

## 明細書

発明の名称： 環状アミン化合物および殺ダニ剤

## 技術分野

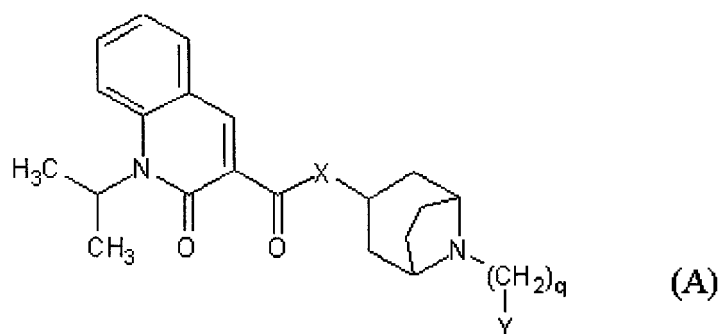
[0001] 本発明は、環状アミン化合物および殺ダニ剤に関する。より詳細に、本発明は、優れた殺ダニ活性を有し、特性と安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できる環状アミン化合物および殺ダニ剤に関する。

本願は、２０１０年２月２５日に日本国に出願された特願２０１０－０３  
 ９８３９号、２０１０年５月２１日に日本国に出願された特願２０１０－１  
 １７３９２号、２０１０年１０月４日に日本国に出願された特願２０１０－  
 ２２４８４４号に基づき優先権を主張し、その内容をここに援用する。

## 背景技術

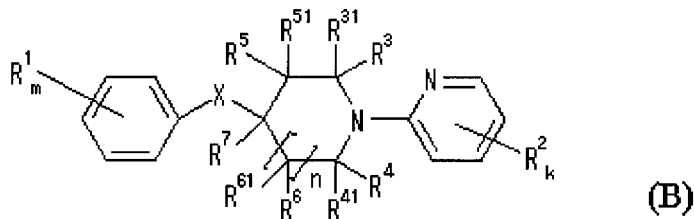
[0002] 本発明の化合物に構造上関連する化合物として、特許文献1は、式(A)で表される化合物を開示している。この化合物はセロトニン4受容体刺激剤としての効果があると述べられている。しかしながら、式(A)において、Xが酸素原子で、Yがアルコキシ基で、qが0である化合物については、その具体的な合成方法および効果が記載されていない。

[0003] [171]



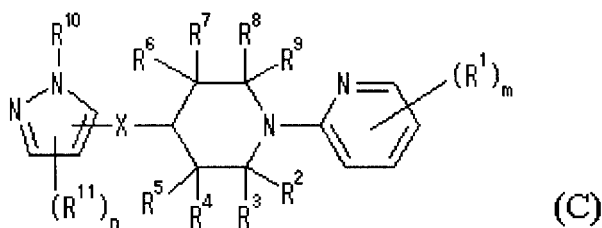
たは1～4の整数を示し、 $R^3$ 、 $R^{31}$ 、 $R^4$ 、 $R^{41}$ 、 $R^5$ 、 $R^{51}$ 、 $R^6$ 、 $R^{61}$  および $R^7$ は、それぞれ独立して水素原子等を示し、Xは、酸素原子等を示し、nは0または1を示す。)

[0005] [化2]



[0006] また、特許文献3には、式(C)で表されるN-ピリジルピペリジン化合物が開示されている。式(C)で表される化合物は、ハダニ類およびサビダニ類に対して殺ダニ活性を有することが開示されている。(式(C)中、 $R^1$ は、ハロゲン原子、 $C_{1-4}$ ハロアルキル基、シアノ基、ニトロ基、または $C_{1-4}$ アルコキシカルボニル基を示す。 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ および $R^9$ は、各々水素原子または $C_{1-4}$ アルキル基を示す。 $R^{10}$ は、水素原子等を示す。 $R^{11}$ はハロゲン原子等を示す。Xは、酸素原子または硫黄原子を示す。mは1～4の整数を示す。nは1または2の整数を示す。)

[0007] [化3]



## 先行技術文献

### 特許文献

[0008] 特許文献1：特開平8-34784号公報

特許文献2：WO2005/095380

特許文献3：WO2008/026658

### 発明の概要

## 発明が解決しようとする課題

[0009] これまでの殺ダニ剤は、工業的に有利に合成でき、安全に使用できるものであっても、残効性などのその他の特性において満足できないことが多かった。また、植物に対する薬害の低減や人畜魚類に対する低毒化または無毒化などの安全性に対する要求レベルは、年々高くなってきている。

そこで、本発明は、優れた殺ダニ活性を有し、特性と安全性に優れ、且つ工業的に有利に合成できる、新規な環状アミン化合物および殺ダニ剤を提供することを課題とする。

また、本発明は、前記殺ダニ剤の有効成分としての環状アミン化合物の合成に好適なヒドロキシアミン化合物を提供することを課題とする。

## 課題を解決するための手段

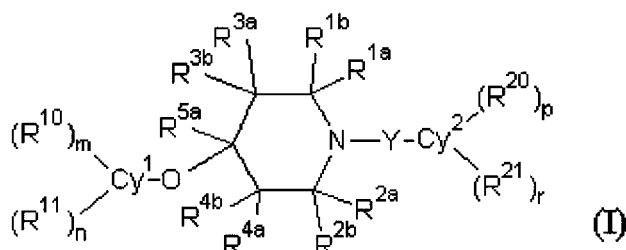
[0010] 本発明者らは、上記課題を解決すべく鋭意検討した結果、特定の構造を有する環状アミン化合物またはその塩は、優れた殺ダニ活性を有し、且つ良好な特性と高い安全性を示す殺ダニ剤となりうることを見出した。また、特定構造のヒドロキシアミン化合物またはその塩が該特定の構造を有する環状アミン化合物またはその塩を合成するための中間体として好適であることを見出した。

本発明は、これらの知見に基づいて完成するに至ったものである。

[0011] すなわち、本発明は、以下のものを含む。

〔１〕 式（Ⅰ）で表される環状アミン化合物またはその塩。

[0012] [化4]



[0013] 式（Ⅰ）中、 $Cy^1$ および $Cy^2$ は、それぞれ独立に、 $C_6 \sim 10$ アリール基、またはヘテロシクリル基を示す。

式 (I) 中、 $R^{1a}$ 、 $R^{1b}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、および  $R^{5a}$  は、それぞれ独立に、水素原子、または無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基を示し、且つ  $R^{1a}$  と  $R^{2a}$  または  $R^{3a}$  と  $R^{4a}$  は、一緒になって、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 6 アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 6 アルケニレン基、式： $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$  で表される基、式： $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$  で表される基、式： $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$  で表される基、または式： $-\text{CH}_2\text{NR}^6\text{CH}_2-$  で表される基（ただし、 $R^6$  は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 7 アシル基、または無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基を示す。）を形成している。

式 (I) 中、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{20}$ 、および  $R^{21}$  は、それぞれ独立に、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニル基、水酸基、オキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニルオキシ基、カルボキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 7 アシル基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 6 ~ 10 アリールオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 7 アシルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキルオキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニル

オキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルオキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するアミノオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキリデンアミノオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリル基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシ基、置換基を有するスルホニルオキシ基、アミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するヒドロキシアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルオキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルオキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールオキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシカルボニルアミノ基、置換基を有するスルホニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するアミノカルボニル基、メルカプト基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC

3～8シクロアルキルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルケニルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルキニルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>6</sub>～10アリールチオ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルチオ基、（無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキル）チオカルボニル基、（無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルコキシ）チオカルボニル基、（無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキルチオ）カルボニル基、（無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキルチオ）チオカルボニル基、置換基を有するスルフィニル基、置換基を有するスルホニル基、ペンタフルオロスルファニル基、トリC<sub>1</sub>～6アルキル置換シリル基、トリC<sub>6</sub>～10アリール置換シリル基、シアノ基、ニトロ基、またはハロゲン原子を示す。

C<sub>y</sub><sup>1</sup>上のR<sup>10</sup>またはR<sup>11</sup>は、それぞれの中で、または相互に、またはC<sub>y</sub><sup>1</sup>上で結合する原子と一緒になって環を形成してもよく、C<sub>y</sub><sup>2</sup>上のR<sup>20</sup>またはR<sup>21</sup>は、それぞれの中で、または相互に、またはC<sub>y</sub><sup>2</sup>上で結合する原子と一緒になって環を形成してもよい。

式（I）中のmはR<sup>10</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。mが2以上のとき、R<sup>10</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

式（I）中のnはR<sup>11</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、R<sup>11</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

式（I）中のpはR<sup>20</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。pが2以上のとき、R<sup>20</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

式（I）中のrはR<sup>21</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。rが2以上のとき、R<sup>21</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

式（I）中のYは、酸素原子または硫黄原子を示す。

[0014]〔2〕 式（I）中、C<sub>y</sub><sup>1</sup>が、フェニル基、ピラゾリル基、チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、またはピリダジニル基であって、且つC<sub>y</sub><sup>2</sup>が、フェニル基、ピラゾリル基、チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、またはピリダジニル基である、前記〔1〕に記載の環状アミン化合

物またはその塩。

[0015] [3] 式 (I) 中の  $R^{10}$  が、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基、C 2～6 アルケニル基、水酸基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 3～8 シクロアルコキシ基、C 2～6 アルケニルオキシ基、C 2～6 ハロアルケニルオキシ基、C 2～6 アルキニルオキシ基、C 2～6 ハロアルキニルオキシ基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルコキシ基、C 3～8 シクロアルキル C 1～6 アルコキシ基、シアノ C 1～6 アルコキシ基、C 1～7 アシル C 1～6 アルコキシ基、ヒドロキシ C 1～6 アルコキシ基、C 1～7 アシルオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、C 2～6 アルケニルオキシカルボニル基、C 2～6 アルキニルオキシカルボニル基、C 1～6 アルコキシカルボニルオキシ基、C 1～6 アルキルアミノカルボニルオキシ基、C 6～10 アリール基、ヘテロシクリル基、C 1～6 ハロアルキルスルホニルオキシ基、C 1～6 アルキリデンアミノオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有する C 7～11 アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 7～11 アラルキルオキシ基、C 1～6 アルキルチオ基、またはニトロ基であって、

式 (I) 中の  $R^{11}$  が、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C 1～6 ハロアルキル基、C 2～6 ハロアルケニル基、または C 2～6 ハロアルキニル基であって、

式 (I) 中の  $R^{20}$  が、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C 1～6 ハロアルキル基、C 2～6 ハロアルケニル基、または C 2～6 ハロアルキニル基であって、且つ

式 (I) 中の  $R^{21}$  が、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基、水酸基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 2～6 ハロアルケニルオキシ基、C 2～6 ハロアルキニルオキシ基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルコキシ基、C 3～8 シクロアルキル C 1～6 アルコキシ基、C

1～6アルコキシカルボニル基、C 2～6アルケニルオキシカルボニル基、C 2～6アルキニルオキシカルボニル基、C 1～6アルキリデンアミノオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11アラルキルオキシ基、またはニトロ基である、前記〔1〕または〔2〕に記載の環状アミン化合物またはその塩。

[0016] 〔4〕 式（I）中、

C y<sup>1</sup>がフェニル基であり；

R<sup>1b</sup>、R<sup>2b</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup>、R<sup>4a</sup>、R<sup>4b</sup>およびR<sup>5a</sup>が水素原子であり；

R<sup>1a</sup>とR<sup>2a</sup>は、それらが一緒になってなる、無置換の若しくは置換基を有するC 3～6アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～6アルケニレン基、式： $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ で表される基、式： $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ で表される基、式： $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ で表される基、または式： $-\text{CH}_2\text{NR}^6\text{CH}_2-$ で表される基（ただし、R<sup>6</sup>は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシル基、または無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。）であり；

C y<sup>2</sup>がピリジン-2-イル基であり；

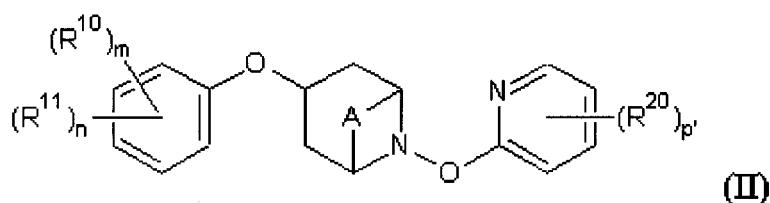
Yは酸素原子であり；

rはゼロであり；且つ

pは0～4のいずれかの整数である、前記〔1〕～〔3〕のいずれか1項に記載の環状アミン化合物またはその塩、

〔5〕 すなわち、式（II）で表される環状アミン化合物またはその塩。

[0017] [化5]



[0018] 式 (II) 中の  $R^{10}$ 、 $m$ 、 $R^{11}$ 、 $n$ 、および  $R^{20}$  は、式 (I) におけるそれらと同じ意味を示す。

式 (II) 中の  $A$  は、無置換の若しくは置換基を有する  $C 3 \sim 6$  アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有する  $C 3 \sim 6$  アルケニレン基、式： $-CH_2OCH_2-$  で表される基、式： $-CH_2SCH_2-$  で表される基、式： $-CH_2C(=O)CH_2-$  で表される基、または式： $-CH_2NR^6CH_2-$  で表される基（ただし、 $R^6$  は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有する  $C 1 \sim 6$  アルキル基、無置換の若しくは置換基を有する  $C 1 \sim 7$  アシル基、または無置換の若しくは置換基を有する  $C 1 \sim 6$  アルコキシカルボニル基を示す。）を示す。

式 (II) 中の  $p'$  は、 $R^{20}$  の数を示し且つ  $0 \sim 4$  のいずれかの整数である。 $p'$  が  $2$  以上のとき、 $R^{20}$  同士は互いに同一でも異なってもよい。

[0019] [6] 式 (II) 中の  $R^{10}$  が、 $C 1 \sim 6$  アルキル基、 $C 1 \sim 6$  アルコキシ  $C 1 \sim 6$  アルキル基、 $C 1 \sim 6$  アルコキシ  $C 1 \sim 6$  アルコキシ  $C 1 \sim 6$  アルキル基、 $C 2 \sim 6$  アルケニル基、水酸基、 $C 1 \sim 6$  アルコキシ基、 $C 1 \sim 6$  ハロアルコキシ基、 $C 3 \sim 8$  シクロアルコキシ基、 $C 2 \sim 6$  アルケニルオキシ基、 $C 2 \sim 6$  ハロアルケニルオキシ基、 $C 2 \sim 6$  アルキニルオキシ基、 $C 2 \sim 6$  ハロアルキニルオキシ基、 $C 1 \sim 6$  アルコキシ  $C 1 \sim 6$  アルコキシ基、 $C 3 \sim 8$  シクロアルキル  $C 1 \sim 6$  アルコキシ基、シアノ  $C 1 \sim 6$  アルコキシ基、 $C 1 \sim 7$  アシル  $C 1 \sim 6$  アルコキシ基、ヒドロキシ  $C 1 \sim 6$  アルコキシ基、 $C 1 \sim 7$  アシルオキシ基、 $C 1 \sim 6$  アルコキシカルボニル基、 $C 2 \sim 6$  アルケニルオキシカルボニル基、 $C 2 \sim 6$  アルキニルオキシカルボニル基、 $C 1 \sim 6$  アルコキシカルボニルオキシ基、 $C 1 \sim 6$  アルキルアミノカルボニルオキシ基、 $C 6 \sim 10$  アリール基、ヘテロシクリル基、 $C 1 \sim 6$  ハロアルキルスルホニルオキシ基、 $C 1 \sim 6$  アルキリデンアミノオキシ基、 $C 1 \sim 6$  アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有する  $C 7 \sim 11$  アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有する  $C 7 \sim 11$  アラルキルオキシ基、 $C 1 \sim 6$  アルキルチオ基、またはニトロ基であって、

式 (II) 中の  $R^{11}$  が、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C 1 ～ 6 ハロアルキル基、C 2 ～ 6 ハロアルケニル基、または C 2 ～ 6 ハロアルキニル基であって、且つ

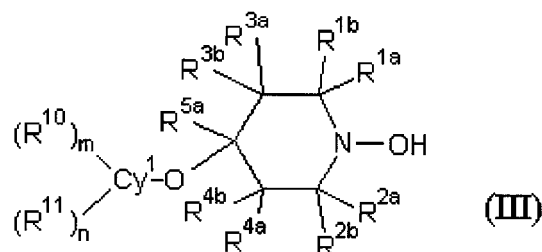
式 (II) 中の  $R^{20}$  が、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C 1 ～ 6 ハロアルキル基、C 2 ～ 6 ハロアルケニル基、または C 2 ～ 6 ハロアルキニル基である、前記 [ 5 ] に記載の環状アミン化合物またはその塩。

[0020] [ 7 ] 前記 [ 1 ] ～ [ 6 ] のいずれか一項に記載の環状アミン化合物またはその塩から選ばれる少なくとも 1 種を有効成分として含有する有害生物防除剤。

[ 8 ] 前記 [ 1 ] ～ [ 6 ] のいずれか一項に記載の環状アミン化合物またはその塩から選ばれる少なくとも 1 種を有効成分として含有する殺ダニ剤。

[0021] [ 9 ] 式 (III) で表されるヒドロキシアミン化合物またはその塩。

[0022] [化6]



