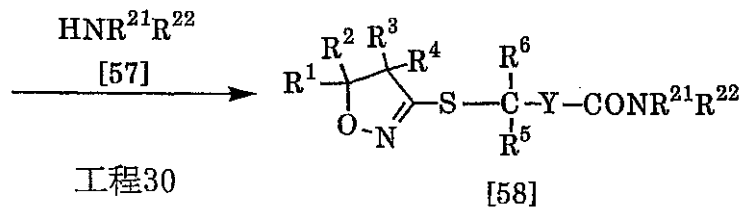
【 0 2 3 5 】

< 製造法 9 >

【 化 2 0 】



10



20

(式中、Y、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 及び は前記と同じ意味を表し、R²¹及び R²²は水素原子又はアルキル基を表す。この場合、Yは置換基群 より選択される、1～5個までの同一又は相異なる基で置換されているもよい。)

【 0 2 3 6 】

(工程 2 9、3 0)

一般式 [5 8] で表される本発明化合物は、一般式 [5 1] で表される本発明化合物を溶媒中又は無溶媒中、ハロゲン化剤と反応させて一般式 [5 6] で表される本発明化合物を製造した後 (工程 2 9)、一般式 [5 6] で表される本発明化合物を溶媒中又は無溶媒中、一般式 [5 7] で表される化合物と反応させることにより (工程 3 0)、製造することができる。

30

【 0 2 3 7 】

工程 2 9 の反応は、通常、反応温度 0 ~ 1 0 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

【 0 2 3 8 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [5 1] で表される本発明化合物 1 当量に対して、ハロゲン化剤 1 ~ 1 0 0 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【 0 2 3 9 】

ハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、オキサリルクロリド等が挙げられる。

【 0 2 4 0 】

溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、或いはベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類が挙げられる。

40

【 0 2 4 1 】

工程 3 0 の反応は、通常、反応温度 0 ~ 1 0 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

【 0 2 4 2 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [5 6] で表される本発明化合物 1 当量に対して、一般式 [5 7] で表される化合物 2 ~ 1 0 0 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【 0 2 4 3 】

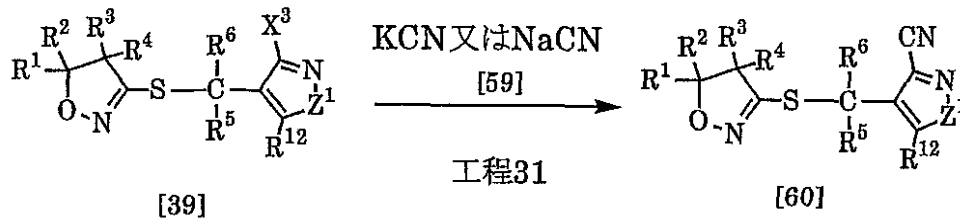
溶媒としては、例えば工程 2 9 の反応と同様なものが挙げられる。

50

【 0 2 4 4 】

< 製造法 1 0 >

【 化 2 1 】



10

(式中、 Z^1 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^{12} 及び X^3 は前記と同じ意味を表す。)

【 0 2 4 5 】

一般式 [6 0] で表される本発明化合物は、一般式 [3 9] で表される本発明化合物を溶媒中、化合物 [5 9] で表される化合物と反応させることにより製造することができる。

【 0 2 4 6 】

この反応は通常、反応温度 0 ~ 1 0 0 で 1 0 分 ~ 2 4 時間行う。

20

【 0 2 4 7 】

反応に供される試剤の量は、一般式 [3 9] で表される本発明化合物 1 当量に対して、化合物 [5 9] で表される化合物 1 ~ 2 当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【 0 2 4 8 】

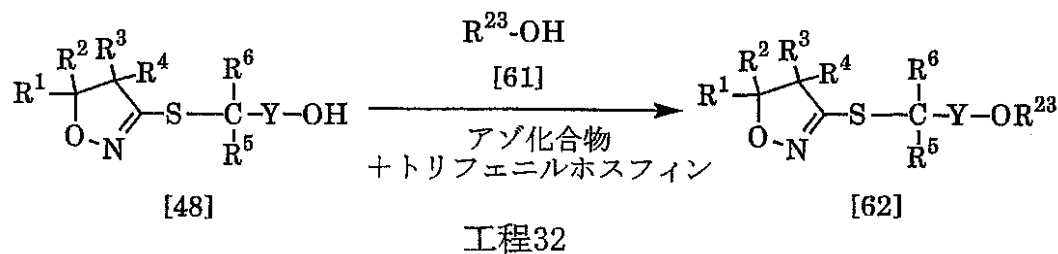
溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類；ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；N，N - ジメチルアセトアミド、N，N - ジメチルホルムアミド又はN - メチル - 2 - ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物；アセトン又は2 - ブタノン等のケトン類；アセトニトリル等のニトリル類；水、或いはこれらの混合物が挙げられる。

30

【 0 2 4 9 】

< 製造法 1 1 >

【 化 2 2 】



40

(式中、 Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及び R^{23} は前記と同じ意味を表し、 R^{23} はアルキル基、ハロアルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシカルボニルアルキル基、置換されていてもよいヘテロアルキル基、又は置換されていてもよいベンジル基を表す。この場合、 Y は置換基群より選択される、1 ~ 5 個までの同一又は相異なる基で置換されていてもよい。)

【 0 2 5 0 】

50

(工程32)

一般式[62]で表される本発明化合物は、一般式[48]で表される本発明化合物を溶媒中、アゾ化合物及びトリフェニルホスフィンの存在下、一般式[61]で表される化合物と反応させる、公知の方法(Synthesis, 1981, 1-28)に準じて製造することができる。

【0251】

この反応は通常、反応温度0～100 で10分～24時間行う。

【0252】

反応に供される試剤の量は、一般式[48]で表される本発明化合物1当量に対して、一般式[61]で表される化合物1～1.5当量、アゾ化合物1～1.5当量、トリフェニルホスフィン1～1.5当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