[0023] 式 (III) 中の  $Cy^1$  は、C 6 ～ 10 アリール基、またはヘテロシクリル基を示す。

式 (III) 中の  $R^{1a}$ 、 $R^{1b}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、および  $R^{5a}$  は、それぞれ独立に、水素原子、または無置換の若しくは置換基を有する C 1 ～ 6 アルキル基を示し、且つ  $R^{1a}$  と  $R^{2a}$  または  $R^{3a}$  と  $R^{4a}$  は、一緒になって、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ～ 6 アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ～ 6 アルケニレン基、式：  $-CH_2OCH_2-$  で表される基、式：  $-CH_2SCH_2-$  で表される基、式：  $-CH_2C(=O)CH_2-$  で表される基、または式：  $-CH_2NR^6CH_2-$  で表される基 (ただし、 $R^6$  は、水素

原子、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシル基、または無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。)を形成している。

式(III)中のR<sup>10</sup>、およびR<sup>11</sup>は、それぞれ独立に、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニル基、水酸基、オキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルオキシ基、カルボキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルオキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルオキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルオキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールアミノカルボニルオキシ基、無置換の若し

くは置換基を有するヘテロシクリルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するアミノオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキリデンアミノオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリル基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシ基、置換基を有するスルホニルオキシ基、アミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するヒドロキシアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルオキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルオキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールオキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシカルボニルアミノ基、置換基を有するスルホニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するアミノカルボニル基、メルカプト基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールチオ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルチオ基、（無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキル）チオカルボニル基、（無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシ）チオカルボニル基、（無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルチオ）カルボニル基、（無置換の若しくは置換基を有する

るC 1～6アルキルチオ)チオカルボニル基、置換基を有するスルフィニル基、置換基を有するスルホニル基、ペンタフルオロスルファニル基、トリC 1～6アルキル置換シリル基、トリC 6～10アリール置換シリル基、シアノ基、ニトロ基、またはハロゲン原子を示す。

C<sub>y</sub><sup>1</sup>上のR<sup>10</sup>またはR<sup>11</sup>は、それぞれの中で、または相互に、またはC<sub>y</sub><sup>1</sup>上で結合する原子と一緒になって環を形成してもよい。

式(III)中のmはR<sup>10</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。mが2以上のとき、R<sup>10</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

式(III)中のnはR<sup>11</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、R<sup>11</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

[0024] [10] 式(III)中、C<sub>y</sub><sup>1</sup>が、フェニル基、ピラゾリル基、チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、またはピリダジニル基である、前記[9]に記載のヒドロキシアミン化合物またその塩。

[0025] [11] 式(III)中のR<sup>10</sup>が、C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6アルコキシC 1～6アルキル基、C 2～6アルケニル基、水酸基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 3～8シクロアルコキシ基、C 2～6アルケニルオキシ基、C 2～6ハロアルケニルオキシ基、C 2～6アルキニルオキシ基、C 2～6ハロアルキニルオキシ基、C 1～6アルコキシC 1～6アルコキシ基、C 3～8シクロアルキルC 1～6アルコキシ基、シアノC 1～6アルコキシ基、C 1～7アシルC 1～6アルコキシ基、ヒドロキシC 1～6アルコキシ基、C 1～7アシルオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、C 2～6アルケニルオキシカルボニル基、C 2～6アルキニルオキシカルボニル基、C 1～6アルコキシカルボニルオキシ基、C 1～6アルキルアミノカルボニルオキシ基、C 6～10アリール基、ヘテロシリル基、C 1～6ハロアルキルスルホニルオキシ基、C 1～6アルキリデンアミノオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11アラルキル

オキシ基、C 1～6アルキルチオ基、またはニトロ基であって、且つ

式 (III) 中の R<sup>11</sup>が、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C 1～6ハロアルキル基、C 2～6ハロアルケニル基、またはC 2～6ハロアルキニル基である、前記〔9〕または〔10〕に記載のヒドロキシアミン化合物またはその塩。

### 発明の効果

[0026] 本発明に係る環状アミン化合物またはその塩は、農作物や衛生面において有害なダニ類などを効果的に防除することができる。

本発明に係るヒドロキシアミン化合物またはその塩を用いると、本発明に係る環状アミン化合物またはその塩を容易に合成することができる。

### 発明を実施するための形態

[0027] 〔環状アミン化合物〕

本発明に係る環状アミン化合物は、式 (I) または式 (II) で表される化合物である。また本発明に係る環状アミン化合物の塩は、式 (I) または式 (II) で表される化合物の塩である。

[0028] 本明細書における、「無置換の」の用語は、母核となる基のみであることを意味する。「置換基を有する」との記載がなく母核となる基の名称のみで記載しているときは、別段の断りがない限り「無置換の」意味である。

一方、「置換基を有する」の用語は、母核となる基のいずれかの水素原子が、母核と同一又は異なる構造の基で置換されていることを意味する。置換基は1つであってもよいし、2つ以上であってもよい。2つ以上の置換基は同一であってもよいし、異なるものであってもよい。

「C 1～6」などの用語は、母核となる基の炭素原子数が1～6個などであることを表している。この炭素原子数には、置換基の中に在る炭素原子の数を含まない。例えば、置換基としてエトキシ基を有するブチル基は、C 2アルコキシC 4アルキル基に分類する。

[0029] 「置換基」は化学的に許容され、本発明の効果を有する限りにおいて特に制限されない。

「置換基」となり得る基としては、 フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などのハロゲン原子； メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*s*-ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基などのC 1～6アルキル基； シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基などのC 3～8シクロアルキル基； ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチルー2-プロペニル基、2-メチルー2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチルー2-ブテニル基、2-メチルー2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基などのC 2～6アルケニル基； 2-シクロプロペニル基、2-シクロペンテニル基、3-シクロヘキセニル基、4-シクロオクテニル基などのC 3～8シクロアルケニル基； エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチルー2-プロピニル基、2-メチルー3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチルー2-ブチニル基、2-メチルー3-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1, 1-ジメチルー2-ブチニル基などのC 2～6アルキニル基；

[0030] メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、*i*-プロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*s*-ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基などのC 1～6アルコキシ基； ビニルオキシ基、アリルオキシ基、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基などのC 2～6アルケニルオキシ基； エチニルオキシ基、プロパルギルオキシ基などのC 2～6アルキニルオキシ基； フェニル基、ナフチル基などのC 6～10アリール基； フェノキシ基、1-ナフトキシ基などのC 6～10アリールオキシ基； ベンジル基、フェネチル基などのC 7～11アラルキル基； ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基などのC 7～11アラルキルオキシ基； ホルミル基、アセチル基、プロピオ

ニル基、ベンゾイル基、シクロヘキシルカルボニル基などのC 1～7アシル基；ホルミルオキシ基、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、シクロヘキシルカルボニルオキシ基などのC 1～7アシルオキシ基；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、i-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基などのC 1～6アルコキシカルボニル基；カルボキシル基；

[0031] 水酸基；オキシ基；クロロメチル基、クロロエチル基、トリフルオロメチル基、1, 2-ジクロロ-n-プロピル基、1-フルオロ-n-ブチル基、パーフルオロ-n-ペンチル基などのC 1～6ハロアルキル基；2-クロロ-1-プロペニル基、2-フルオロ-1-ブテニル基などのC 2～6ハロアルケニル基；4, 4-ジクロロ-1-ブチニル基、4-フルオロ-1-ペンチニル基、5-ブロモ-2-ペンチニル基などのC 2～6ハロアルキニル基；2-クロロ-n-プロポキシ基、2, 3-ジクロロブトキシ基などのC 1～6ハロアルコキシ基；2-クロロプロペニルオキシ基、3-ブロモブテニルオキシ基などのC 2～6ハロアルケニルオキシ基；4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基などのC 6～10ハロアリール基；4-フルオロフェニルオキシ基、4-クロロ-1-ナフトキシ基などのC 6～10ハロアリールオキシ基；クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4-クロロベンゾイル基などのハロゲン置換C 1～7アシル基；

[0032] シアノ基；イソシアノ基；ニトロ基；イソシアナト基；シアナト基；アミノ基；メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基などのC 1～6アルキルアミノ基；アニリノ基、ナフチルアミノ基などのC 6～10アリールアミノ基；ベンジルアミノ基、フェニルエチルアミノ基などのC 7～11アルキルアミノ基；ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、ブチルアミノ基、i-プロピルカルボニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基などのC 1～7アシルアミノ基；メトキシカルボニ

ルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、*n*-プロポキシカルボニルアミノ基、*i*-プロポキシカルボニルアミノ基などのC 1～6アルコキシカルボニルアミノ基； アミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、*N*-フェニル-*N*-メチルアミノカルボニル基などの無置換の若しくは置換基を有するアミノカルボニル基； イミノメチル基、(1-イミノ)エチル基、(1-イミノ)-*n*-プロピル基などのイミノ基で置換されたC 1～6アルキル基； ヒドロキシイミノメチル基、(1-ヒドロキシイミノ)エチル基、(1-ヒドロキシイミノ)プロピル基、メトキシイミノメチル基、(1-メトキシイミノ)エチル基などのヒドロキシイミノ基で置換されたC 1～6アルキル基；

- [0033] メルカプト基； イソチオシアナト基； チオシアナト基； メチルチオ基、エチルチオ基、*n*-プロピルチオ基、*i*-プロピルチオ基、*n*-ブチルチオ基、*i*-ブチルチオ基、*s*-ブチルチオ基、*t*-ブチルチオ基などのC 1～6アルキルチオ基； ビニルチオ基、アリルチオ基などのC 2～6アルケニルチオ基； エチニルチオ基、プロパルギルチオ基などのC 2～6アルキニルチオ基； フェニルチオ基、ナフチルチオ基などのC 6～10アリールチオ基； チアゾリルチオ基、ピリジルチオ基などのヘテロシクリルチオ基； ベンジルチオ基、フェネチルチオ基などのC 7～11アラルキルチオ基； (メチルチオ)カルボニル基、(エチルチオ)カルボニル基、(*n*-プロピルチオ)カルボニル基、(*i*-プロピルチオ)カルボニル基、(*n*-ブチルチオ)カルボニル基、(*i*-ブチルチオ)カルボニル基、(*s*-ブチルチオ)カルボニル基、(*t*-ブチルチオ)カルボニル基などの(C 1～6アルキルチオ)カルボニル基；

- [0034] メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、*t*-ブチルスルフィニル基などのC 1～6アルキルスルフィニル基； アリルスルフィニル基などのC 2～6アルケニルスルフィニル基； プロパルギルスルフィニル基などのC 2～6アルキニルスルフィニル基； フェニルスルフィニル基などのC 6～10アリールスルフィニル基； チアゾリルスルフィニル基、ピリジルス

ルフィニル基などのヘテロシクリルスルフィニル基； ベンジルスルフィニル基、フェネチルスルフィニル基などのC 7～11アラルキルスルフィニル基； メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、*t*-ブチルスルホニル基などのC 1～6アルキルスルホニル基； アリルスルホニル基などのC 2～6アルケニルスルホニル基； プロパルギルスルホニル基などのC 2～6アルキニルスルホニル基； フェニルスルホニル基などのC 6～10アリールスルホニル基； チアゾリルスルホニル基、ピリジルスルホニル基などのヘテロシクリルスルホニル基； ベンジルスルホニル基、フェネチルスルホニル基などのC 7～11アラルキルスルホニル基；

[0035] ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などの5員ヘテロアリール基； ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などの6員ヘテロアリール基； アジリジニル基、エポキシ基、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基などの飽和ヘテロシクリル基； トリメチルシリル基、トリエチルシリル基、*t*-ブチルジメチルシリル基などのトリC 1～6アルキル置換シリル基； トリフェニルシリル基； などを挙げることができる。

[0036] また、これらの「置換基」はさらに別の「置換基」を有するものであってもよい。

[0037] [C<sub>y</sub><sup>1</sup>、C<sub>y</sub><sup>2</sup>]

式(I)中のC<sub>y</sub><sup>1</sup>およびC<sub>y</sub><sup>2</sup>は、それぞれ独立に、C 6～10アリール基、またはヘテロシクリル基を示す。

[0038] C<sub>y</sub><sup>1</sup>およびC<sub>y</sub><sup>2</sup>における、「C 6～10アリール基」は、単環であってもよいし、多環であってもよい。多環アリール基は、少なくとも一つの環が芳香環であれば、残りの環が飽和脂環、不飽和脂環または芳香環のいずれであってもよい。C 6～10アリール基としては、フェニル基、ナフチル基、ア

ズレニル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などが挙げられる。これらのうち、C<sub>y</sub><sup>1</sup>またはC<sub>y</sub><sup>2</sup>における、「C<sub>6</sub>～10アリール基」としては、フェニル基が好ましい。

[0039] C<sub>y</sub><sup>1</sup>およびC<sub>y</sub><sup>2</sup>における、「ヘテロシクリル基」は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1～4個のヘテロ原子を環を構成する原子として含むものである。ヘテロシクリル基は、単環であってもよいし、多環であってもよい。

ヘテロシクリル基としては、5員ヘテロアリール基、6員ヘテロアリール基、縮合ヘテロアリール基、飽和ヘテロシクリル基、部分不飽和ヘテロシクリル基などが挙げられる。

[0040] 5員ヘテロアリール基としては、ピロールー1-イル基、ピロールー2-イル基、ピロールー3-イル基などのピロリル基；フランー2-イル基、フランー3-イル基などのフリル基；チオフェンー2-イル基、チオフェンー3-イル基などのチエニル基；イミダゾールー1-イル基、イミダゾールー2-イル基、イミダゾールー4-イル基、イミダゾールー5-イル基などのイミダゾリル基；ピラゾールー1-イル基、ピラゾールー3-イル基、ピラゾールー4-イル基、ピラゾールー5-イル基などのピラゾリル基；オキサゾールー2-イル基、オキサゾールー4-イル基、オキサゾールー5-イル基などのオキサゾリル基；イソオキサゾールー3-イル基、イソオキサゾールー4-イル基、イソオキサゾールー5-イル基などのイソオキサゾリル基；チアゾールー2-イル基、チアゾールー4-イル基、チアゾールー5-イル基などのチアゾリル基；イソチアゾールー3-イル基、イソチアゾールー4-イル基、イソチアゾールー5-イル基などのイソチアゾリル基；1, 2, 3-トリアゾールー1-イル基、1, 2, 3-トリアゾールー4-イル基、1, 2, 3-トリアゾールー5-イル基、1, 2, 4-トリアゾールー1-イル基、1, 2, 4-トリアゾールー3-イル基、1, 2, 4-トリアゾールー5-イル基などのトリアゾリル基；1, 2, 4-オキサジアゾールー3-イル基、1, 2, 4-オキサジアゾールー5-イル

ル基、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル基などのオキサジアゾリル基； 1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル基、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル基、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基などのチアジアゾリル基； テトラゾール-1-イル基、テトラゾール-2-イル基などのテトラゾリル基； などが挙げられる。

[0041] 6員ヘテロアリール基としては、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基などのピリジル基； ピラジン-2-イル基、ピラジン-3-イル基などのピラジニル基； ピリミジン-2-イル基、ピリミジン-4-イル基、ピリミジン-5-イル基などのピリミジニル基； ピリダジン-3-イル基、ピリダジン-4-イル基などのピリダジニル基； トリアジニル基； などが挙げられる。

[0042] 縮合ヘテロアリール基としては、インドール-1-イル基、インドール-2-イル基、インドール-3-イル基、インドール-4-イル基、インドール-5-イル基、インドール-6-イル基、インドール-7-イル基；ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾフラン-3-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-6-イル基、ベンゾフラン-7-イル基；ベンゾチオフェン-2-イル基、ベンゾチオフェン-3-イル基、ベンゾチオフェン-4-イル基、ベンゾチオフェン-5-イル基、ベンゾチオフェン-6-イル基、ベンゾチオフェン-7-イル基；ベンゾイミダゾール-1-イル基、ベンゾイミダゾール-2-イル基、ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾイミダゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-2-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-2-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基；キノリン-2-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-4-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-7-イル基、キノリン-8-イル基； などが挙げられる。

[0043] その他のヘテロシクリル基としては、アジリジン-1-イル基、アジリ

ジン-2-イル基、エポキシ基；ピロリジン-1-イル基、ピロリジン-2-イル基、ピロリジン-3-イル基、テトラヒドロフラン-2-イル基、テトラヒドロフラン-3-イル基；[1, 3] ジオキシラン-2-イル基、[1, 3] ジオキシラン-4-イル基；ピペリジン-1-イル基、ピペリジン-2-イル基、ピペリジン-3-イル基、ピペリジン-4-イル基、ピペラジン-1-イル基、ピペラジン-2-イル基、モルホリン-2-イル基、モルホリン-3-イル基、モルホリン-4-イル基；1, 3-ベンゾジオキソール-4-イル基、1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル基、1, 4-ベンゾジオキサ-5-イル基、1, 4-ベンゾジオキサ-6-イル基、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾジオキセピン-6-イル基、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 5-ベンゾジオキセピン-7-イル基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イル基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イル基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル基；などが挙げられる。

[0044] これらのうち、C<sub>y</sub><sup>1</sup>またはC<sub>y</sub><sup>2</sup>における、「ヘテロシクリル基」としては、5員ヘテロアリール基、または6員ヘテロアリール基が好ましく、ピラゾリル基、チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、またはピリダジニル基がより好ましい。

本発明に係る環状アミン化合物においては、C<sub>y</sub><sup>1</sup>がフェニル基であることが好ましく、C<sub>y</sub><sup>2</sup>がピリジル基であることが好ましい。

[0045] [R<sup>1a</sup>、R<sup>1b</sup>、R<sup>2a</sup>、R<sup>2b</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup>、R<sup>4a</sup>、R<sup>4b</sup>およびR<sup>5a</sup>]

式(I)中、R<sup>1a</sup>、R<sup>1b</sup>、R<sup>2a</sup>、R<sup>2b</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup>、R<sup>4a</sup>、R<sup>4b</sup>およびR<sup>5a</sup>（以下、これらをR<sup>1a</sup>等と呼ぶことがある。）は、それぞれ独立に、水素原子、または無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>~6アルキル基を示し、且つ R<sup>1a</sup>とR<sup>2a</sup>またはR<sup>3a</sup>とR<sup>4a</sup>は、一緒になって、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>3</sub>~6アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>3</sub>~6アルケニレン基、式：-CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>-で表される基、式：-CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>-で表される基、式：-CH<sub>2</sub>C(=O)CH<sub>2</sub>-で表される基、または式：-CH<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>CH<sub>2</sub>-

で表される基（ただし、 $R^6$ は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシル基、または無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。）を形成している。なお、 $R^{1a}$ と $R^{2a}$ または $R^{3a}$ と $R^{4a}$ が一緒になって形成する基を、「架橋部分」ということがある。

[0046]  $R^{1a}$ 等における「C 1～6アルキル基」は、直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。アルキル基としては、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*n*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基、*i*-プロピル基、*i*-ブチル基、*s*-ブチル基、*t*-ブチル基、*i*-ペンチル基、ネオペンチル基、2-メチルブチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、*i*-ヘキシル基などが挙げられる。

[0047]  $R^{1a}$ 等における「置換基を有するC 1～6アルキル基」としては、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、2-シクロオクチルエチル基などのC 3～8シクロアルキルC 1～6アルキル基；フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリブロモメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、4-フルオロブチル基、4-クロロブチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル基、パーフルオロヘキシル基、パークロロヘキシル基、パーフルオロクチル基、パークロロオクチル基、2, 4, 6-トリクロロヘキシル基、ヘキサフルオロイソプロピル基、ペンタフルオロイソプロピル基、パーフルオロメトキシ基などのC 1～6ハロアルキル基；

[0048] ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基などのヒドロキシC 1～6アルキル基；メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、メトキシ-*n*-プロピル基、*n*-プロポキシメチル基、*i*-プロポキシメチル基、*i*-プロポキシエチル基、*s*-ブトキシメチル基

、*t*-ブトキシエチル基などのC 1～6アルコキシC 1～6アルキル基；  
 メトキシメトキシメチル基、1-メトキシエトキシメチル基、2-メトキシ  
 エトキシメチル基、2-（1-メトキシエトキシ）エチル基、2-（2-メ  
 トキシエトキシ）エチル基などのC 1～6アルコキシC 1～6アルコキシC  
 1～6アルキル基； ジメトキシメチル基、ジエトキシメチル基、2, 2-  
 ジメトキシエチル基、1, 2-ジメトキシエチル基、3, 3-ジメトキシ*n*-  
 プロピル基、2, 2-ジエトキシエチル基などのジC 1～6アルコキシC  
 1～6アルキル基； ホルミルオキシメチル基、アセトキシメチル基、2-  
 アセトキシエチル基、プロピオニルオキシメチル基、プロピオニルオキシエ  
 チル基などのC 1～7アシルオキシC 1～6アルキル基； イミノメチル基  
 、（1-イミノ）エチル基、（1-イミノ）プロピル基などのイミノ基で置  
 換されたC 1～6アルキル基； ヒドロキシイミノメチル基、（1-ヒドロ  
 キシイミノ）エチル基、（1-ヒドロキシイミノ）-*n*-プロピル基、メト  
 キシイミノメチル基、（1-メトキシイミノ）エチル基などのヒドロキシイ  
 ミノ基で置換されたC 1～6アルキル基； 無置換の若しくは置換基を有す  
 るベンジル基、無置換の若しくは置換基を有するフェネチル基などの無置換  
 の若しくは置換基を有するC 7～11アラルキル基； などが挙げられる。

[0049]  $R^{1a}$ と $R^{2a}$ 、または $R^{3a}$ と $R^{4a}$ が一緒になって形成する「C 3～6アルキレン  
 基」としては、トリメチレン基、テトラメチレン基、プロピレン基などが挙  
 げられる。これらのうち、C 3～4アルキレン基が好ましい。

また、「C 3～6アルケニレン基」としては、プロペニレン基、2-ブテ  
 ニレン基などが挙げられる。これらのうち、C 3～4アルケニレン基が好ま  
 しい。

置換基となり得る基としては、 フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ  
 素原子などのハロゲン原子； メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-  
 プロピル基、*n*-ブチル基、*s*-ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、  
*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基などのC 1～6アルキル基； シクロプロ  
 ピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC 3

～6シクロアルキル基；メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、*i*-プロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*s*-ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基などのC1～6アルコキシ基；水酸基；クロロメチル基、クロロエチル基、トリフルオロメチル基、1,2-ジクロロ-*n*-プロピル基、1-フルオロ-*n*-ブチル基、パーフルオロ-*n*-ペンチル基などのC1～6ハロアルキル基；などを挙げることができる。

[0050] 式-CH<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>CH<sub>2</sub>-中、R<sup>6</sup>は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するC1～6アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC1～7アシル基、または無置換の若しくは置換基を有するC1～6アルコキシカルボニル基を示す。

R<sup>6</sup>における、「無置換の若しくは置換基を有するC1～6アルキル基」としては、前記R<sup>1a</sup>等において例示したそれと同じものを挙げることができる。

R<sup>6</sup>における、「C1～7アシル基」としては、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基、シクロヘキシルカルボニル基などが挙げられる。

R<sup>6</sup>における、「置換基を有するC1～7アシル基」としては、クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4-クロロベンゾイル基などが挙げられる。

[0051] R<sup>6</sup>における、「C1～6アルコキシカルボニル基」としては、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、*i*-プロポキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*t*-ブトキシカルボニル基などが挙げられる。

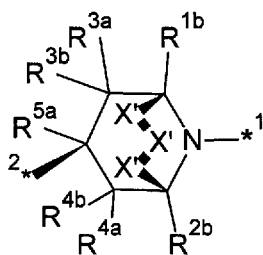
R<sup>6</sup>における、「置換基を有するC1～6アルコキシカルボニル基」としては、シクロプロピルメトキシカルボニル基、シクロブチルメトキシカルボニル基、シクロペンチルメトキシカルボニル基、シクロヘキシルメトキシカルボニル基、2-メチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2,3-ジメチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-クロロシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-シクロプロピルエトキシカルボニル基などのC3

～8シクロアルキルC 1～6アルコキシカルボニル基；フルオロメトキシカルボニル基、クロロメトキシカルボニル基、ブロモメトキシカルボニル基、ジフルオロメトキシカルボニル基、ジクロロメトキシカルボニル基、ジブロモメトキシカルボニル基、トリフルオロメトキシカルボニル基、トリクロロメトキシカルボニル基、トリブロモメトキシカルボニル基、2，2，2-トリフルオロエトキシカルボニル基、2，2，2-トリクロロエトキシカルボニル基、ペンタフルオロエトキシカルボニル基、4-フルオロブトキシカルボニル基、3，3，3-トリフルオロプロポキシカルボニル基、2，2，2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエトキシカルボニル基、パーフルオロヘキシルオキシカルボニル基などのC 1～6ハロアルコキシカルボニル基；などが挙げられる。

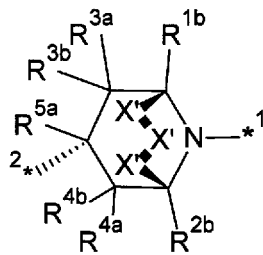
[0052] 架橋部分を具体的に説明するために、例えば、下記の部分構造式（a 1）～（a 4）を挙げることができる。式（a 1）～（a 4）中の\* 1はYとの結合位置を表し、\* 2は酸素原子との結合位置を表す。X' は、それぞれ独立に、 $-CH_2-$ 、酸素原子、硫黄原子、 $-NR^6-$ 、カルボニル基などを示す。架橋部分とR<sup>5a</sup>の関係が、*exo*もしくは*endo*の関係にある異性体およびこれらの混合物も本発明に含まれる。

[0053]

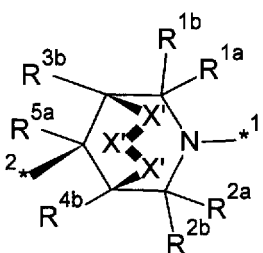
[化7]



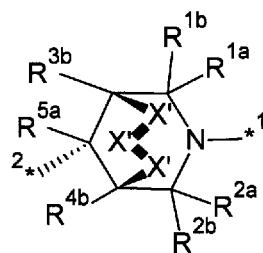
(a1)



(a2)



(a3)



(a4)

[0054] [R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>]

式 (I) 中の R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>20</sup>、および R<sup>21</sup> (以下、これらを、R<sup>10</sup>等と呼びことがある。) は、R<sup>10</sup>、および R<sup>11</sup> は、それぞれ独立に、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニル基、水酸基、オキソ基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルコキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキニルオキシ基、カルボキシ基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 7 アシル基、無置換の若しくは置換基を有する C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 3 ~ 8 シクロアルキルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有する C 2 ~ 6 アルキ

ニルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシカルボニル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルオキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルオキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルオキシカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルアミノカルボニルオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するアミノオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキリデンアミノオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリール基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリル基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールオキシ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシ基、置換基を有するスルホニルオキシ基、アミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～8シクロアルキルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルキニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 6～10アリールアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するヒドロキシアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 2～6アルケニルオキシカルボニルアミノ基

、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルキニルオキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>6</sub>～10アリールオキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシカルボニルアミノ基、置換基を有するスルホニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するアミノカルボニル基、メルカプト基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>3</sub>～8シクロアルキルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルケニルチオ基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>6</sub>～10アリールチオ基、無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルチオ基、（無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキル）チオカルボニル基、（無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルコキシ）チオカルボニル基、（無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキルチオ）カルボニル基、（無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキルチオ）チオカルボニル基、置換基を有するスルフィニル基、置換基を有するスルホニル基、ペンタフルオロスルファニル基、トリC<sub>1</sub>～6アルキル置換シリル基、トリC<sub>6</sub>～10アリール置換シリル基、シアノ基、ニトロ基、またはハロゲン原子を示す。

C<sub>y</sub><sup>1</sup>上のR<sup>10</sup>またはR<sup>11</sup>は、それぞれの中で、または相互に、またはC<sub>y</sub><sup>1</sup>上で結合する原子と一緒に環を形成してもよく、C<sub>y</sub><sup>2</sup>上のR<sup>20</sup>またはR<sup>21</sup>は、それぞれの中で、または相互に、またはC<sub>y</sub><sup>2</sup>上で結合する原子と一緒に環を形成してもよい。

[0055] mは、R<sup>10</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数、好ましくは1である。  
mが2以上のとき、R<sup>10</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

nは、R<sup>11</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数、好ましくは1である。  
nが2以上のとき、R<sup>11</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

[0056] pは、R<sup>20</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数、好ましくは1である。  
pが2以上のとき、R<sup>20</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

rは、R<sup>21</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数、好ましくは1である。

$r$  が 2 以上のとき、 $R^{21}$  同士は互いに同一でも異なってもよい。

[0057]  $R^{10}$ 等における「無置換の若しくは置換基を有する C 1～6 アルキル基」としては、前記  $R^{1a}$ 等において例示したそれと同じものを挙げることができる。

さらに「無置換の若しくは置換基を有する C 1～6 アルキル基」としては、前記  $R^{1a}$ 等において例示したもの以外にも、クロロシクロヘキシルオキシメチル基、ブromoシクロヘキシルオキシメチル基、2-メチルシクロプロピルオキシメチル基、2, 3-ジメチルシクロプロピルオキシメチル基、スピロ [2. 2] ペンター 1-イルオキシメチル基、1-メチルースピロ [2. 2] ペンター 1-イルオキシメチル基、1-ヒドロキシメチルスピロ [2. 2] ペンター 1-イルオキシメチル基、4, 4-ジフルオロースピロ [2. 2] ペンター 1-イルオキシメチル基、ビスシクロプロピル-2-イル基オキシメチル基などの置換基を有する C 3～8 シクロアルコキシ C 1～6 アルキル基； クロロシクロヘキシルメトキシメチル基、ブromoシクロヘキシルメトキシメチル基、2-メチルシクロプロピルメトキシメチル基、2, 3-ジメチルシクロプロピルメトキシメチル基、スピロ [2. 2] ペンター 1-イルメトキシメチル基、1-メチルースピロ [2. 2] ペンター 1-イルメトキシメチル基、1-ヒドロキシメチルスピロ [2. 2] ペンター 1-イルメトキシメチル基、4, 4-ジフルオロースピロ [2. 2] ペンター 1-イルメトキシメチル基、ビスシクロプロピル-2-イル基メトキシメチル基などの置換基を有する C 3～8 シクロアルキル C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基； などが挙げられる。

[0058]  $R^{10}$ 等における「C 3～8 シクロアルキル基」としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基などが挙げられる。

$R^{10}$ 等における「置換基を有する C 3～8 シクロアルキル基」としては、クロロシクロヘキシル基、ブromoシクロヘキシル基、2-メチルシクロプロピル基、2, 3-ジメチルシクロプロピル基、スピロ [2. 2] ペンター 1-イル基、1-メチルースピロ [2. 2] ペンター 1-イル基、1-ヒドロキ

シメチルスピロ [2, 2] ペンター 1-イル基、4, 4-ジフルオロスピロ [2, 2] ペンター 1-イル基、ビスクロプロピル-2-イル基などが挙げられる。

- [0059]  $R^{10}$ 等における「C 2～6 アルケニル基」としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基などが挙げられる。

$R^{10}$ 等における「置換基を有する C 2～6 アルケニル基」としては、2-クロロ-1-プロペニル基、2-フルオロ-1-ブテニル基などの C 2～6 ハロアルケニル基；などが挙げられる。

- [0060]  $R^{10}$ 等における「C 2～6 アルキニル基」としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、2-メチル-3-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などが挙げられる。

$R^{10}$ 等における「置換基を有する C 2～6 アルキニル基」としては、4, 4-ジクロロ-1-ブチニル基、4-フルオロ-1-ペンチニル基、5-ブロモ-2-ペンチニル基などの C 2～6 ハロアルキニル基；などが挙げられる。

- [0061]  $R^{10}$ 等における「C 1～6 アルコキシ基」としては、メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、*i*-プロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*s*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、*n*-ペンチルオキシ基、*i*-ペンチルオキシ基、2-メチルブトキシ基、ネオペンチル基、*n*-ヘキシルオキシ基などが挙げられる。これらのアルコキシ基のうち、C 3～6 アルコキシ基

が好ましい。

R<sup>10</sup>等における「置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルコキシ基」としては、フル  
 オロメトキシ基、クロロメトキシ基、ブロモメトキシ基、ジフルオロメトキシ  
 基、ジクロロメトキシ基、ジブロモメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、  
 2, 2, 2-トリクロロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、  
 シ基、4-フルオロブトキシ基、3, 3, 3-トリフルオロブトキシ基、  
 2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエトキシ基、パーフル  
 オロヘキシルオキシ基などのC<sub>1</sub>～6ハロアルコキシ基； 2-ヒドロキシ  
 エトキシ基、2-ヒドロキシプロポキシ基などのヒドロキシC<sub>1</sub>～6アルコ  
 キシ基； メトキシメトキシ基、1-メトキシエトキシ基、2-メトキシエ  
 トキシ基、エトキシメトキシ基、1-エトキシエトキシ基、2-エトキシエ  
 トキシ基、1-メトキシ-*n*-プロポキシ基、2-メトキシ-*n*-プロポキシ  
 基、3-メトキシ-*n*-プロポキシ基などのC<sub>1</sub>～6アルコキシC<sub>1</sub>～6  
 アルコキシ基； シクロプロピルメトキシ基、シクロブチルメトキシ基、シ  
 クロペンチルメトキシ基、シクロヘキシルメトキシ基、2-メチルシクロブ  
 テルメトキシ基、2, 3-ジメチルシクロプロピルメトキシ基、2-シク  
 ロプロピルエトキシ基などのC<sub>3</sub>～8シクロアルキルC<sub>1</sub>～6アルコキシ基  
 ； ペンジルオキシ基、フェニルオキシ基などのC<sub>7</sub>～11アラルキルオキ  
 シ基； フェチルメトキシ基、2-フェチルエトキシ基などのC<sub>1</sub>～7アリ  
 ルC<sub>1</sub>～6アルコキシ基； シブノメトキシ基、2-シブノエトキシ基など  
 のシブノC<sub>1</sub>～6アルコキシ基； クロロシクロヘキシルメトキシ基、プロ  
 モシクロヘキシルメトキシ基、2-メチルシクロプロピルメトキシ基、2,  
 3-ジメチルシクロプロピルメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-イ  
 ルメトキシ基、1-メチル-2-プロピルメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-イ  
 ルメトキシ基、4-ヒドロキシメチル-2-プロピルメトキシ基、4,  
 4-ジフルオロ-2-プロピルメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-イ  
 ル-2-プロピルメトキシ基を有するC<sub>3</sub>～8シクロアル