10

【0253】

溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類；ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；N, N - ジメチルアセトアミド、N, N - ジメチルホルムアミド又はN - メチル - 2 - ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物；ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類；アセトニトリル等のニトリル類、或いはこれらの混合物等が挙げられる。

【0254】

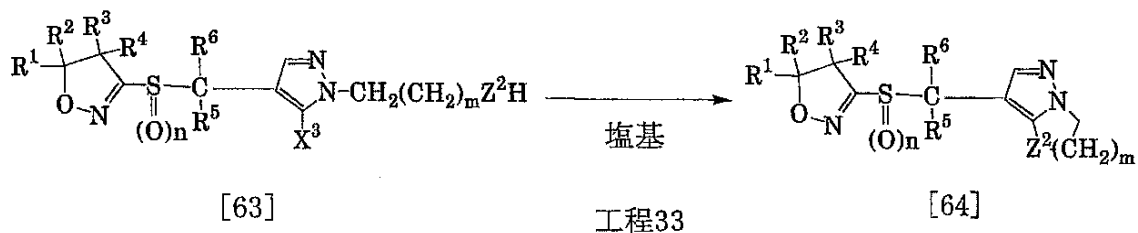
アゾ化合物としては、例えばアゾジカルボン酸ジエチル又はアゾジカルボン酸ジイソプロピル等が挙げられる。

20

【0255】

<製造法12>

【化23】



30

(式中、X³、n、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰及び は前記と同じ意味を表し、Z²は酸素原子、硫黄原子又はN - R¹⁷を表し、R¹⁷は水素原子又はR¹⁰を表し、mは1～4の整数を表す。この場合、ピラゾール環の3位の炭素原子は、置換基群より選択される基で置換されていてもよい。)

【0256】

(工程33)

一般式[64]で表される本発明化合物は、一般式[63]で表される本発明化合物を溶媒中、塩基存在下で反応させることにより製造することができる。

40

【0257】

この反応は通常、反応温度0～120 で10分～24時間行う。

【0258】

反応に供される試剤の量は、一般式[63]で表される本発明化合物1当量に対して、塩基1～3当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0259】

塩基及び溶媒としては、製造法3と同様なものが挙げられる。

50

【0260】

次に、実施例をあげて本発明化合物の製造法、製剤法及び用途を具体的に説明する。尚、本発明化合物の製造中間体の製造法も併せて記載する。

【0261】

<実施例1>

3-(5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-クロロメチル-5-メチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号1)の製造

5-クロロメチル-5-メチル-3-メチルスルホニル-2-イソキサゾリン2.1g(10.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド20ml溶液に、水酸化ナトリウム水和物1.2g(純度70%、15.0ミリモル)を加え2時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム2.1g(15.0ミリモル)、ロンガリット2.3g(15.0ミリモル)及び4-プロモメチル-5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール2.8g(10.0ミリモル)を加え、さらに室温で2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、3-(5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-クロロメチル-5-メチル-2-イソキサゾリン3.3g(収率100.0%)を得た。

【0262】

<実施例2>

3-(5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-クロロメチル-5-メチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号2)の製造

3-(5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-クロロメチル-5-メチル-2-イソキサゾリン3.3g(10.0ミリモル)のクロロホルム20ml溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸(70%)4.3g(25.0ミリモル)を加え、室温で20時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点114~116)の3-(5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-クロロメチル-5-メチル-2-イソキサゾリン2.8g(収率76.0%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$: (CDCl_3/TMS , (ppm)): 4.63(2H,s), 3.96(3H,s), 3.62(2H,q), 3.32(2H, ABq, $J=13.4$, $\nu=164.1\text{Hz}$), 1.63(3H,s)

【0263】

<実施例3>

3-(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-クロロメチル-5-メチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号3)の製造

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタンチオール24.2g(70.9ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド20ml溶液に、無水炭酸カリウム11.8g(85.0ミリモル)及び5-クロロメチル-5-メチル-3-メチルスルホニル-2-イソキサゾリン2.1g(10.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド20ml溶液を加え一夜攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過後溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、無色粘稠性液体($n_D^{20}=1.5051$)の3-(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチル

チオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 23 . 1 g (収率 80 . 5%) を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS}, (\text{ppm}))$: 4.24(2H,s), 3.55(2H,q), 3.02(2H,ABq, $J=16.7$, $\tau=11$ 0.5Hz), 1.71(9H,s), 1.57(3H,s)

【0264】

<実施例4>

3 - (5 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号4) の製造

25%臭化水素酸酢酸溶液100mlに3 - (1 - tert - ブチル - 5 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 22 . 0 g (54 . 4ミリモル)を加え、室温で2時間攪拌し、さらに40 で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過後、溶媒を減圧留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、乳白色粉末 (融点105 ~ 107) の3 - (5 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 17 . 7 g (収率93 . 7%) を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS}, (\text{ppm}))$: 4.26(2H,s), 3.56(2H,q), 3.03(2H,ABq, $J=16.7$, $\tau=11$ 1.8Hz), 1.56(3H,s)

【0265】

<実施例5>

3 - (1 - エチル - 5 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号5) 及び3 - (1 - エチル - 3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号6) の製造

3 - (5 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 1 . 5 g (4 . 3ミリモル)のN, N - ジメチルホルムアミド溶液25mlに、無水炭酸カリウム0 . 6 g (4 . 3ミリモル)及びヨウ化エチル0 . 74 g (4 . 7ミリモル)を加え、室温で5時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層をクエン酸水溶液、飽和食塩水で洗浄した。得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、溶媒を減圧留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、3 - (1 - エチル - 5 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 0 . 91 g (収率56 . 0%)、3 - (1 - エチル - 3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 0 . 45 g (収率28 . 0%) を得た。

【0266】

<実施例6>

3 - (1 - エチル - 5 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルスルホニル) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号7) の製造

3 - (1 - エチル - 5 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 0 . 91 g (2 . 4ミリモル)のクロロホルム40ml溶液に、氷冷下、m - クロロ過安息香酸 (70%) 1 . 31 g (5 . 3ミリモル)を加え、室温で20時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウム

10

20

30

40

50

で乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した結晶をジイソプロピルエーテルで洗浄し、白色粉末（融点 123 ~ 124 °C）の 3 - (1 - エチル - 5 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルスルホニル) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 0.81 g (収率 82.0%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , (ppm)): 4.64(2H, s), 4.29(2H, q), 3.62(2H, q), 3.30(2H, ABq, $J=17.8$, $\nu=125.6\text{Hz}$), 1.55 ~ 1.50(6H, m)

【0267】

<実施例 7>

3 - (4 - エトキシ - 6 - トリフルオロメチルピリミジン - 5 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 8) の製造
 3 - メチルスルホニル - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 4.6 g (21.6 ミリモル) の DMF 70 ml 溶液に、水酸化ナトリウム水和物 3.4 g (純度 70%、42.3 ミリモル) を加え 2 時間攪拌した。その後、炭酸カリウム 3.0 g (21.6 ミリモル)、ロンガリット 3.3 g (21.6 ミリモル) 及び 5 - プロモメチル - 4 - エトキシ - 6 - トリフルオロメチルピリミジンを加え、さらに室温で 21 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶媒系ヘキサン - 酢酸エチル) で精製し、3 - (4 - エトキシ - 6 - トリフルオロメチルピリミジン - 5 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 1.9 g (収率 30.3%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , (ppm)): 8.78(1H, s), 4.57(2H, q), 4.45(2H, s), 3.57(2H, q), 3.03(2H, ABq, $J=16.8$, $\nu=114.3\text{Hz}$), 1.58(3H, s), 1.45(3H, t)

【0268】

<実施例 8>

3 - (4 - エトキシ - 6 - トリフルオロメチルピリミジン - 5 - イルメチルスルホニル) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 9) の製造

3 - (4 - エトキシ - 6 - トリフルオロメチルピリミジン - 5 - イルメチルチオ) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 1.9 g (5.1 ミリモル) のクロロホルム 30 ml 溶液に、氷冷下、m - クロロ過安息香酸 (70%) 3.2 g (12.9 ミリモル) を加え、室温にて 5 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色結晶（融点 76.0 ~ 78.0 °C）の 3 - (4 - エトキシ - 6 - トリフルオロメチルピリミジン - 5 - イルメチルスルホニル) - 5 - クロロメチル - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 1.8 g (収率 87.7%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , (ppm)): 8.87(1H, s), 5.03(2H, s), 4.59(2H, q), 3.64(2H, q), 3.33(2H, ABq, $J=17.7$, $\nu=125.9\text{Hz}$), 1.64(3H, s), 1.46(3H, t)

【0269】

<実施例 9>

5 - クロロメチル - 3 - (1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 10) の製造

5 - クロロメチル - 5 - メチル - 3 - メチルスルホニル - 2 - イソオキサゾリン 9.1 g (42.9 ミリモル) の N, N - ジメチルホルムアミド 50 ml 溶液中に、室温にて水酸化ナトリウム水和物 6.9 g (純度 70%、85.8 ミリモル) を加え 2 時間攪拌した。その後、無水炭酸カリウム 5.9 g (42.9 ミリモル)、ロンガリット 6.6 g (42.9 ミリモル) 及び参考例 20 にて製造した 4 - プロモメチル - 1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールの粗生成物 (42.9 ミリモル相当

)を加え、さらに室温にて30分攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-フルオロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン10.3g(収率66.9%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 4.15~4.08(4H,m), 3.54(2H,q), 3.01(2H, ABq, J=16.7, =110.8Hz), 1.55(3H,s), 1.47(3H,t)

【0270】

<実施例10>

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-フルオロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-メチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号11)の製造

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-フルオロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン0.72g(2.0ミリモル)のクロロホルム10ml溶液中に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.23g(純度70%、5.0ミリモル)を加え、さらに室温にて20時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点73~75)の5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-フルオロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-メチル-2-イソオキサゾリン0.64g(収率82.1%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 4.56(2H,s), 4.17(2H,q), 3.61(2H,q), 3.31(2H, ABq, J=17.8, =123.6Hz), 1.58(3H,s), 1.50(3H,t)

【0271】

<実施例11>

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号12)の製造

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-フルオロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン5.4g(15.0ミリモル)のメタノール30ml溶液中に、室温にてナトリウムメトキシド4.3g(28%メタノール溶液、22.5ミリモル)を加え、さらに8時間加熱環流した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン3.3g(収率59.1%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 4.26(2H,s), 4.06(5H,m), 3.55(2H, q), 3.02(2H, ABq, J=16.9, =110.5Hz), 1.56(3H,s), 1.41(3H,t)

【0272】

<実施例12>

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-メチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号13)の製造

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン0.74g(2.0ミリモル)のクロロホルム10ml溶液中に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.24g(純度70%、5.0ミリモル)を加え、さらに室温にて20時間攪拌した。反応

10

20

30

40

50

終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点139~140)の5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-メチル-2-イソキサゾリン0.72(収率89.2%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 4.60(2H,s), 4.13~4.06(5H,m), 3.30(2H, ABq, J=17.8, =122.8Hz), 1.58(3H,s), 1.46(3H,t)

【0273】

<実施例13>

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メチルチオ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号14)の製造

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-フルオロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソキサゾリン1.08g(3.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10ml溶液中に、室温にてメチルメルカプタンナトリウム4.21g(15%水溶液、9.0ミリモル)を加え、さらに室温にて一夜攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メチルチオ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソキサゾリンの粗生成物を得た。

【0274】

<実施例14>

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メチルスルホニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-メチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号15)の製造