キルC 1～6アルコキシ基；などが挙げられる。

- [0062] R<sup>10</sup>等における「C 3～8シクロアルコキシ基」としては、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、シクロヘキシルオキシ基、シクロヘプチルオキシ基などが挙げられる。

R<sup>10</sup>等における「置換基を有するC 3～8シクロアルキルオキシ基」としては、クロロシクロヘキシルオキシ基、ブロモシクロヘキシルオキシ基、2-メチルシクロプロピルオキシ基、2, 3-ジメチルシクロプロピルオキシ基、スピロ[2. 2]ペンター1-イルオキシ基、1-メチルースピロ[2. 2]ペンター1-イルオキシ基、1-ヒドロキシメチルスピロ[2. 2]ペンター1-イルオキシ基、4, 4-ジフルオロースピロ[2. 2]ペンター1-イルオキシ基、ビスシクロプロピル-2-イル基オキシなどが挙げられる。

- [0063] R<sup>10</sup>等における「C 2～6アルケニルオキシ基」としては、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、2-プロペニルオキシ基、1-ブテニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基、1-メチル-2-プロペニルオキシ基、2-メチル-2-プロペニルオキシ基、1-ペンテニルオキシ基、2-ペンテニルオキシ基、1-メチル-2-ブテニルオキシ基、2-メチル-2-ブテニルオキシ基、3-メチル-2-ブテニルオキシ基、1-ヘキセニルオキシ基、2-ヘキセニルオキシ基などが挙げられる。

R<sup>10</sup>等における「置換基を有するC 2～6アルケニルオキシ基」としては、2-クロロ-1-プロペニルオキシ基、3, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ基、2-フルオロ-1-ブテニルオキシ基などのC 2～6ハロアルケニルオキシ基；などが挙げられる。

- [0064] R<sup>10</sup>等における「C 2～6アルキニルオキシ基」としては、エチニルオキシ基、1-プロピニルオキシ基、2-プロピニルオキシ基、1-ブチニルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、3-ブチニルオキシ基、1-メチル-2-プロピニルオキシ基、2-メチル-3-ブチニルオキシ基、1-ペンチニルオキシ基、2-ペンチニルオキシ基、1-メチル-2-ブチニルオキシ基、2

ーメチルー 3-ペンチニルオキシ基、1-ヘキシニルオキシ基などが挙げられる。

R<sup>10</sup>等における「置換基を有する C 2~6 アルキニルオキシ基」としては、4, 4-ジクロロ-1-ブチニルオキシ基、4-フルオロ-1-ペンチニルオキシ基、5-ブロモ-2-ペンチニルオキシ基などの C 2~6 ハロアルキニルオキシ基；などが挙げられる。

[0065] R<sup>10</sup>等における「C 1~7 アシル基」としては、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ベンゾイル基などが挙げられる。

R<sup>10</sup>等における「置換基を有する C 1~7 アシル基」としては、クロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、4-クロロベンゾイル基などのハロゲン置換 C 1~7 アシル基；などが挙げられる。

[0066] R<sup>10</sup>等における「C 1~6 アルコキシカルボニル基」としては、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、i-プロポキシカルボニル基などが挙げられる。

R<sup>10</sup>等における「置換基を有する C 1~6 アルコキシカルボニル基」としては、シクロプロピルメトキシカルボニル基、シクロブチルメトキシカルボニル基、シクロペンチルメトキシカルボニル基、シクロヘキシルメトキシカルボニル基、2-メチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2, 3-ジメチルシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-クロロシクロプロピルメトキシカルボニル基、2-シクロプロピルエトキシカルボニル基などの C 3~8 シクロアルキル C 1~6 アルコキシカルボニル基；フルオロメトキシカルボニル基、クロロメトキシカルボニル基、ブロモメトキシカルボニル基、ジフルオロメトキシカルボニル基、ジクロロメトキシカルボニル基、ジブロモメトキシカルボニル基、トリフルオロメトキシカルボニル基、トリクロロメトキシカルボニル基、トリブロモメトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル基、ペンタフルオロエトキシカルボニル基、4-フルオロブトキシカルボニル基、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシカルボニル基、2, 2,

2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエトキシカルボニル基、パーフルオロヘキシルオキシカルボニル基などのC 1～6ハロアルコキシカルボニル基；ベンジルオキシカルボニル基、1-フェニルエトキシカルボニル基などのC 6～10ありリールC 1～6アルキルオキシカルボニル基；テトラヒドロフラン-2-イルメトキシカルボニル基、ピラゾリルメトキシカルボニル基、チアジアゾリルメトキシカルボニル基、ピリジルメトキシカルボニル基、ピリミジニルメトキシカルボニル基、ピリダジニルメトキシカルボニル基などのヘテロシクリルC 1～6アルコキシカルボニル基；などが挙げられる。

[0067] R<sup>10</sup>等における「C 3～8シクロアルキルオキシカルボニル基」としては、シクロプロピルオキシカルボニル基、シクロブトキシカルボニル基などが挙げられる。

[0068] R<sup>10</sup>等における「C 2～6アルケニルオキシカルボニル基」としては、エテニルオキシカルボニル基、2-プロペニルオキシカルボニル基、1-プロペニルオキシカルボニル基などが挙げられる。

R<sup>10</sup>等における「置換基を有するC 2～6アルケニルオキシカルボニル基」としては、1-メチル-2-プロペニルオキシカルボニル基、2-メチル-1-プロペニルオキシカルボニル基などが挙げられる。

[0069] R<sup>10</sup>等における「C 2～6アルキニルオキシカルボニル基」としては、エチニルオキシカルボニル基、プロパルギルオキシカルボニル基、2-ブチニルオキシカルボニル基などが挙げられる。

R<sup>10</sup>等における「置換基を有するC 2～6アルキニルオキシカルボニル基」としては、1-メチルプロパルギルオキシカルボニル基などが挙げられる。

[0070] R<sup>10</sup>等における「C 6～10アリールオキシカルボニル基」としては、フェニルオキシカルボニル基、ナフトキシカルボニル基などが挙げられる。

[0071] R<sup>10</sup>等における「ヘテロシクリルオキシカルボニル基」としては、ピリジルオキシカルボニル基、ピリダジニルオキシカルボニル基などが挙げられる。

[0072] R<sup>10</sup>等における「C 1～7アシルオキシ基」としては、ホルミルオキシ基、

アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基などが挙げられる。

R<sup>10</sup>等における「置換基を有するC 1～7アシルオキシ基」としては、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、トリクロロアセチルオキシ基、4-クロロベンゾイルオキシ基などのハロゲン置換C 1～7アシルオキシ基；などが挙げられる。

[0073] R<sup>10</sup>等における「C 1～6アルコキシカルボニルオキシ基」としては、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、i-プロポキシカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0074] R<sup>10</sup>等における「C 3～8シクロアルキルオキシカルボニルオキシ基」としては、シクロプロピルオキシカルボニルオキシ基、シクロブチルオキシカルボニルオキシ基、シクロペンチルオキシカルボニルオキシ基、シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0075] R<sup>10</sup>等における「C 2～6アルケニルオキシカルボニルオキシ基」としては、ビニルオキシカルボニルオキシ基、1-プロペニルオキシカルボニルオキシ基、2-プロペニルオキシカルボニルオキシ基、1-ブテニルオキシカルボニルオキシ基、2-ブテニルオキシカルボニルオキシ基、3-ブテニルオキシカルボニルオキシ基、1-メチル-2-プロペニルオキシカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0076] R<sup>10</sup>等における「C 2～6アルキニルオキシカルボニルオキシ基」としては、エチニルオキシカルボニルオキシ基、1-プロピニルオキシカルボニルオキシ基、2-プロピニルオキシカルボニルオキシ基、1-ブチニルオキシカルボニルオキシ基、2-ブチニルオキシカルボニルオキシ基、3-ブチニルオキシカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0077] R<sup>10</sup>等における「C 1～6アルキルアミノカルボニルオキシ基」としては、メチルアミノカルボニルオキシ基、ジメチルアミノカルボニルオキシ基、ジエチルアミノカルボニルオキシ基、i-プロピルアミノカルボニルオキシ基、i-ブチルアミノカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0078] R<sup>10</sup>等における「C 3～8シクロアルキルアミノカルボニルオキシ基」として

は、シクロプロピルアミノカルボニルオキシ基、シクロブチルアミノカルボニルオキシ基、シクロペンチルアミノカルボニルオキシ基、シクロヘキシルアミノカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0079]  $R^{10}$ 等における「C 2～6 アルケニルアミノカルボニルオキシ基」としては、ビニルアミノカルボニルオキシ基、1-プロペニルアミノカルボニルオキシ基、2-プロペニルアミノカルボニルオキシ基、1-ブテニルアミノカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0080]  $R^{10}$ 等における「C 2～6 アルキニルアミノカルボニルオキシ基」としては、エチニルアミノカルボニルオキシ基、1-プロピニルアミノカルボニルオキシ基、2-プロピニルアミノカルボニルオキシ基、1-ブチニルアミノカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0081]  $R^{10}$ 等における「C 6～10 アリールアミノカルボニルオキシ基」としては、アニリノカルボニルオキシ基、ナフチルアミノカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0082]  $R^{10}$ 等における「ヘテロシクリルアミノカルボニルオキシ基」としては、ピリジルアミノカルボニルオキシ基、ピリダジニルアミノカルボニルオキシ基などが挙げられる。

[0083]  $R^{10}$ 等における「置換基を有するアミノオキシ基」としては、メチルアミノオキシ基、エチルアミノオキシ基などのC 1～6 アルキルアミノオキシ基；ホルミルアミノオキシ基、アセチルアミノオキシ基などのC 1～7 アシルアミノオキシ基；などが挙げられる。

[0084]  $R^{10}$ 等における「C 1～6 アルキリデンアミノオキシ基」としては、メチリデンアミノオキシ基、エチリデンアミノオキシ基、n-プロピリデンアミノオキシ基、i-プロピリデンアミノオキシ基、n-ブチリデンアミノオキシ基、i-ブチリデンアミノオキシ基、s-ブチリデンアミノオキシ基などが挙げられる。

[0085]  $R^{10}$ 等における「C 6～10 アリール基」としては、前記C y'等において例示したそれと同じものを挙げるができる。

- [0086] R<sup>10</sup>等における「ヘテロシクリル基」としては、前記C<sub>y</sub><sup>1</sup>等において例示したそれと同じものを挙げることができる。
- [0087] R<sup>10</sup>等における「C<sub>6</sub>～10アリールオキシ基」としては、フェノキシ基、ナフトキシ基などが挙げられる。
- [0088] R<sup>10</sup>等における「ヘテロシクリルオキシ基」としては、ピリジルオキシ基、ピリダジニルオキシ基などが挙げられる。
- [0089] R<sup>10</sup>等における「置換基を有するスルホニルオキシ基」としては、メチルスルホニルオキシ基、エチルスルホニルオキシ基などのC<sub>1</sub>～6アルキルスルホニルオキシ基；トリフルオロメチルスルホニルオキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニルオキシ基などのC<sub>1</sub>～6ハロアルキルスルホニルオキシ基；フェニルスルホニルオキシ基などのC<sub>6</sub>～10アリールスルホニルオキシ基；などが挙げられる。
- [0090] R<sup>10</sup>等における「C<sub>1</sub>～6アルキルアミノ基」としては、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、i-ブチルアミノ基などが挙げられる。
- [0091] R<sup>10</sup>等における「C<sub>3</sub>～8シクロアルキルアミノ基」としては、シクロプロピルアミノ基、シクロブチルアミノ基、シクロペンチルアミノ基、シクロヘキシルアミノ基などが挙げられる。
- [0092] R<sup>10</sup>等における「C<sub>2</sub>～6アルケニルアミノ基」としては、ビニルアミノ基、1-プロペニルアミノ基、2-プロペニルアミノ基、1-ブテニルアミノ基などが挙げられる。
- [0093] R<sup>10</sup>等における「C<sub>2</sub>～6アルキニルアミノ基」としては、エチニルアミノ基、1-プロピニルアミノ基、2-プロピニルアミノ基、1-ブチニルアミノ基などが挙げられる。
- [0094] R<sup>10</sup>等における「C<sub>6</sub>～10アリールアミノ基」としては、アニリノ基、ナフチルアミノ基などが挙げられる。
- [0095] R<sup>10</sup>等における「ヘテロシクリルアミノ基」としては、ピリジルアミノ基、ピリダジニルアミノ基などが挙げられる。

- [0096] R<sup>10</sup>等における「置換基を有するヒドロキシアミノ基」としては、メトキシアミノ基、エトキシアミノ基等のC 1～6アルコキシアミノ基； アセトキシアミノ基、プロピオニルオキシアミノ基等のC 1～7アシルオキシアミノ基； などが挙げられる。
- [0097] R<sup>10</sup>等における「C 1～7アシルアミノ基」としては、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、プロパノイルアミノ基、ブチリルアミノ基、i-プロピルカルボニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基などが挙げられる。
- [0098] R<sup>10</sup>等における「C 1～6アルコキシカルボニルアミノ基」としては、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、n-プロポキシカルボニルアミノ基、i-プロポキシカルボニルアミノ基などが挙げられる。
- [0099] R<sup>10</sup>等における「C 2～6アルケニルオキシカルボニルアミノ基」としては、ビニルアミノカルボニルアミノ基、1-プロペニルアミノカルボニルアミノ基、2-プロペニルアミノカルボニルアミノ基、1-ブテニルアミノカルボニルアミノ基などが挙げられる。
- [0100] R<sup>10</sup>等における「C 2～6アルキニルオキシカルボニルアミノ基」としては、エチニルアミノカルボニルアミノ基、1-プロピニルアミノカルボニルアミノ基、2-プロピニルアミノカルボニルアミノ基、1-ブチニルアミノカルボニルアミノ基などが挙げられる。
- [0101] R<sup>10</sup>等における「C 6～10アリールオキシカルボニルアミノ基」としては、アニリノカルボニルアミノ基、ナフチルアミノカルボニルアミノ基などが挙げられる。
- [0102] R<sup>10</sup>等における「ヘテロシクリルオキシカルボニルアミノ基」としては、ピリジルアミノカルボニルアミノ基、ピリダジニルアミノカルボニルアミノ基などが挙げられる。
- [0103] R<sup>10</sup>等における「置換基を有するスルホニルアミノ基」としては、メチルスルホニルオキシ基、エチルスルホニルアミノ基などのC 1～6アルキルスルホニルアミノ基； トリフルオロメチルスルホニルアミノ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニルアミノ基などのC 1～6ハロアルキルスルホニ

ルアミノ基； フェニルスルホニルアミノ基などのC 6 ～ 1 0 アリールスルホニルアミノ基； などが挙げられる。

[0104] R<sup>10</sup>等における「置換基を有するアミノカルボニル基」としては、ジメチルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、N-フェニル-N-メチルアミノカルボニル基などが挙げられる。

[0105] R<sup>10</sup>等における「C 1 ～ 6 アルキルチオ基」としては、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、i-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、i-ブチルチオ基、s-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基などが挙げられる。

[0106] R<sup>10</sup>等における「C 3 ～ 8 シクロアルキルチオ基」としては、シクロプロピルチオ基、シクロブチルチオ基、シクロペンチルチオ基、シクロヘキシルチオ基、シクロヘプチルチオ基などが挙げられる。

[0107] R<sup>10</sup>等における「C 2 ～ 6 アルケニルチオ基」としては、ビニルチオ基、1-プロペニルチオ基、2-プロペニルチオ基、1-ブテニルチオ基、2-ブテニルチオ基、3-ブテニルチオ基などが挙げられる。

[0108] R<sup>10</sup>等における「C 2 ～ 6 アルキニルチオ基」としては、エチニルチオ基、1-プロピニルチオ基、2-プロピニルチオ基、1-ブチニルチオ基、2-ブチニルチオ基、3-ブチニルチオ基などが挙げられる。

[0109] R<sup>10</sup>等における「C 6 ～ 1 0 アリールチオ基」としては、フェニルチオ基、ナフチルチオ基などが挙げられる。

[0110] R<sup>10</sup>等における「ヘテロシクリルチオ基」としては、ピリジルチオ基、ピリダジニルチオ基などが挙げられる。

[0111] R<sup>10</sup>等における「(C 1 ～ 6 アルキル) チオカルボニル基」としては、メチル(チオカルボニル)基、エチル(チオカルボニル)基、n-プロピル(チオカルボニル)基、i-プロピル(チオカルボニル)基、n-ブチル(チオカルボニル)基、i-ブチル(チオカルボニル)基、s-ブチル(チオカルボニル)基、t-ブチル(チオカルボニル)基などが挙げられる。