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メチルチオ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソキサゾリンの粗生成物(3.0ミリモル相当)のクロロホルム30ml溶液中に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸3.74g(純度70%、15.0ミリモル)を加え、さらに室温にて20時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点113~114)の5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メチルスルホニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-メチル-2-イソキサゾリン1.15(収率84.8%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 5.08(2H,bR), 4.60(2H,q), 3.64(2H,q), 3.41(3H,s), 3.36(2H, ABq, J=17.5, =163.1Hz), 1.65(3H,s), 1.60(3H,t)

【0275】

<実施例15>

5-クロロメチル-3-(5-シアノ-1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソキサゾリン(本発明化合物番号16)の製造

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-フルオロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソキサゾリン1.08g(3.0ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10ml溶液中に、室温にてシアン化ナトリウム0.30g(6.0ミリモル)を加え、さらに50℃にて10時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩

10

20

30

40

50

水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し5-クロロメチル-3-(5-シアノ-1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン1.10g(収率:定量的)を得た。

【0276】

<実施例16>

5-クロロメチル-3-(5-シアノ-1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-メチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号17)の製造

5-クロロメチル-3-(5-シアノ-1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン1.10g(3.0ミリモル)のクロロホルム20ml溶液中に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.85g(純度70%、7.5ミリモル)を加え、さらに室温にて20時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点76~78)の5-クロロメチル-3-(5-シアノ-1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5-メチル-2-イソオキサゾリン1.15(収率84.8%)を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 4.73(2H,s), 4.45(2H,q), 3.63(2H,q), 3.35(2H, ABq, J=17.6, =129.6Hz), 1.59~1.46(6H,m)

【0277】

<実施例17>

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-ヒドロキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号18)の製造

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン2.5g(6.7ミリモル)のジクロロメタン30ml溶液中に、-60にて三臭化ホウ素10ml(2モル/lジクロロメタン溶液、20.2ミリモル)を加え、さらに室温にて一夜攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-ヒドロキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン1.6g(収率66.7%)を得た。

【0278】

<実施例18>

5-クロロメチル-3-(5-エトキシ-1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号19)の製造

5-クロロメチル-3-(1-エチル-5-ヒドロキシ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン1.6g(4.5ミリモル)のテトラヒドロフラン20ml溶液中に、室温にてエタノール0.3g(5.4ミリモル)及びトリフェニルホスフィン1.4g(5.4ミリモル)を加えた。さらに氷冷下、反応溶液中にアゾジカルボン酸ジイソプロピル1.1g(5.4ミリモル)を加え1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し5-クロロメチル-3-(5-エトキシ-1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5-メチル-2-イソオキサゾリン1.5g(収率86.8%)を

得た。

【0279】

<実施例19>

5 - クロロメチル - 3 - (5 - エトキシ - 1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルスルホニル) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 20) の製造

5 - クロロメチル - 3 - (5 - エトキシ - 1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 1.5 g (3.9 ミリモル) のクロロホルム 10 ml 溶液中に、氷冷下、m - クロロ過安息香酸 2.4 g (純度 70%、9.7 ミリモル) を加え、さらに室温にて 20 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をジイソプロピルエーテルで洗浄し、白色粉末 (融点 67 ~ 69) の 5 - クロロメチル - 3 - (5 - エトキシ - 1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルスルホニル) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 0.71 g (収率 43.8%) を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 4.58(2H,s), 4.32(2H,q), 4.09(2H,q), 3.61(2H,q), 3.28(2H, ABq, J=17.8, =121.7Hz), 1.62(3H,s), 1.48 ~ 1.43(6H,m)

【0280】

<実施例20>

5 - クロロメチル - 3 - (5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 21) の製造

5 - クロロメチル - 5 - メチル - 3 - メチルスルホニル - 2 - イソオキサゾリン 8.5 g (40.0 ミリモル) の N, N - ジメチルホルムアミド 40 ml 溶液中に、室温にて水酸化ナトリウム水和物 6.4 g (純度 70%、80.0 ミリモル) を加え 1 時間攪拌した。その後、氷冷下にて無水炭酸カリウム 6.6 g (48.0 ミリモル)、ロンガリット 7.4 g (48.0 ミリモル) 及び 4 - プロモメチル - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール 10.4 g (40.0 ミリモル) を加え、さらに氷冷下にて 30 分攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、淡黄色粘稠性液体 (屈折率 : $n_D^{20} = 1.4974$) の 5 - クロロメチル - 3 - (5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 11.8 g (収率 85.5%) を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 4.15(2H,s), 3.80(3H,s), 3.54(2H,q), 3.01(2H, ABq, J=16.8, =147.8Hz), 1.53(3H,s)

【0281】

<実施例21>

5 - クロロメチル - 3 - (5 - メトキシ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 22) の製造

5 - クロロメチル - 3 - (5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 1.0 g (2.9 ミリモル) のメタノール 10 ml 溶液中に、室温にてナトリウムメトキシド 0.9 g (28% メタノール溶液、4.4 ミリモル) を加え、さらに 5 時間加熱環流した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し 5 - クロロメチル - 3 - (5 - メトキシ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル

10

20

30

40

50

- 2 - イソオキサゾリン 3 . 3 g (収率 : 定量的) を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 4.26(2H,s), 4.06(3H,s), 3.72(3H,s), 3.55(2H,q), 3.02(2H, ABq, J=16.7, =111.0Hz), 1.56(3H,s)

【 0 2 8 2 】

< 実施例 2 2 >

5 - クロロメチル - 3 - (5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 2 3) の製造

5 - クロロメチル - 3 - (5 - メトキシ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 10 . 0 g (2 8 . 0 ミリモル) のジクロロメタン 3 0 m l 溶液中に、0 にて三臭化ホウ素 2 8 . 0 m l (2 モル / l ジクロロメタン溶液、5 5 . 9 ミリモル) を加え、さらに室温にて 3 0 分間攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶を n - ヘキサンで洗浄し、淡桃色粉末 (融点 1 1 1 ~ 1 1 2) の 5 - クロロメチル - 3 - (5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 8 . 4 g (収率 8 7 . 2 %) を得た。