[0112] R<sup>10</sup>等における「(C 1 ～ 6 アルコキシ) チオカルボニル基」としては、メ

トキシ（チオカルボニル）基、エトキシ（チオカルボニル）基、*n*-プロポキシ（チオカルボニル）基、*i*-プロポキシ（チオカルボニル）基、*n*-ブトキシ（チオカルボニル）基、*i*-ブトキシ（チオカルボニル）基、*s*-ブトキシ（チオカルボニル）基、*t*-ブトキシ（チオカルボニル）基などが挙げられる。

[0113]  $R^{10}$ 等における「（C 1～6アルキルチオ）カルボニル基」としては、（メチルチオ）カルボニル基、（エチルチオ）カルボニル基、（*n*-プロピルチオ）カルボニル基、（*i*-プロピルチオ）カルボニル基、（*n*-ブチルチオ）カルボニル基、（*i*-ブチルチオ）カルボニル基、（*s*-ブチルチオ）カルボニル基、（*t*-ブチルチオ）カルボニル基などが挙げられる。

[0114]  $R^{10}$ 等における「（C 1～6アルキルチオ）チオカルボニル基」としては、（メチルチオ）チオカルボニル基、（エチルチオ）チオカルボニル基、（*n*-プロピルチオ）チオカルボニル基、（*i*-プロピルチオ）チオカルボニル基、（*n*-ブチルチオ）チオカルボニル基、（*i*-ブチルチオ）チオカルボニル基、（*s*-ブチルチオ）チオカルボニル基、（*t*-ブチルチオ）チオカルボニル基などが挙げられる。

[0115]  $R^{10}$ 等における「置換基を有するスルフィニル基」としては、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基などのC 1～6アルキルスルフィニル基；トリフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル基などのC 1～6ハロアルキルスルフィニル基；フェニルスルフィニル基などのC 6～10アリールスルフィニル基；などが挙げられる。

[0116]  $R^{10}$ 等における「置換基を有するスルホニル基」としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基などのC 1～6アルキルスルホニル基；トリフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル基などのC 1～6ハロアルキルスルホニル基；フェニルスルホニル基などのC 6～10アリールスルホニル基；メトキシスルホニル基、エトキシスルホニル基などのC 1～6アルコキシスルホニル基；などが挙げられる。

[0117]  $R^{10}$ 等における「トリC 1～6アルキル置換シリル基」としては、トリメチ

ルシリル基、トリエチルシリル基、*t*-ブチルジメチルシリル基などが挙げられる。

[0118]  $R^{10}$ 等における「トリC6~10アリアル置換シリル基」としては、トリフェニルシリル基などが挙げられる。

[0119]  $R^{10}$ 等における「ハロゲン原子」としては、塩素原子、臭素原子、フッ素原子、ヨウ素原子が挙げられる。

[0120]  $Cy^1$ 上の $R^{10}$ または $R^{11}$ は、それぞれの中で、または相互に、または $Cy^1$ 上で結合する原子と一緒に環を形成してもよく、 $Cy^2$ 上の $R^{20}$ または $R^{21}$ は、それぞれの中で、または相互に、または $Cy^2$ 上で結合する原子と一緒に環を形成してもよい。

形成してもよい環としては、ベンゼン環などの芳香族炭化水素環； シクロペンテン環、シクロヘキセン環、シクロヘプテン環などのC5~7シクロアルケン環； フラン環、チオフェン環、ピロール環、イミダゾール環、ピラゾール環、チアゾール環、オキサゾール環、イソオキサゾール環、ピリジン環、ピラジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、アゼピン環、ジアゼピン環などの芳香族5~7員ヘテロ環； ジヒドロ-2H-ピラン環、ジヒドロ-2H-チオピラン環、テトラヒドロピリジン環などの不飽和5~7員ヘテロ環； などが挙げられる。

これらの環は、環上に置換基を有していてもよい。

置換基となり得る基としては、 フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子などのハロゲン原子； メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*s*-ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基などのC1~6アルキル基； シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基などのC3~6シクロアルキル基； メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、*i*-プロポキシ基、*n*-ブトキシ基、*s*-ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基などのC1~6アルコキシ基； 水酸基； クロロメチル基、クロロエチル基、トリフルオロメチル基、1, 2-ジクロロ-*n*-プロピル基、

1-フルオロ-n-ブチル基、パーフルオロ-n-ペンチル基などのC1~6ハロアルキル基；などを挙げることができる。

[0121] 式(I)において、R<sup>10</sup>は、C1~6アルキル基、C1~6アルコキシC1~6アルキル基、C1~6アルコキシC1~6アルコキシC1~6アルキル基、C2~6アルケニル基、水酸基、C1~6アルコキシ基、C1~6ハロアルコキシ基、C3~8シクロアルコキシ基、C2~6アルケニルオキシ基、C2~6ハロアルケニルオキシ基、C2~6アルキニルオキシ基、C2~6ハロアルキニルオキシ基、C1~6アルコキシC1~6アルコキシ基、C3~8シクロアルキルC1~6アルコキシ基、シアノC1~6アルコキシ基、C1~7アシルC1~6アルコキシ基、ヒドロキシC1~6アルコキシ基、C1~7アシルオキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基、C2~6アルケニルオキシカルボニル基、C2~6アルキニルオキシカルボニル基、C1~6アルコキシカルボニルオキシ基、C1~6アルキルアミノカルボニルオキシ基、C6~10アリール基、ヘテロシクリル基、C1~6ハロアルキルスルホニルオキシ基、C1~6アルキリデンアミノオキシ基、C1~6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC7~11アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC7~11アラルキルオキシ基、C1~6アルキルチオ基、またはニトロ基であることが好ましい。

式(I)において、R<sup>11</sup>は、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C1~6ハロアルキル基、C2~6ハロアルケニル基、またはC2~6ハロアルキニル基であることが好ましい。

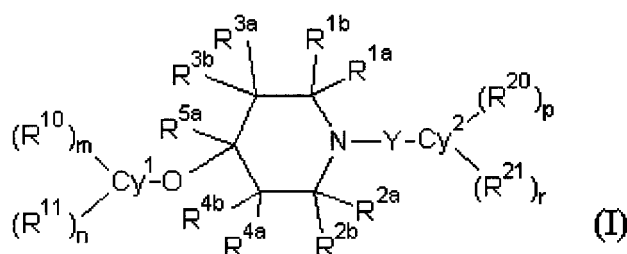
[0122] 式(I)において、R<sup>20</sup>は、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C1~6ハロアルキル基、C2~6ハロアルケニル基、またはC2~6ハロアルキニル基であることが好ましい。

式(I)において、R<sup>21</sup>は、C1~6アルキル基、C1~6アルコキシC1~6アルキル基、C1~6アルコキシC1~6アルコキシC1~6アルキル基、水酸基、C1~6アルコキシ基、C1~6ハロアルコキシ基、C2~6ハロアルケニルオキシ基、C2~6ハロアルキニルオキシ基、C1~6アル

コキシC 1～6アルコキシ基、C 3～8シクロアルキルC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、C 2～6アルケニルオキシカルボニル基、C 2～6アルキニルオキシカルボニル基、C 1～6アルキリデンアミノオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11アラルキルオキシ基、またはニトロ基であることが好ましい。

[0123] 式 (I) 中の Y は、酸素原子または硫黄原子を示す。

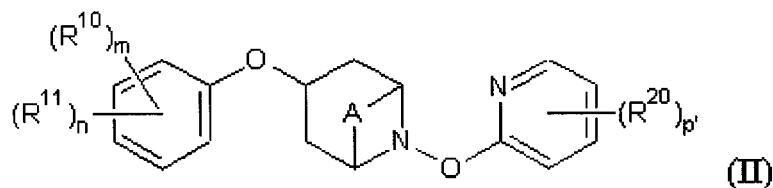
[化8]



[0124] 本発明に係る環状アミン化合物は、Cy<sup>1</sup>がフェニル基であり； Cy<sup>2</sup>がピリジン-2-イル基であり； R<sup>1b</sup>、R<sup>2b</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup>、R<sup>4a</sup>、R<sup>4b</sup>、およびR<sup>5a</sup>が水素原子であり； R<sup>1a</sup>とR<sup>2a</sup>は、それらが一緒になってなる、無置換の若しくは置換基を有するC 3～6アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～6アルケニレン基、式：-CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>-で表される基、式：-CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>-で表される基、式：-CH<sub>2</sub>C(=O)CH<sub>2</sub>-で表される基、または式：-CH<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>CH<sub>2</sub>-で表される基（ただし、R<sup>6</sup>は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシル基、または無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。）であり； Yは酸素原子である； rはゼロであり； 且つ pは0～4のいずれかの整数であることが好ましい。すなわち、本発明に係る環状アミン化合物として、好ましいものは、式 (I) で表される環状アミン化合物である。

[0125]

[化9]



[0126] なお、式 (II) 中の、 $R^{10}$ 、 $m$ 、 $R^{11}$ 、 $n$ 、および  $R^{20}$  は、式 (I) におけるそれらと同じ意味を示す。式 (II) 中の  $p'$  は、 $R^{20}$  の数を示し且つ 0～4 のいずれかの整数である。 $p'$  が 2 以上のとき、 $R^{20}$  同士は互いに同一であっても異なってもよい。式 (II) 中の A は、無置換の若しくは置換基を有する C 3～6 アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有する C 3～6 アルケニレン基、式： $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$  で表される基、式： $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$  で表される基、式： $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$  で表される基、または式： $-\text{CH}_2\text{NR}^6\text{CH}_2-$  で表される基（ただし、 $R^6$  は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有する C 1～6 アルキル基、無置換の若しくは置換基を有する C 1～7 アシル基、または無置換の若しくは置換基を有する C 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。）を示す。

[0127] 〔環状アミン化合物の塩〕

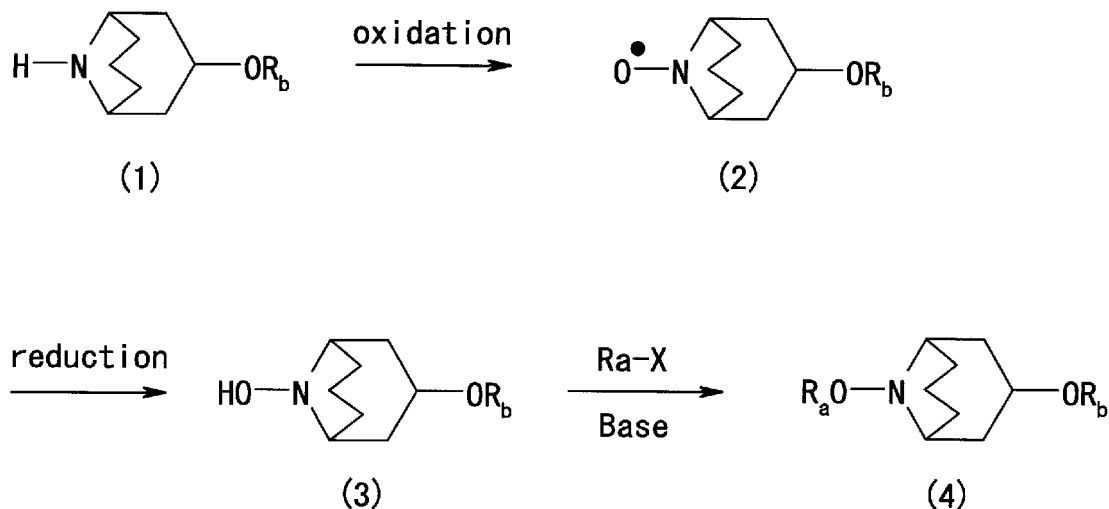
本発明に係る環状アミン化合物の塩は、農園芸学的に許容される塩であれば、特に制限されない。例えば、塩酸、硫酸などの無機酸の塩；酢酸、乳酸などの有機酸の塩；リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属の塩；カルシウム、マグネシウムなどのアルカリ土類金属の塩；鉄、銅などの遷移金属の塩；アンモニア、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ヒドラジンなどの有機塩基の塩などが挙げられる。本発明に係る環状アミン化合物の塩は、式 (I) または式 (II) で表わされる環状アミン化合物から、公知の手法によって得ることができる。

[0128] 〔製造方法〕

本発明に係る環状アミン化合物またはその塩の製造方法は、特に制限されない。

まず、Yが酸素原子である場合の本発明に係るヒドロキシアミン化合物の製法を説明する。Yが酸素原子である場合、下記の式(3)で表される化合物を中間体として経る製造方法が好ましい。

[0129] [化10]



[0130] 先ず、式(1)で表される2級アミン化合物(以下、「化合物(1)」ということがある。)を用意する。そして、該化合物(1)を適当な酸化剤により酸化することによって式(2)で表されるアミノキシル化合物(以下、「化合物(2)」ということがある。)を得ることができる。この酸化反応方法の具体例としては、無水または含水のメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノールなどのアルコール溶媒、ジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)などのエーテル類、アセトニトリル、など適当な溶媒中で、過酸化水素、次亜塩素酸ナトリウム、有機系酸化剤などの酸化剤を作用させる方法、タングステン酸塩-尿素過酸化水素錯体を作用させる方法などを具体的に挙げることができる。また、酸素あるいはオゾンなどの活性酸素を含有する気体を反応混合物中に吹き込む方法を挙げることができる。

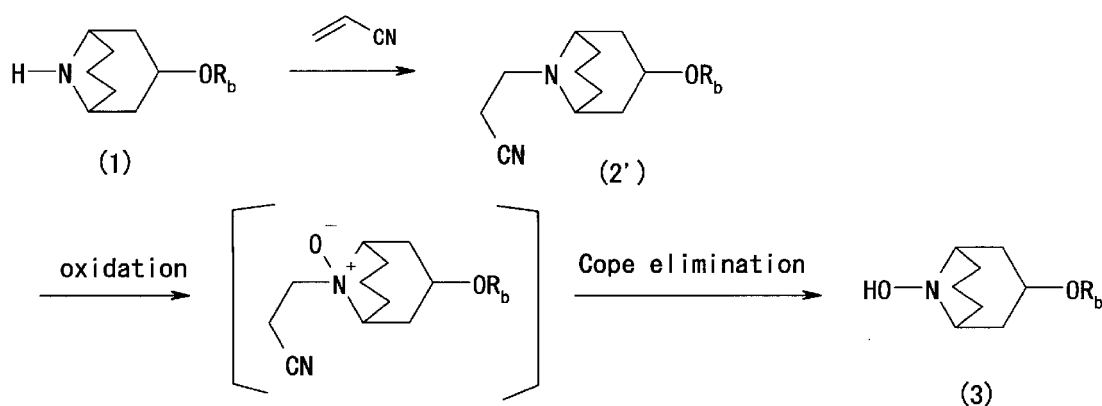
[0131] 次に、化合物(2)を適当な条件下で還元して、アミノキシル基をヒドロキシアミノ基に変換する。この還元反応によって式(3)で表わされるヒドロキシアミン化合物(以下、「化合物(3)」ということがある。)が生成する。

該還元反応に引き続き、化合物（３）にヘテロシクリルハライドを塩基の存在下で反応させる。これによって、式（４）で表されるヘテロシクリルオキシアミン化合物を得ることができる。この反応は米国特許５２８６８６５号公報などに記載されている。

なお、上記式（１）～（４）中、 $R_b$ は置換基を有するフェニル基を示し、 $R_a$ は置換基を有するヘテロシクリル基を示し、 $X$ はハロゲン原子を示す。

[0132] また、化合物（３）は、例えば、以下に示す製造方法によって得ることができる。

[0133] [化11]

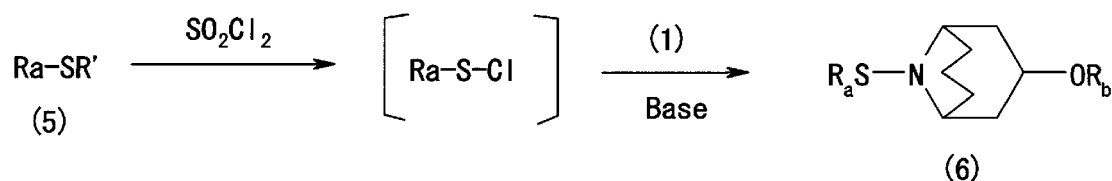


[0134] 前記の化合物（１）を、アクリロニトリルにて、 $N$ -アルキル化することによって式（２'）で表されるアルキルアミノ化合物（以下、「化合物（２'）」ということがある。）を得る。続いて、適当な酸化剤により酸化することによって、系中で、 $N$ -オキシド体とし、これを、Cope脱離反応を行うことで、化合物（３）を得ることができる。この反応はTetrahedron Letters 48（2007）1683-1686などに記載されている。

[0135] 一方、 $Y$ が硫黄原子である場合の本発明に係る環状アミン化合物は、例えば、以下に示す製造方法によって得ることができる。

[0136]

[化12]



[0137] 先ず、式（５）で表されるスルフェニル化合物（以下、「化合物（５）」ということがある。）を用意する（式中、 $\text{R}'$  は水素原子またはベンジル基を示す）。これに塩化スルフリルを反応させて塩化スルフェニル化合物を得、続いて塩基の存在下で化合物（１）を反応させことで、式（６）で表されるヘテロシクリルチオキシアミン化合物を得ることができる。塩化スルフェニル化合物の製造方法は *Synthesis* 1994; volume 1994 (1): 21-22 などに記載されている。

[0138] [ヒドロキシアミン化合物]