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 4.01(2H,s), 3.69(3H,s), 3.55(2H,q), 3.09(2H, ABq, J=17.0, =114.4Hz), 1.56(3H,s)

【 0 2 8 3 】

< 実施例 2 3 >

5 - クロロメチル - 3 - (1 - メチル - 5 - i s o - プロポキシ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 2 4) の製造

5 - クロロメチル - 3 - (5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 1 . 0 g (2 . 9 ミリモル) の N , N - ジメチルホルムアミド 1 0 m l 溶液中に、室温にて無水炭酸カリウム 0 . 5 g (3 . 5 ミリモル) を加えた。さらに、室温にて反応溶液中にヨウ化イソプロピル 0 . 6 g (3 . 5 ミリモル) を加え 3 0 分間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し 5 - クロロメチル - 3 - (1 - メチル - 5 - i s o - プロポキシ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 0 . 5 g (収率 4 5 . 0 %) を得た。

【 0 2 8 4 】

< 実施例 2 4 >

5 - クロロメチル - 3 - (1 - メチル - 5 - i s o - プロポキシ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルスルホニル) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 2 5) の製造

5 - クロロメチル - 3 - (1 - メチル - 5 - i s o - プロポキシ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルチオ) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 0 . 5 g (1 . 2 ミリモル) のクロロホルム 1 0 m l 溶液中に、氷冷下、m - クロロ過安息香酸 0 . 6 5 g (純度 7 0 % 、 2 . 6 4 ミリモル) を加え、さらに室温にて 2 0 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結晶をジイソプロピルエーテルで洗浄し、淡黄色粘稠性液体の 5 - クロロメチル - 3 - (1 - メチル - 5 - i s o - プロポキシ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルスルホニル) - 5 - メチル - 2 - イソオキサゾリン 0 . 4 9 g (収率 9 0 . 0 %) を得た

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , (ppm)): 4.64(1H,m), 4.51(2H,s), 3.76(3H,s), 3.61(2H,q), 3.24(2H, ABq, $J=17.8$, $\nu=116.9\text{Hz}$), 1.61(3H,s), 1.40(6H,d)

【 0 2 8 5 】

実施例 1 - 2 4 の方法に準じて製造した化合物を表 5 8 ~ 6 0 に示す。

【 0 2 8 6 】

【 表 5 8 】

化合物番号	構造式	融点(°C) 又は 屈折率(n_D^{20})
26		111-112
27		130-132
28		122-124
29		122-123
30		155-156
31		117-118
32		137-138
33		114-116
34		125-126
35		77-78

10

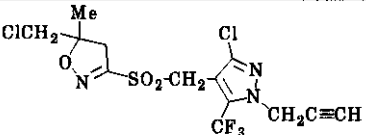
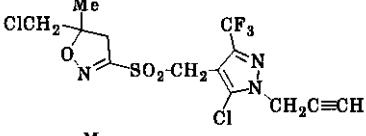
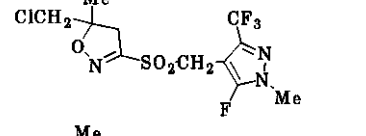
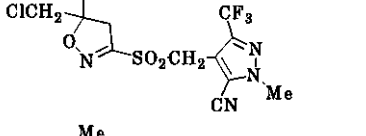
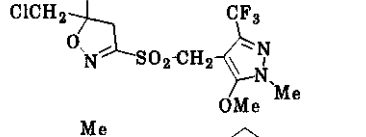
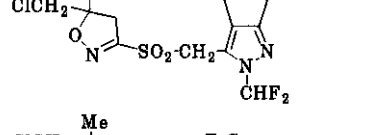
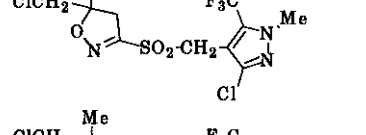
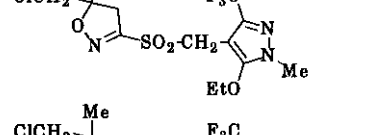
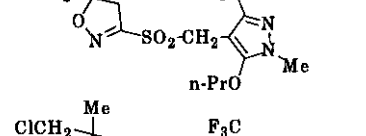
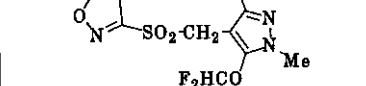
20

30

40

【 0 2 8 7 】

【表 5 9】

化合物番号	構造式	融点(°C) 又は 屈折率(n_D^{20})
36		114-115
37		125-126
38		1.4828
39		77-79
40		139-140
41		101-103
42		123-124
43		106-107
44		測定不可
45		測定不可

10

20

30

40

【 0 2 8 8 】

【表 6 0】

化合物番号	構造式	融点(°C) 又は 屈折率(n _D ²⁰)
46		測定不可
47		88-90
48		80-81
49		1.5006

10

【 0 2 8 9 】

20

(中間体の製造例)

< 参考例 1 >

1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - オールの製造

トリフルオロアセト酢酸エチルエステル 92.1 g (0.5 モル) のエタノール 500 ml 溶液にモノメチルヒドラジン 23.0 g (0.5 モル) 及び濃塩酸 5 ml を加えた後、2 日間加熱還流した。反応終了後、溶媒の大部分を減圧留去し、残渣を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣を n - ヘキサンで洗浄し、白色粉末の 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - オール 60.0 g (収率 72.2%) を得た。

30

【 0 2 9 0 】

< 参考例 2 >

5 - クロロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒドの製造

N, N - ジメチルホルムアミド 60.0 g (0.76 モル) に、氷冷下、オキシ塩化リン 360 g (2.31 モル) を加えた。次に、室温で 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - オール 64.0 g (0.385 モル) を加えた後、1 時間加熱還流した。反応終了後、氷冷下、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン - 酢酸エチル混合溶媒) で精製し、白色結晶の 5 - クロロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒド 60.4 g (収率 73.4%) を得た。

40

¹H-NMR(CDCl₃/TMS, (ppm)): 9.96(1H,d), 3.96(3H,s)

【 0 2 9 1 】

< 参考例 3 >

5 - クロロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル - メタノールの製造

5 - クロロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒド 10.0 g (47.0 ミリモル) のメタノール 100 ml 溶液を 0 °C に冷却し、

50

水素化ホウ素ナトリウム 2.1 g (56.5 ミリモル) を徐々に加えた。さらに室温で 2 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、(5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール 8.3 g (収率 82.2%) を得た。

【0292】

<参考例 4>

4-プロモメチル-5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

(5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール 8.3 g (38.7 ミリモル) のジエチルエーテル 100 ml 溶液を -10 に冷却し、三臭化リン 12.6 g (46.4 ミリモル) を加えた。さらに室温で 1 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、4-プロモメチル-5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール 10.7 g (収率 99.9%) を得た。

10

【0293】

<参考例 5>

1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オールの製造

トリフルオロアセト酢酸エチルエステル 552.3 g (3.0 モル) のエタノール 1500 ml 溶液に tert-ブチルヒドラジン塩酸塩 373.8 g (3.0 モル) 及び濃塩酸 50 ml を加えた後、2 日間加熱還流した。反応終了後、溶媒の大部分を減圧留去し、残渣を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣を n-ヘキサンで洗浄し、白色粉末の 1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール 369.0 g (収率 59.1%) を得た。

20

【0294】

<参考例 6>

1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒドの製造

N,N-ジメチルホルムアミド 87.7 g (1.2 モル) に、氷冷下、オキシ塩化リン 462.0 g (3.0 モル) を加えた。次に、室温で 1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール 208.2 g (1.0 モル) を加えた後、10 時間加熱還流した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を水、5% 水酸化ナトリウム水溶液及び水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ- (溶出溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル混合溶媒) で精製し、白色結晶の 1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド 131.5 g (収率 21.7%) を得た。

30

40

¹H-NMR: (CDCl₃/TMS, (ppm)): 9.97(1H,d), 1.76(9H,s)

【0295】

<参考例 7>

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノールの製造

1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド 39.9 g (156.9 ミリモル) のメタノール 300 ml 溶液を 0 に冷却し、水素化ホウ素ナトリウム 6.5 g (172.6 ミリモル) を徐々に加えた。さらに室温で 3 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去

50

し、(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール37.7g(収率93.6%)を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS}, (\text{ppm}))$: 4.60(2H,d), 1.72(9H,s), 1.58(1H,t)

【0296】

<参考例8>

4-プロモメチル-1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの製造

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタノール9.2g(35.7ミリモル)のジエチルエーテル100ml溶液を-10に冷却し、三臭化リン11.6g(42.9ミリモル)を加えた。さらに室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、4-プロモメチル-1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール10.0g(収率87.3%)を得た。

10

【0297】

<参考例9>

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタンチオールの製造

水硫化ナトリウム水和物21.8g(純度70%、272.2ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド300mlに4-プロモメチル-1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール43.5g(136.1ミリモル)を加えた。さらに室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル)-メタンチオール32.3g(収率87.0%)を得た。

20

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS}, (\text{ppm}))$: 3.65(2H,d), 1.90(1H,t), 1.70(9H,s)

【0298】

<参考例10>

5-プロモ-4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造

4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン49.2g(300.0ミリモル)の酢酸600ml溶液に、室温で無水酢酸ナトリウム77.5g(945.0ミリモル)を加えた。さらに45で反応溶液中に臭素50.3g(315ミリモル)を徐々に加え、同温度で3時間攪拌した。反応終了確認後、溶媒を減圧留去し、残渣を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をn-ヘキサンで洗浄し5-プロモ-4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン38.9g(収率53.4%)を得た。

30

【0299】

<参考例11>

5-プロモ-4-クロロ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造

5-プロモ-4-ヒドロキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン24.3g(100.0ミリモル)をオキシ塩化リン18.5g(120.0ミリモル)に懸濁させ、100で2時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を徐々に水にあげクロロホルムで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、5-プロモ-4-クロロ-6-トリフルオロメチルピリミジン21.5g(収率82.4%)を得た。

40

【0300】

<参考例12>

5-プロモ-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造

5-プロモ-4-クロロ-6-トリフルオロメチルピリミジン3.00g(11.48ミリモル)のエタノール50ml溶液に、室温でナトリウムエトキシド0.94g(13.5

50

77ミリモル)を加え攪拌した。反応終了確認後、溶媒を減圧留去した。残渣を水にあげ、クロロホルムで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し5-プロモ-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン2.44g(収率82.9%)を得た。

【0301】

<参考例13>

4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒドの製造
5-プロモ-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン5.76g(21.3ミリモル)のテトラヒドロフラン250ml溶液を-78に冷却し、n-ブチルリチウム-ヘキサン1.6M溶液22.6ml(36.1ミリモル)を滴下し、40分間攪拌した。ギ酸メチル2.7g(45.1ミリモル)を加え、さらに1.5時間攪拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加え、エーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒド3.82g(収率81.6%)を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS}, (\text{ppm}))$: 10.41(1H,s), 8.95(1H,s), 4.63(2H,q), 1.48(3H,t)

【0302】

<参考例14>

(4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メタノールの製造
水素化ほう素ナトリウム1.7g(45.7ミリモル)のメタノール50ml溶液に、氷冷下、4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-カルボアルデヒド3.82g(17.2ミリモル)のメタノール50ml溶液を加えた。0で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、(4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メタノール3.77g(収率97.8%)を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS}, (\text{ppm}))$: 8.80(1H,s), 4.81(2H,s), 4.59(2H,q), 2.28(1H,bR), 1.48(3H,t)