本発明に係るヒドロキシアミン化合物は、式（III）で表わされる化合物である。また本発明に係るヒドロキシアミン化合物の塩は、式（III）で表される化合物の塩である。式（III）で表わされる化合物またはその塩は、式（I）または式（II）で表される化合物またはその塩の製造中間体として好適である。

[0139] 式（III）中、 $\text{Cy}^1$ 、 $\text{R}^{10}$ 、 $\text{R}^{11}$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $\text{R}^{1a}$ 、 $\text{R}^{1b}$ 、 $\text{R}^{2a}$ 、 $\text{R}^{2b}$ 、 $\text{R}^{3a}$ 、 $\text{R}^{3b}$ 、 $\text{R}^{4a}$ 、 $\text{R}^{4b}$ 、および $\text{R}^{5a}$ は、式（I）におけるそれらと同じ意味を示す。

式（III）中の $\text{R}^{1a}$ と $\text{R}^{2a}$ または $\text{R}^{3a}$ と $\text{R}^{4a}$ は、無置換の若しくは置換基を有する $\text{C}3\sim6$ アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有する $\text{C}3\sim6$ アルケニレン基、式： $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ で表される基、式： $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ で表される基、式： $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ で表される基、または式： $-\text{CH}_2\text{NR}^6\text{CH}_2-$ で表される基（ただし、 $\text{R}^6$ は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有する $\text{C}1\sim6$ アルキル基、無置換の若しくは置換基を有する $\text{C}1\sim7$ アシル基、または無置換の若しくは置換基を有する $\text{C}1\sim6$ アルコキシカルボニル基を示す。）を形成している。当該２価の有機基としては、式（I）にお

けるものと同じものを挙げるができる。

[0140] 式 (III) 中、 $Cy^1$ が、フェニル基、ピラゾリル基、チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、またはピリダジニル基であることが好ましい。

[0141] 式 (III) 中の  $R^{10}$ は、C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6アルコキシC 1～6アルキル基、C 2～6アルケニル基、水酸基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 3～8シクロアルコキシ基、C 2～6アルケニルオキシ基、C 2～6ハロアルケニルオキシ基、C 2～6アルキニルオキシ基、C 2～6ハロアルキニルオキシ基、C 1～6アルコキシC 1～6アルコキシ基、C 3～8シクロアルキルC 1～6アルコキシ基、シアノC 1～6アルコキシ基、C 1～7アシルC 1～6アルコキシ基、ヒドロキシC 1～6アルコキシ基、C 1～7アシルオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、C 2～6アルケニルオキシカルボニル基、C 2～6アルキニルオキシカルボニル基、C 1～6アルコキシカルボニルオキシ基、C 1～6アルキルアミノカルボニルオキシ基、C 6～10アリール基、ヘテロシクリル基、C 1～6ハロアルキルスルホニルオキシ基、C 1～6アルキリデンアミノオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11アラルキルオキシ基、C 1～6アルキルチオ基、またはニトロ基であることが好ましい。

式 (III) 中の  $R^{11}$ は、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C 1～6ハロアルキル基、C 2～6ハロアルケニル基、またはC 2～6ハロアルキニル基であることが好ましい。

[0142] 本発明に係るヒドロキシアミン化合物の塩は、塩基の存在下におけるヘテロシクリルハライドとの反応を阻害しないものであれば、特に制限されない。例えば、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩などのアルカリ金属塩が挙げられる。本発明に係るヒドロキシアミン化合物の塩は、式 (III) で表わされるヒドロキシアミン化合物から、公知の手法によって得ることができる。

[0143] 本発明の環状アミン化合物またはその塩は、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、および殺卵などの作用を有することから、農作物に付く害虫、ダニ、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫などの有害生物の防除に使用できる。

その代表例として、下記のものが挙げられる。

鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウワバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシンクイガ、ナシヒメシンクイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロピアンコーンボラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属、アグロティス属、イガ、コドリング、ワタアカミムシ等、

半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、シルバーリーフコナジラミ、ナシキジラミ、ナシグンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等、

甲虫目害虫、例えば、キスジノミハムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアブロティカ属、タバコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等、

双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチクバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、シナハマダラカ等、

アザミウマ目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等、

膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等

、

直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ等、

シロアリ目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等、

隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ、ネコノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、

植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イネシנגアレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等、そして、ダニ類である。

その中でも、本発明の環状アミン化合物またはその塩は、特にダニ類に対する防除効果に優れるので、殺ダニ剤の有効成分として有用である。

[0144] 防除の対象となるダニ類としては、

ハダニ科 (Tetranychidae) に属するダニ：ブドウヒメハダニ (*Brevipalpus lewisi*)、チャノヒメハダニ (*Brevipalpus obovatus*)、ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*)、クローバーハダニ (*Bryobia praetiosa*)、ニセクローバーハダニ (*Bryobia rubrioculus*)、パイナップルヒメハダニ (*Dolichotetranychus floridanus*)、アズハダニ (*Eotetranychus boreus*)、ミチノクハダニ (*Eotetranychus geniculatus*)、クリハダニ (*Eotetranychus pruni*)、コウノシロハダニ (*Eotetranychus sexmaculatus*)、スミスハダニ (*Eotetranychus smithi*)、クルマハダニ (*Eotetranychus uncatus*)、スギノハダニ (*Oligonychus hondoensis*)、チビコブハダニ (*Oligonychus ilicis*)、カラマツハダニ (*Oligonychus karamatus*)、イネハダニ (*Oligonychus shinkajii*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、クワオオハダニ (*Panonychus mori*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、カキヒメハダニ (*Tenuipalpus zhizhilashviliae*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、オウトウハダニ (*Tetranychus viennensis*)、ナミケナガハダニ (*Tuckerella pavoniformis*) など；

[0145] フシダニ科 (Eriophyidae) に属するダニ：チャノナガサビダニ (*Acaphylla theavagrans*)、カーネーションサビダニ (*Aceria paradianthi*)、チューリップサビダニ (*Aceria tulipae*)、トマトサビダニ (*Aculops lycopersici*)、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、モモサビダニ (*Aculus fockeui*)、リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、ブドウサビダニ (*Calepitrimerus vitis*)、ブドウハモグリダニ (*Colomerus vitis*)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)、クコフシダニ (*Eriophes kuko*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*) など；

[0146] コナダニ科 (Astigmata) に属するダニ：アシフトコナダニ (*Acarus siro*)、ムギコナダニ (*Aleuroglyphus ovatus*)、サトウダニ (*Carpoglyphus lactis*)、コウノホシカダニ (*Lardoglyphus konoi*)、ネダニ (*Rhizoglyphus echinopus*)、ロビンネダニ (*Rhizoglyphus robini*)、ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、ハウレンソウケナガコナダニ (*Tyrophagus similis*) など；

ホコリダニ科 (Tarsonemidae) に属するダニ：シクラメンホコリダニ (*Phytionemus pallidus*)、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)、スジフトホコリダニ (*Tarsonemus bilobatus*)、アシボソホコリダニ (*Tarsonemus waitei*) など；

ハシリダニ科 (Eupodidae) に属するダニ：ハクサイダニ (*Penthaleus erythrocephalus*)、ムギダニ (*Penthaleus major*) など；

マダニ科 (Ixodidae) に属するダニ：フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis japonica*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、アミメカクマダニ (*Dermacentor reticulatus*)、タイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanensis*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツエマダニ (*Ixodes persulcatus*)、アミノカクマダニ (*Dermacentor reticulatus*) など  
を挙げることができる。

[0147] また、従来公知の殺ダニ剤に対して耐性を持つようになった耐性ダニ類を

挙げることができる。

本発明の環状アミン化合物またはその塩は、薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低く、特に安全性の高い化合物である。

[0148] [殺ダニ剤]

本発明の殺ダニ剤は、式 (I)、または式 (II) で表わされる環状アミン化合物またはその塩から選ばれる少なくとも 1 種を有効成分として含有するものである。本発明の殺ダニ剤では、式 (I)、または式 (II) で表わされる環状アミン化合物またはその塩を 1 種単独でまたは 2 種以上を組み合わせる含有することができる。

また、本発明の殺ダニ剤は、式 (I)、または式 (II) で表わされる環状アミン化合物またはその塩のみを含有するものであってもよいが、固体担体、液体担体、ガス状担体などの担体を含有していてもよい。また、本発明の殺ダニ剤は、式 (I)、または式 (II) で表わされる環状アミン化合物またはその塩を多孔セラミック板や不織布などの基材に含浸させたものであってもよい。さらに、必要に応じて界面活性剤、その他の補助剤を添加したものであってもよい。

本発明に係る殺ダニ剤は、一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤、フロアブル、エアゾール、煙霧剤、加熱蒸散剤、燻煙剤、毒餌、マイクロカプセルなどの形態に製剤化することができる。

[0149] 固体製剤にする際に使用される添加剤および担体としては、大豆粒、小麦粉などの植物性粉末；珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレイなどの鉱物性微粉末；安息香酸ソーダ、尿素、芒硝などの有機および無機化合物などが挙げられる。

液体製剤にする際に使用される溶剤としては、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサなどの石油留分；シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水などが挙げられる。

噴射剤に製剤化する際に使用されるガス状担体としては、ブタンガス、LPG、ジメチルエーテル、炭酸ガスなどが挙げられる。

[0150] 毒餌の基材としては、穀物粉、植物油、糖、結晶セルロースなどの餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸などの酸化防止剤、デヒドロ酢酸などの保存料、トウガラシ末などの子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料などの害虫誘引性香料などが挙げられる。

製剤化において均一かつ安定な形態をとり得るようにするために界面活性剤を添加することができる。界面活性剤としては、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテルなどの非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレン-無水マレイン酸の共重合体などが挙げられる。

[0151] 本発明の殺ダニ剤を農業用とする場合には、製剤中における本発明の環状アミン化合物またはその塩の含有量を、0.01～90重量%にすることが好ましく、0.05～85重量%にすることがより好ましい。

水和剤、乳剤、懸濁剤、フロアブル剤、水溶剤または顆粒水和剤の形態で供給された農業用殺ダニ剤は、水で所定の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液にして植物或いは土壤に散布することができる。また、粉剤・粒剤の形態で供給された農業用殺ダニ剤は、そのまま植物或いは土壤に散布することができる。

[0152] また、乳剤、水和剤、フロアブル剤などの形態で供給された防疫用殺ダニ剤は、水で所定の濃度に希釈して施用することができる。また油剤、エアゾール、煙霧剤、毒餌、防ダニシートなどの形態で供給された防疫用殺ダニ剤はそのまま使用することができる。

[0153] 本発明の殺ダニ剤を、ウシ、ブタなどの家畜類、イヌ、ネコなどのペット類の動物寄生ダニ防除用とする場合には、宿主動物 1 k g に対して、本発明の環状アミン化合物が、0. 0 1 ~ 1 0 0 0 m g の割合となる量で使用する事ができる。

動物寄生ダニ防除用殺ダニ剤は、公知の獣医学的な手法で施用することができる。その方法として、例えば、全身的抑制 (systemic control) を目的とする場合には、錠剤、カプセル、浸漬液、飼料混入、坐薬、注射 (筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内など) などにより動物に投与する方法などが挙げられ、非全身的抑制 (non-systemic control) を目的とする場合は、油性または水性液剤を噴霧、注ぎかけ (pour-on) 、滴下 (spot-on) などにより投与する方法、樹脂に殺ダニ剤を練り込み、該混練物を首輪、耳札などの適当な形状に成形し、それを動物に装着する方法などが挙げられる。

[0154] 本発明の殺ダニ剤は、殺菌剤、他の殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、植物調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料などと混用または併用してもよい。

本発明化合物と混合して使用できる殺菌剤、他の殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、植物生長調節剤の代表例を以下に示す。

[0155] 殺菌剤：

1) ベンゾイミダゾール系：ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオファネート メチルなど；

2) ジカルボキシイミド系：クロゾリネート、イプロジオン、プロシミドン、ビンクロゾリンなど；

3) D M I -殺菌剤系：イマザリル、オキシポコナゾール、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール、トリホリン、ピリフェノックス、フェナリモル、ヌアリモル、アザコナゾール、ビテルタノール、ブロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イプコナゾール

、メトコナゾール、ミクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、エタコナゾール、ファーコナゾールシスなど；

4) フェニルアミド系：ベナラキシル、フララキシル、メタラキシル、メタラキシルーM、オキサジキシル、オフラセなど；

5) アミン系：アルジモルフ、ドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフ、フェンプロピジン、ピペラリン、スピロキサミンなど；

6) ホスホロチオレート系：EDDP、イプロベンホス、ピラゾホスなど；

7) ジチオラン系：イソプロチオランなど；

8) カルボキサミド：ベノダニル、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラン、フルトラニル、フラメトピル、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンチオピラド、チフルザミドなど；

9) ヒドロキシー（2-アミノ）ピリミジン系：ブピリメート、ジメチリモル、エチリモルなど；

10) AP殺菌剤（アニリノピリミジン）系：シプロジニル、メパニプリム、ピリメタニルなど；

11) N-フェニルカーバメート系：ジエトフェンカルブなど；

12) QoI-殺菌剤（Qo阻害剤）系：アゾキシストロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、クレソキシム-メチル、トリフロキシストロビン、ジモキシストロビン、メトミノストロビン、オリザストロビン、ファモキサドン、フルオキサストロビン、フェンアミドン、メトミノフェンなど；

13) PP殺菌剤（フェニルピロール）系：フェンピコニル、フルジオキソニルなど；

14) キノリン系：キノキシフェンなど；

15) AH殺菌剤（芳香族炭化水素）系：ビフェニル、クロロネブ、ジ

クロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクトフォスーメチルなど；

16) MBI-R系：フサライド、ピロキロン、トリシクラゾールなど；

17) MBI-D系：カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニルなど；

18) SBI剤：フェンヘキサミド、ピリブチカルブ、タービナフィンなど；

19) フェニルウレア：ペンシクロンなど；

20) Qi-殺菌剤（Qi阻害剤）：シアゾファミドなど；

[0156] 21) ベンズアミド系：ゾキサミドなど；

22) エノピランウロン系：ブラストサイジン、ミルディオマイシンなど；

23) ヘキソピラノシル系：カスガマイシンなど；

24) グルコピラノシル系：ストレプトマイシン、バリダマイシンなど；

25) シアノアセトアミド系：シモキサニルなど；

26) カーバメート系：イドカルブ、プロパモカルブ、プロチオカルブ、ポリカーバメートなど；

27) 脱共役剤：ビナパクリル、ジノカップ、フェリムゾン、フルアジナムなど；

28) 有機スズ化合物：酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズ、水酸化トリフェニルスズなど；

29) リン酸エステル：亜リン酸、トルクロホスメチル、ホセチルなど；

30) フタルアミド酸系：テクロフタラムなど；

31) ベンゾトリアジン系：トリアゾキシドなど；

32) ベンゼンスルフォナミド系：フルスルファミドなど；

33) ピリダジノン：ジクロメジンなど；

34) CAA 殺菌剤（カルボン酸アミド）系：ジメトモルフ、フルモルフ、ベンチアバリカルブ、イプロバリカルブ、マンジプロパミドなど；

35) テトラサイクリン：オキシテトラサイクリンなど；

36) チオカーバメート系：メタスルホカルブなど；

37) その他の化合物：エトリジアゾール、ポリオキシシン、オキサリニク酸、ヒドロキシイソキサゾール、オクチノリン、シルチオフアム、ジフルメトリム、アシベンゾラルSメチル、プロベナゾール、チアジニル、エタボキサム、シフルフェナミド、プロキナジド、メトラフェノン、フルオピコリド、水酸化第二銅、有機銅、硫黄、ファーバム、マンゼブ、マンネブ、メチラム、プロピネブ、チウラム、ジネブ、ジラム、キャプタン、カプタホール、フォルペット、クロロタロニル、ジクロフルアニド、トリルフルアニド、ドジン、グアザチン、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンドデシルベンゼンスルホン酸塩、アニラジン、ジチアノン、クロロピクリン、ダゾメット、メタムナトリウム塩、キノメチオネート、シプロフラム、シルチオフアム、アグロバクテリウム、フルオロイミド) など；

[0157] 殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤：

1) 有機（チオ）ホスフェート系：アセフェート、アザメチホス、アジンホスメチル、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クロルフェンビンホス、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、エチオン、EPN、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、イソキサチオン、マラソン、メタミドホス、メチダチオン、メチルパラチオン、メビンホス、モノクロトホス、オキシデメトンメチル、パラオキシソン、パラチオン、フェントエート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホスメチル、プロフェノホス、プロチオホス、スルプロホス、テトラクロルビンホス、テルブホス、トリアゾホス、トリクロルホン、ホスチアゼート、ホスホカルブ、カズサホス、ジスルホトン、デメトン-S-メチル、BRP、CYAP、エトプロホス、キナルホス、ジメチルビンホス、バミドチオン、ピラクロホスなど；

[0158] 2) カルバメート系：アラニカルブ、アルジカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、フェノキシカルブ、フェノチオカルブ、メチオカルブ、メソミル、オキサミル、ピリ

ミカルブ、プロポキスル、チオジカルブ、トリアザメート、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、MIPC、MPMC、MTMC、ピリダフェンチオン、フラチオカルブ、XMCなど；