【0303】

<参考例15>

5-プロモメチル-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンの製造
(4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル)-メタノール3.77g(17.0ミリモル)のエーテル50ml溶液を0に冷却し、三臭化リン2.0g(7.2ミリモル)を加えた。室温で1時間攪拌した。生じた塩をメタノールで溶解し、さらに1時間攪拌した。反応溶液を水中に注ぎエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、5-プロモメチル-4-エトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジンをクルードで得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS}, (\text{ppm}))$: 8.79(1H,s), 4.61(2H,q), 4.55(2H,s), 1.49(3H,t)

【0304】

<参考例16>

1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オールの製造
トリフルオロアセト酢酸エチルエステル55.2g(300.0ミリモル)のエタノール300ml溶液中にモノエチルヒドラジン18.0g(300.0ミリモル)及び濃塩酸5mlを加えた後、2日間加熱還流した。反応終了後、減圧下溶媒を大部分留去し、残渣を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をn-ヘキサンにて洗浄し、白色粉末の1-エチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-5-オール35.5g(収率65.7%)を得た。

【0305】

<参考例17>

5 - クロロ - 1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒドの製造

N, N - ジメチルホルムアミド 18.0 g (246.3ミリモル)に、氷冷下、オキシ塩化リン 91.1 g (591.2ミリモル)を加えた。次に、室温にて1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - オール 35.5 g (197.1ミリモル)を加えた後、3時間加熱還流した。反応終了後、氷冷下、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、5 - クロロ - 1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒドの粗生成物を得た。

10

【0306】

<参考例18>

1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒドの製造

5 - クロロ - 1 - エチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒドの粗生成物 (197.1ミリモル相当)のジメチルスルホキシド 100 ml 溶液中に室温にてフッ化カリウム 34.3 g (スプレードライ品、591.3ミリモル)を加えた後、100 にて3日間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒド 11.1 g (収率 26.8%)を得た。

20

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3/\text{TMS}, (\text{ppm}))$: 9.86(1H,d), 4.19(2H,q), 1.52(3H,t)

【0307】

<参考例19>

(1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - メタノールの製造

1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒド 11.1 g (52.8ミリモル)のメタノール 50 ml 溶液を 0 に冷却し、水素化ホウ素ナトリウム 2.1 g (55.5ミリモル)を徐々に加えた。さらに室温にて3時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - メタノール 9.1 g (収率 81.3%)を得た。

30

【0308】

<参考例20>

4 - プロモメチル - 1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールの製造

(1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - メタノール 9.1 g (42.9ミリモル)のジエチルエーテル 100 ml 溶液を - 10 に冷却し、三臭化リン 12.2 g (45.0ミリモル)を加えた。さらに室温にて一夜攪拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4 - プロモメチル - 1 - エチル - 5 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールの粗生成物を得た。

40

【0309】

<参考例21>

5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボ

50

アルデヒドの製造

5 - クロロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒド 60.4 g (282.7ミリモル) のジメチルスルホキシド 700 ml 溶液に、ふっ化カリウム 42.0 g (711.9ミリモル) を加え、120 ~ 140 で5時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン - 酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - 36.8 g (収率66.0%)を得た。

【0310】

<参考例22>

(5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - メタノールの製造

水素化ホウ素ナトリウム 3.9 g (102.6ミリモル) のメタノール 500 ml に溶液、氷冷下、5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒド 36.8 g (187.6ミリモル) のメタノール 200 ml 溶液を加えた。0 で30分間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - メタノール 35.4 g (収率95.4%)を得た。

【0311】

<参考例23>

4 - プロモメチル - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールの製造

5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボアルデヒド 35.4 g (178.7ミリモル) のジエチルエーテル 500 ml 溶液を - 30 に冷却し、三臭化りん 54.0 g (199.5ミリモル) を加えた。室温で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4 - プロモメチル - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール 31.4 g (収率80.8%)を得た。

【0312】

本発明の除草剤は、一般式[I]で示されるイソオキサゾリン誘導体を有効成分としてなるものである。

【0313】

本発明化合物を除草剤として使用するには、本発明化合物それ自体で用いてもよいが、製剤化に一般的に用いられる担体、界面活性剤、分散剤又は補助剤等を配合して、粉剤、水和剤、乳剤、フロアブル剤、微粒剤又は粒剤等に製剤して使用することもできる。

【0314】

製剤化に際して用いられる担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレイ、カオリン、珪藻土、ホワイトカーボン、バーミキュライト、炭酸カルシウム、消石灰、珪砂、硫安、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサン、メチルナフタレン等の液体担体等があげられる。

【0315】

界面活性剤及び分散剤としては、例えばアルキルベンゼンスルホン酸金属塩、ジナフチルメタンジスルホン酸金属塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルアリアルスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等があげられる。補助剤としては、例えばカルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴム等があげられる。使用に際しては適当な濃度に希釈して散布するか又は直

10

20

30

40

50

接施用する。

【0316】

本発明の除草剤は茎葉散布、土壌施用又は水面施用等により使用することができる。有効成分の配合割合については必要に応じて適宜選ばれるが、粉剤又は粒剤とする場合は0.01～10%（重量）、好ましくは0.05～5%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。乳剤及び水和剤とする場合は1～50%（重量）、好ましくは5～30%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。又、フロアブル剤とする場合は1～40%（重量）、好ましくは5～30%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。

【0317】

本発明の除草剤の施用量は使用される化合物の種類、対象雑草、発生傾向、環境条件ならびに使用する剤型等によってかわるが、粉剤及び粒剤のようにそのまま使用の場合は、有効成分として1ヘクタール当り1g～50kg、好ましくは10g～10kgの範囲から適宜選ぶのがよい。又、乳剤、水和剤及びフロアブル剤とする場合のように液状で使用する場合は、0.1～50,000ppm、好ましくは10～10,000ppmの範囲から適宜選ぶのがよい。

10

【0318】

又、本発明の化合物は必要に応じて殺虫剤、殺菌剤、他の除草剤、植物生長調節剤、肥料等と混用してもよい。

【0319】

次に代表的な製剤例をあげて製剤方法を具体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率は、これのみに限定されることなく広い範囲で変更可能である。以下の説明において「部」は重量部を意味する。

20

【0320】

製剤例1 水和剤

本発明化合物番号2の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、 α -ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、クレーの69部を混合粉碎し、水和剤を得た。

【0321】

製剤例2 フロアブル剤

粗粉碎した本発明化合物番号2の20部を水69部に分散させ、ポリオキシエチレンスチレン化フェニルエーテル硫酸塩4部、エチレングリコール7部を加えるとともにシリコーンAF-118N（旭化成工業株式会社製）を製剤に対し200ppm加え、高速攪拌機で30分間混合した後、湿式粉碎機で粉碎しフロアブル剤を得た。

30

【0322】

製剤例3 乳剤

本発明化合物番号2の30部にキシレンとイソホロンの等量混合物60部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリアルポリマー及びアルキルアリアルスルホネートの混合物の10部を加え、これらをよくかきまぜることによって乳剤を得た。

【0323】

製剤例4 粒剤

本発明化合物番号2の10部、タルクとベントナイトを1：3の割合の混合した増量剤の80部、ホワイトカーボンの5部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリアルポリマー及びアルキルアリアルスルホネートの混合物の5部に水10部を加え、よく練ってペースト状としたものを直径0.7mmのふるい穴から押し出して乾燥した後に0.5～1mmの長さに切断し、粒剤を得た。

40

【0324】

次に試験例をあげて本発明化合物の奏する効果を説明する。

【0325】

試験例1 水田土壌処理による除草効果試験

50

100 cm²プラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、タイヌビエ、コナギの種子を播種し、水深3 cmに湛水した。翌日、製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、水面滴下した。施用量は、有効成分を、1ヘクタール当り1000 gとした。その後、温室内で育成し、処理後21日目に表61の基準に従って除草効果を調査した。結果を表62に示す。

【0326】

【表61】

指数	除草効果(生育抑制程度)及び薬害
5	90%以上の抑制の除草効果、薬害
4	70%以上90%未満の除草効果、薬害
3	50%以上70%未満の除草効果、薬害
2	30%以上50%未満の除草効果、薬害
1	10%以上30%未満の除草効果、薬害
0	0%以上10%未満の除草効果、薬害

10

20

【0327】

【表62】

化合物番号	薬量(g a.i. /ha)	タイヌビエ	コナギ
2	1000	5	5

【0328】

試験例2 畑地土壌処理による除草効果試験

80 cm²プラスチックポットに畑土壌を充填し、イヌビエ、エノコログサの種子を播種して覆土した。製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、1ヘクタール当り有効成分が1000 gになる様に、1ヘクタール当り1000 lを小型噴霧器で土壌表面に均一に散布した。その後、温室内で育成し、処理21日目に表61の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表63に示す。

30

【0329】

【表63】

化合物番号	薬量(g a.i. /ha)	イヌビエ	エノコログサ
2	1000	5	5

40

【0330】

試験例3 畑地茎葉処理による除草効果試験

80 cm²プラスチックポットに砂を充填し、イヌビエ、エノコログサの種子を播種し、温室内で2週間育成後、製剤例1に準じて調製した水和剤を水に希釈し、1ヘクタール当り有効成分が1000 gになる様に、1ヘクタール当り1000 lを小型噴霧器で植物体の上方から全体に茎葉散布処理した。その後、温室内で育成し、処理14日目に表61の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表64に示す。

【0331】

【表 6 4】

化合物番号	薬量(g a.i. /ha)	イヌビエ	エノコログサ
40	1000	5	5

【産業上の利用可能性】

【0332】

一般式[I]で表される本発明の化合物は、畑地において問題となる種々の雑草、例えばオオイヌタデ、アオビユ、シロザ、ハコベ、イチビ、アメリカキンゴジカ、アメリカツノクサネム、アサガオ、オナモミ等の広葉雑草をはじめ、ハマスゲ、キハマスゲ、ヒメクグ、カヤツリグサ、コゴメガヤツリ等の多年生及び1年生カヤツリグサ科雑草、ヒエ、メヒシバ、エノコログサ、スズメノカタビラ、ジョンソングラス、ノスズメノテッポウ、野生エンバク等のイネ科雑草の発芽前から生育期の広い範囲にわたって優れた除草効果を発揮する。又、水田に発生するタイヌビエ、タマガヤツリ、コナギ等の一年生雑草及びウリカワ、オモダカ、ミズガヤツリ、クログワイ、ホタルイ、ヘラオモダカ等の多年生雑草を防除することもできる。

10

【0333】

一方、本発明の除草剤は作物に対する安全性も高く、中でもイネ、コムギ、オオムギ、トウモロコシ、グレインソルガム、ダイズ、ワタ、テンサイ等に対して高い安全性を示す。

20

フロントページの続き

- (72)発明者 君島 恭子
静岡県三島市富士見台4 1 番地の7
- (72)発明者 宮崎 雅弘
静岡県磐田郡福田町塩新田4 0 8 番地の1 株式会社ケイ・アイ研究所内
- (72)発明者 藤波 周
静岡県小笠郡菊川町加茂1 8 0 9 番地
- (72)発明者 上野 良平
静岡県小笠郡菊川町加茂1 8 0 9 番地
- (72)発明者 高橋 智
静岡県静岡市吉野町5 番地の1 8

審査官 中西 聡

- (56)参考文献 特開平0 9 - 3 2 8 4 8 3 (J P , A)
特開平0 5 - 1 0 5 6 7 2 (J P , A)
特開平0 4 - 2 2 4 5 7 7 (J P , A)
特開2 0 0 1 - 1 5 8 7 8 7 (J P , A)
国際公開第0 1 / 0 1 2 6 1 3 (W O , A 1)
特開2 0 0 2 - 3 0 8 8 5 7 (J P , A)
国際公開第0 2 / 0 6 2 7 7 0 (W O , A 1)

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

C07D 401/00-421/14
A01N 1/00-65/02
A01P 1/00-23/00
REGISTRY (STN)
CAplus (STN)
MARPAT (STN)