3) ピレトロイド系：アレスリン、ビフェントリン、シフルトリン、シハロトリン、シフェノトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、ベータシペルメトリン、ゼータシペルメトリン、デルタメトリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、イミプロトリン、ラムダシハロトリン、ペルメトリン、プラレトリン、ピレトリンおよび、レスメトリン、シラフルオフエン、タウフルバリネート、テフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、プロフルトリン、ジメフルトリン、アクリナトリン、シクロプロトリン、ハルフェンプロックス、フルシトリネートなど；

[0159] 4) 成長調節物質：

a) キチン合成阻害剤：クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、テフルベンズロン、トリフルムロン； ビストリフルロン、ノビフルムロン、ブプロフェジン、ジオフェノラン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロフェンタジンなど；

b) エクジソンアンタゴニスト：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド、アザジラクチン； クロマフェノジドなど；

c) 幼若ホルモン様物質： ピリプロキシフェン、メトプレン、フェノキシカルブ；

d) 脂質生合成阻害剤：スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマトなど；

[0160] 5) ニコチン受容体アゴニスト／アンタゴニスト化合物：アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、チアメトキサムなど；

6) GABAアンタゴニスト化合物：アセトプロール、エンドスルファン

、エチピロール、フィプロニル、バニリプロール、ピラフルプロール、ピリプロールなど；

7) 大環状ラクトン殺虫剤：アバメクチン、エマメクチン、ミルベメクチン、レピメクチン、スピノサド；イベルメクチンなど；

8) METI I 化合物：フェナザキン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、フルフェネリムなど；

9) METI IIおよびIII化合物：アセキノシル、フルアシプリム、ヒドラメチルノンなど；

10) 脱共役剤化合物：クロルフェナピルなど；

11) 酸化的リン酸化阻害剤化合物：シヘキサチン、ジアフェンチウロン、フェンブタチンオキシド、プロパルギットなど；

12) 脱皮かく乱化合物：シロマジンなど；

13) 混合機能オキシダーゼ阻害剤化合物：ピペロニルブトキシドなど；

14) ナトリウムチャネル遮断剤化合物：インドキサカルブ、メタフルミゾン；

15) 微生物農薬：BT剤、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤など；

16) その他のもの：ベンクロチアズ、ビフェナゼート、カルタップ、フロニカミド、ピリダリル、ピメトロジン、硫黄、チオシクラム、フルベンジアミド、シエノピラフェン、フルピラゾホス、シフルメトフェン、アミドフルメット、ベンスルタップ、ジコホル、テトラジホン、フェンピロキシメート、アミトラズ、クロルジメホルム、トリアザメイト、ピメトロジン、ピリミジフェン、1, 3-ジクロロプロペン、クロフェンテジン、フルアクリピリム、ロテノン、DCIP、フェニソプロモレート、ベンゾメート、メタアルデヒド、クロラントラニリプロールスピネトラム、ピリフルキナゾンなど；

[0161] 植物生長調節剤：

アブシジン酸、インドール酪酸、ウニコナゾール、エチクロゼート、エテ

ホン、クロキシホナック、クロルメコート、クロレラ抽出液、過酸化カルシウム、シアナミド、ジクロルプロップ、ジベレリン、ダミノジッド、デシルアルコール、トリネキサパックエチル、メピコートクロリド、パクロブトラゾール、パラフィンワックス、ピペロニルブトキシド、ピラフルフェンエチル、フルルプリミドール、プロヒドロジャスモン、プロヘキサジオンカルシウム塩、ベンジルアミノプリン、ペンディメタリン、ホルクロルフェニユロン、マレイン酸ヒドラジドカリウム、1-ナフチルアセトアミド、4-C P A、M C P B、コリン、硫酸オキシキノリン、エチクロゼート、ブトルアリン、1-メチルシクロプロペン、アビグリシン塩酸塩など；

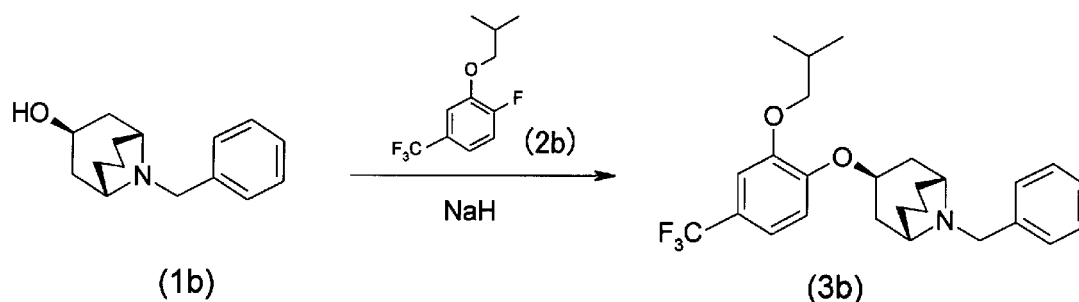
## 実施例

[0162] 次に、実施例を示し、本発明をさらに詳細に説明する。ただし、本発明は以下の実施例によってその範囲が限定されるものではない。

### [0163] 実施例 1

3-endo-[2-tert-butoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-9-azabicyclo[3.3.1]nonan-9-yl benzyloxycarbonyl (化合物番号 H-1) の製造

### [0164] [化13]

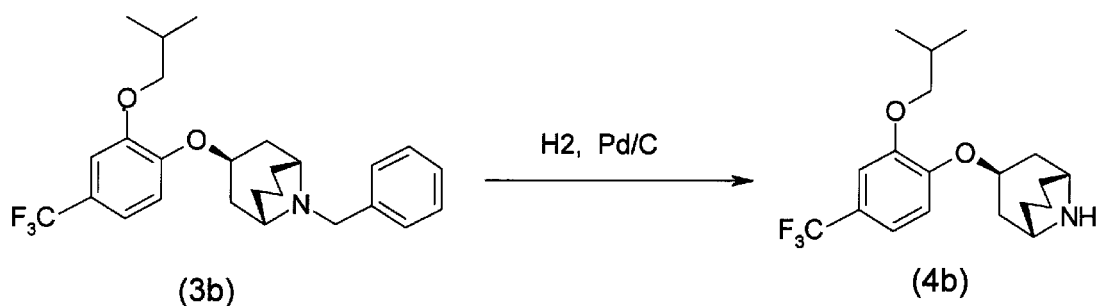


[0165] 3-endo-9-benzyloxy-9-azabicyclo[3.3.1]nonan-3-yl benzyloxycarbonyl (化合物 (1b)) は、WO 2007/039563 に記載された方法で合成した。

化合物 (1b) (1.35 g) と 4-tert-butoxy-2-(trifluoromethyl)phenol (化合物 (2b)) (1.38 g) との N, N-ジメチルホ

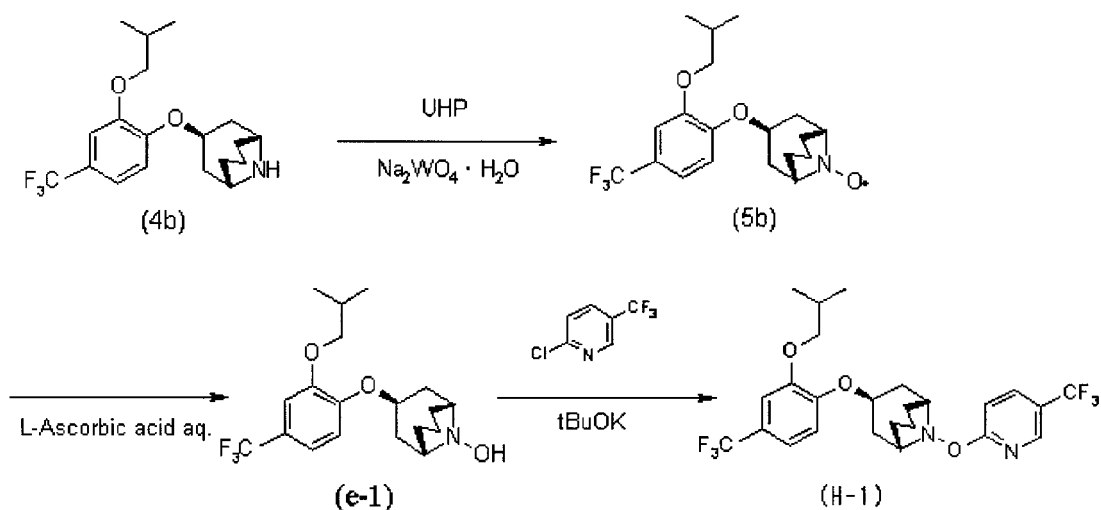
ルムアミド（１４ｍｌ）溶液を９０℃に昇温し、次いで６０％水素化ナトリウム（０．３５ｇ）を加え、２時間攪拌した。該混合物を室温まで冷やした後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、次いで減圧濃縮した。残査をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物（３ｂ）（２．０４ｇ）を得た。

[0166] [化14]



[0167] 化合物（３ｂ）（２．０４ｇ）のエタノール（２０ｍｌ）溶液に、１０％パラジウム－炭素（０．４ｇ）を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、５０℃で５時間加熱した。これを冷却し、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去した。得られた化合物（４ｂ）は精製することなく次の反応に用いた。

[0168] [化15]



[0169] 粗製の化合物（４ｂ）（１．４１ｇ）のアセトニトリル（１４ｍｌ）溶液に、室温下、タングステン酸ナトリウム水和物（０．１３ｇ）を加えて、３０分間攪拌した。該混合物を０℃に冷やした後、ウレア・過酸化水素付加物

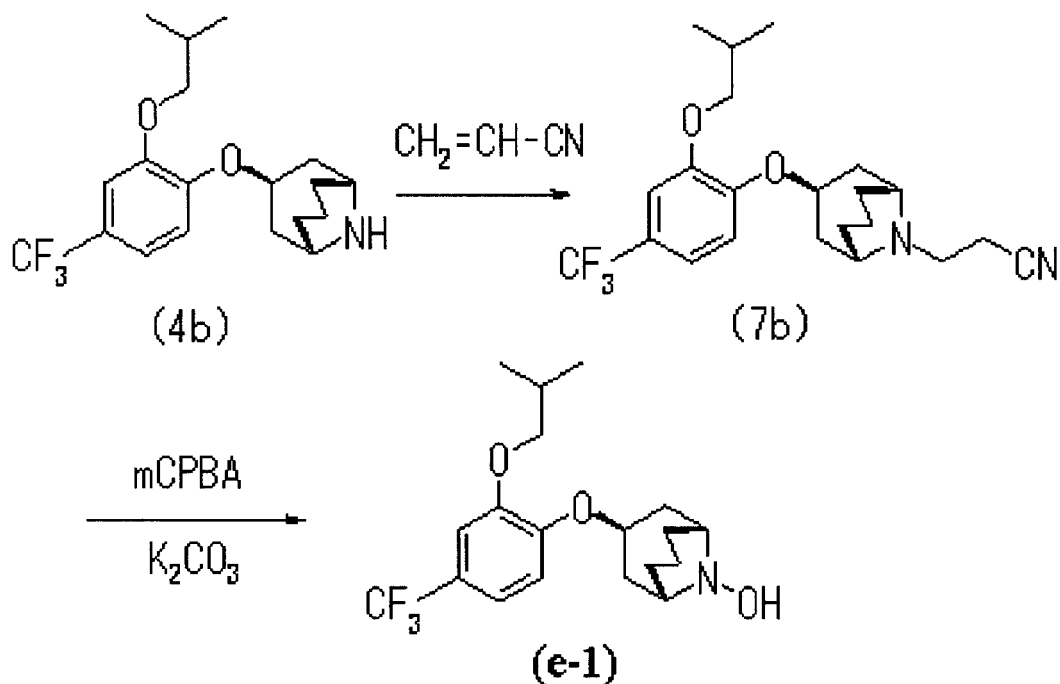
(UHP、0.75 g)を加えて、0℃で45分間、さらに室温に昇温して2時間攪拌した。該混合物に水を加えて、クロロホルムで抽出し、有機層を無水炭酸カリウムで乾燥し濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物(5b)(0.57 g)を得た。化合物(5b)をクロロホルムで希釈し、アスコルビン酸水溶液で処理することにより粗製の化合物(e-1)を得た。次に、粗製の化合物(e-1)(0.37 g)と2-クロロロー5-(トリフルオロメチル)ピリジン(0.18 g)とのテトラヒドロフラン(4 ml)溶液に、窒素雰囲気下、0℃で、t-ブトキシカリウム(1 Mテトラヒドロフラン、1.11 ml)を加え、次いで室温に昇温して2時間攪拌した。該混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、次いで減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物H-1(0.27 g)を得た。

[0170] 実施例2

3-endo-[2-tert-butoxy-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-9-ヒドロキシ-9-アザビシクロ[3.3.1]ノナン (化合物番号e-1)の製造

[0171]

[化16]



[0172] 粗製の化合物 (4b) (30.23g) のメタノール (300ml) 溶液に、室温下、アクリロニトリル (9.07g) を加えて、混合物を一晩撹拌した。溶媒を減圧濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル＝4：1→6：4) により精製し、化合物 (7b) (30.4g、Viscous oil) を得た。

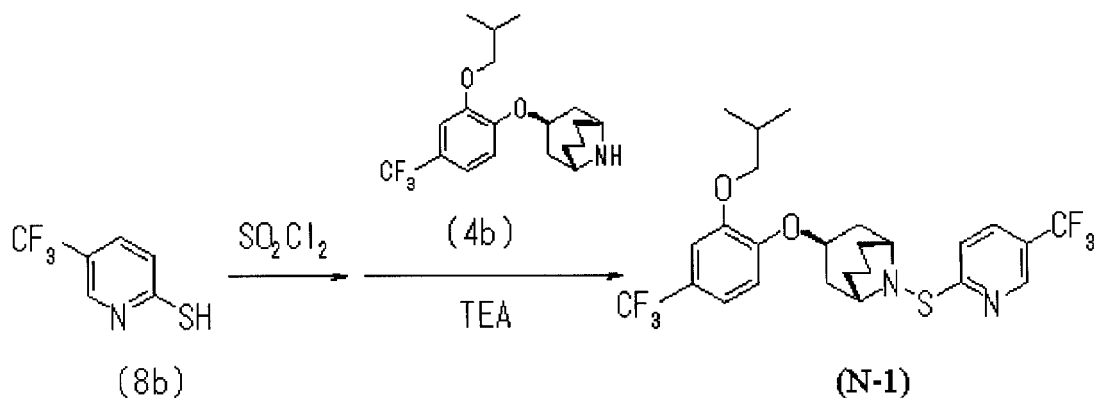
化合物 (7b) (30.4g) の塩化メチレン (600ml) 溶液に、室温下、炭酸カリウム (15.5g) とメタクロロ過安息香酸 (70%純度、23.71g) を加えて、混合物を4時間撹拌した。混合物に無水硫酸マグネシウム (10g) を加えて、ろ過し溶媒を減圧濃縮した。残渣を酢酸エチルで希釈しアスコルビン酸水溶液、続いて水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣にヘキサンを加えることにより固化させて粗製の化合物 (e-1) (17.79g) を得た。さらにその母液をカラムクロマトグラフィーにより精製し、結晶の化合物 (e-1) (8.12g、融点 112–115℃) を得た。

[0173] 実施例 3

3-endo-[2-イソブトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノ

キシ]－9－[5－(トリフルオロメチル)－2－ピリジルチオ]－9－ア  
ザビシクロ[3.3.1]ノナン (化合物番号N－1) の製造

[0174] [化17]



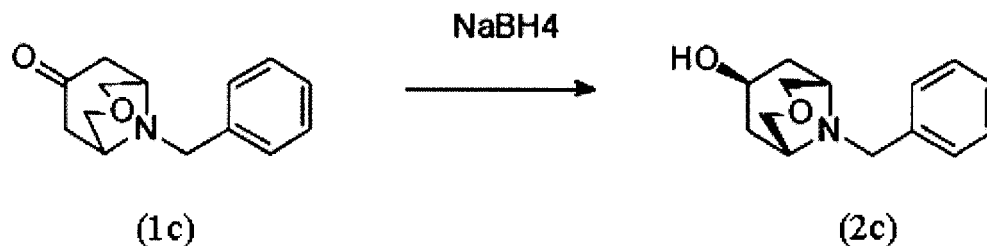
[0175] 公知の方法で製造可能な化合物(8b)(0.55g)の塩化メチレン(10ml)溶液を窒素雰囲気下、0℃に冷やして塩化スルフリル(0.46g)を加えた。混合物を1時間攪拌した後、減圧濃縮した。残渣を塩化メチレン(10ml)で希釈した溶液を、粗製の化合物(4b)(1.0g)とトリエチルアミン(0.34g)の塩化メチレン(10ml)溶液に、氷冷下、滴下しゆっくりと室温に戻してそのまま一晩攪拌した。混合物を水に注いで、クロロホルムで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル＝9：1)により精製し、目的物(N-1)(1.36g、Viscous oil)を得た。

[0176] 実施例4

3-オキサ-7-endo-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルオキシ]－9－[2-イソプロポキシカルボニル-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]－9-アザビシクロ[3.3.1]ノナン (化合物番号(K-12)) の製造

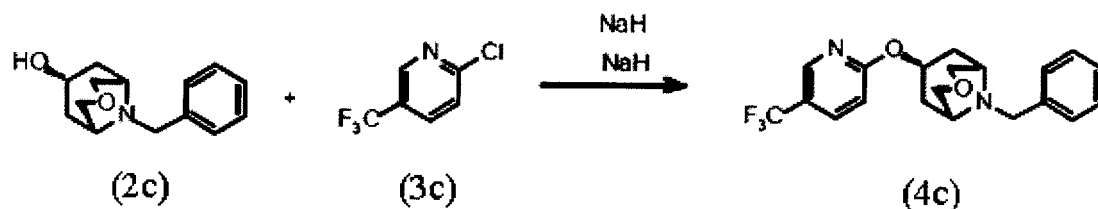
[0177]

[化18]



[0178] 9-ベンジル-3-オキサー9-アザビシクロ [3.3.1] ノナン-7-オン (1 c) は、国際公開番号WO2007/022502に記載された方法で合成した。化合物 (1 c) (4 g) のエタノール (50m l) 溶液に室温下、水素化ホウ素ナトリウム (0.785 g) を加え、混合物を3時間加熱還流した。混合物を冷却した後に減圧濃縮し、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (2 c) (3.62 g) を得た。

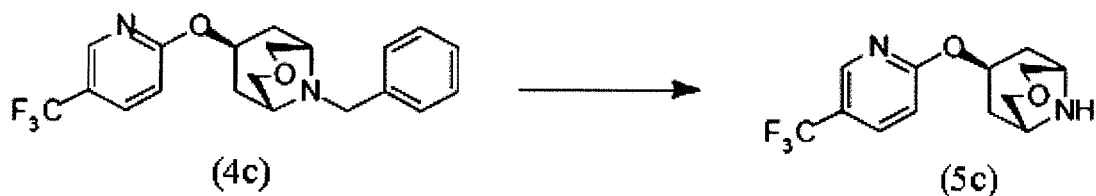
[0179] [化19]



[0180] 化合物 (2 c) (2.45 g) と2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン (2.86 g) のDMF (30m l) 溶液を80℃に加熱し、その溶液に60%水素化ナトリウム (0.42 g) を加えた。混合物を30分間攪拌した後、さらに60%水素化ナトリウム (0.42 g) を加えた。混合物をそのまま2時間攪拌した。混合物を室温まで冷却し、冷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (4 c) (3.05 g) を得た。

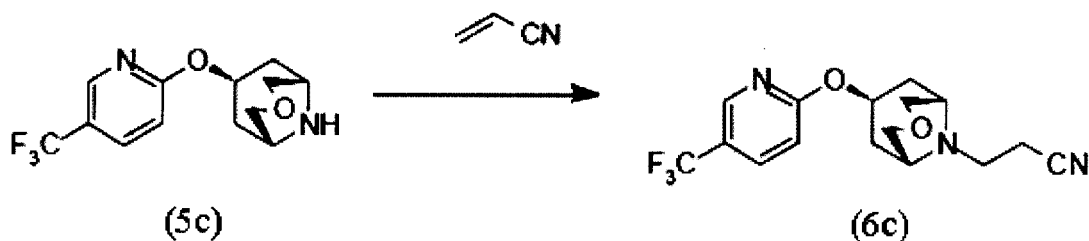
[0181]

[化20]



[0182] 化合物 (4c) (3.05 g) のエタノール (50ml) 溶液に、20%水酸化パラジウム-炭素 (0.92 g) を加え、この懸濁液を水素雰囲気下、50°Cで6時間加熱した。混合物を冷却した後にセライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去した。得られた化合物 (5c) は精製することなく次の反応に用いた。

[0183] [化21]

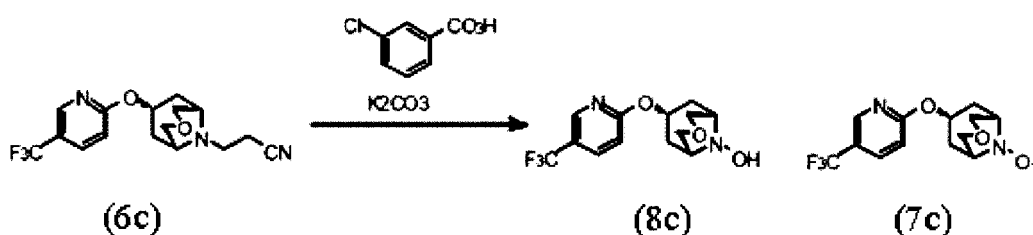


[0184] 粗製の化合物 (5c) (2.3 g) のメタノール (50ml) 溶液に、室温下、アクリロニトリル (1.06 g) を加えて、混合物を一晩撹拌した。溶媒を減圧濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (6c) (2.11 g) を得た。

化合物 (6c) : mp. 87-90°C

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>, δ ppm) 8.41(s, 1H), 7.73(d, 1H), 6.81(d, 1H), 5.47-5.40(m, 1H), 3.87(d, 2H), 3.60(d, 2H), 2.98(t, 2H), 2.84(d, 2H), 2.50-2.42(m, 4H), 1.87(d, 1H), 1.82(d, 1H)

[0185] [化22]

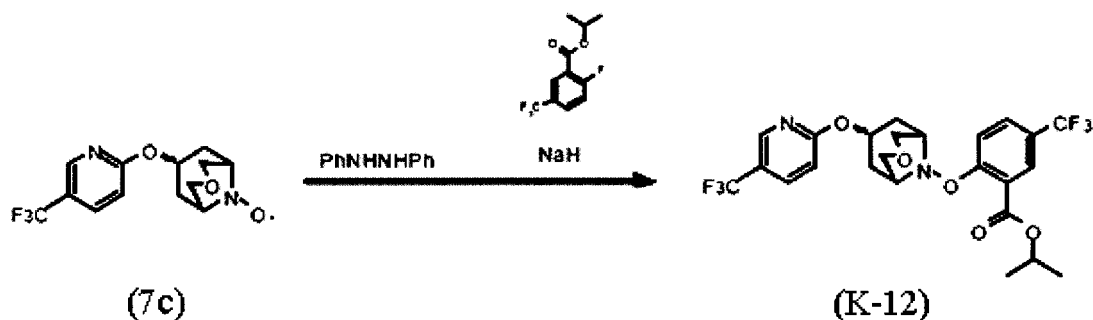


[0186] 化合物 (6c) (0.76 g) の塩化メチレン (20ml) 溶液に、室温下、メタクロロ過安息香酸 (70%純度、0.58 g) 炭酸カリウム (0.4 g) を加えて、混合物を1時間攪拌した。混合物に無水硫酸マグネシウムを加えて、セライトを通してろ過し溶媒を減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (7c) (0.38 g) と (8c) (0.2 g) を得た。

[0187] 化合物 (8c) : mp. 110 - 113°C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm, 測定温度21.2°C) 8.43 (s, 1H), 7.73 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.68-5.61 (m, 0.7H), 5.39-5.36 (m, 0.3H), 4.38 (d, 0.5H), 3.79 (s, 3H), 3.37 (d, 0.5H), 3.24 (d, 1.5H), 3.11 (d, 0.5H), 2.75-2.53 (m, 2H), 2.17-2.05 (brd, 0.5H), 1.78-1.72 (d, d, 1.5H)

[0188] [化23]



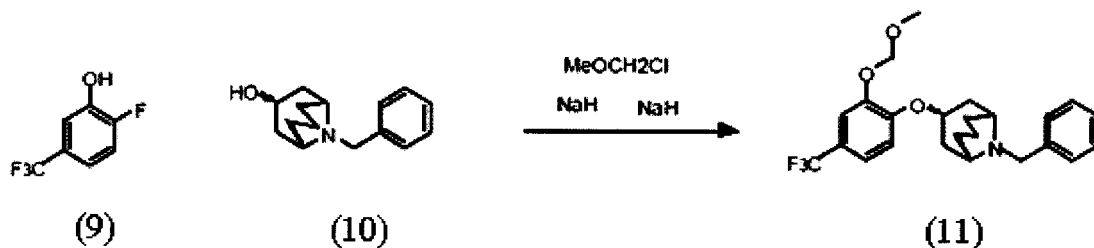
[0189] 化合物 (7c) (0.38 g) のTHF (5ml) 溶液に、室温下、1,2-ジフェニルヒドラジン (0.14 g) を加えて、混合物を30分間攪拌した。混合物に60%水素化ナトリウム (0.06 g) を加えて10分間攪拌した後、2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)安息香酸イソプロピル (0.314 g) のTHF (5ml) 溶液を加えて1時間攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (化合物番号 (K-12)) (0.27 g、Viscous oil) を得た。

[0190] 実施例 5

3-endo-[2-ブトキシ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-9-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルオキシ]-9-アザビシクロ

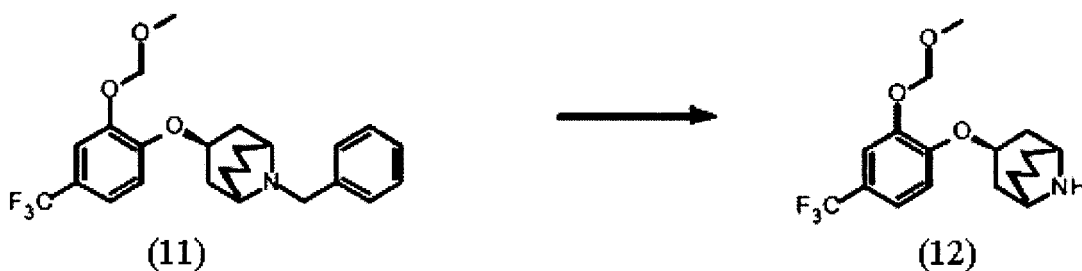
## [3.3.1] ノナン（化合物番号（H-54））の製造

[0191] [化24]



[0192] 2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェノール (2.83 g) の DMF (20 ml) 溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム (0.75 g) を加えた。混合物を室温下30分間撹拌した後、氷冷下、クロロメチルメチルエーテル (1.39 g) を滴下した。混合物を室温に昇温して30分間撹拌し、さらに80℃に昇温して1時間撹拌した。混合物に化合物 (10) (4 g) と60%水素化ナトリウム (0.94 g) を加えて3時間撹拌した。混合物を室温まで冷却し、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (11) (6.27 g) を得た。

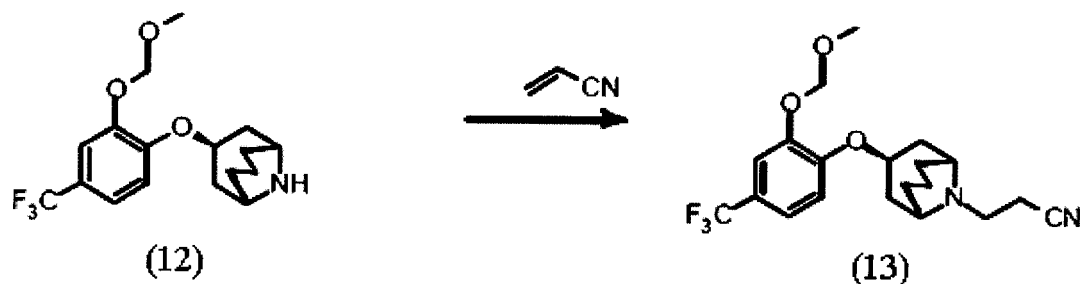
[0193] [化25]



[0194] 化合物 (11) (6.27 g) のエタノール (100 ml) 溶液に、20%水酸化パラジウム-炭素 (1.25 g) を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下50℃で2時間加熱し、室温で一晩撹拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去した。得られた化合物 (12) は精製することなく次の反応に用いた。

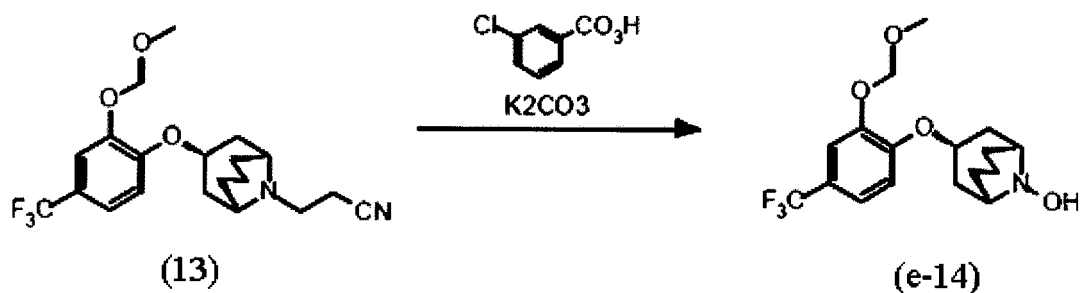
[0195]

[化26]



[0196] 粗製の化合物 (12) (4.71 g) のメタノール (50ml) 溶液に、室温下、アクリロニトリル (1.45 g) を加えて、混合物を一晩撹拌した。溶媒を減圧濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (13) (5.09 g、Viscous oil) を得た。

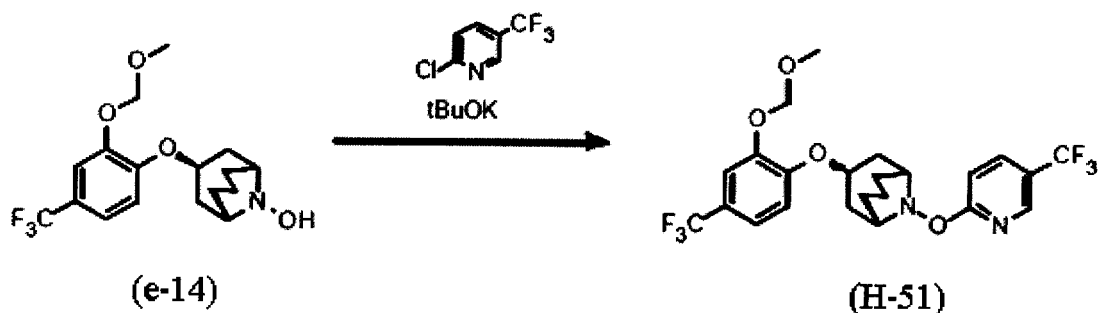
[0197] [化27]



[0198] 化合物 (13) (1.5 g) の塩化メチレン (30ml) 溶液に、室温下、メタ-クロロ過安息香酸 (70%純度、1.2 g) と炭酸カリウム (0.78 g) を加えて、混合物を2時間撹拌した。混合物に無水硫酸マグネシウム (10 g) を加えて、ろ過し溶媒を減圧濃縮した。残渣を塩化メチレンで希釈しアスコルビン酸水溶液、続いて水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、(e-14) (1.35 g) を得た。

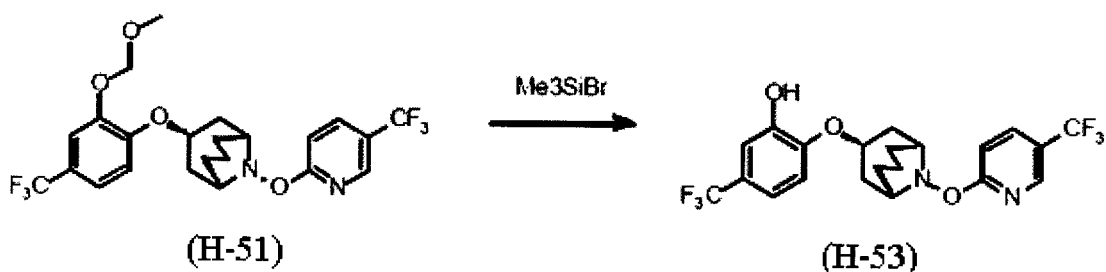
[0199]

[1728]



[0200] 化合物（e-14）（1.3 g）と2-クロロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン（0.65 g）のTHF（20m l）溶液に、窒素雰囲気下、0℃で、t-ブトキシカリウム（1 MTHF、3.6m l）を加えた後に室温に昇温して2時間撹拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残査をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物（H-51）（0.67 g、Viscous oil）を得た。

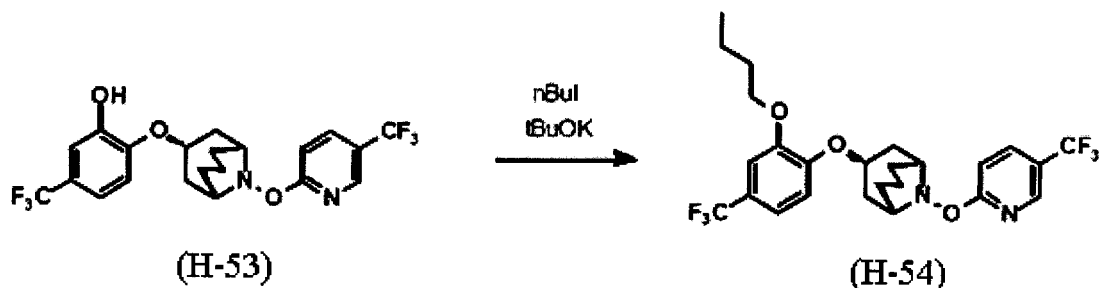
[0201] [1729]



[0202] 化合物（H-51）（0.25 g）の塩化メチレン（5ml）溶液に、窒素雰囲気下、 $-30^{\circ}\text{C}$ で、ブロトリメチルシラン（0.302 g）をゆっくり加えた。混合物を $-30^{\circ}\text{C}$ で1時間攪拌し、2時間かけて $0^{\circ}\text{C}$ に昇温した。混合物を冷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物（H-53）（0.13 g、mp  $141 - 144^{\circ}\text{C}$ ）を得た。

[0203]

[化30]

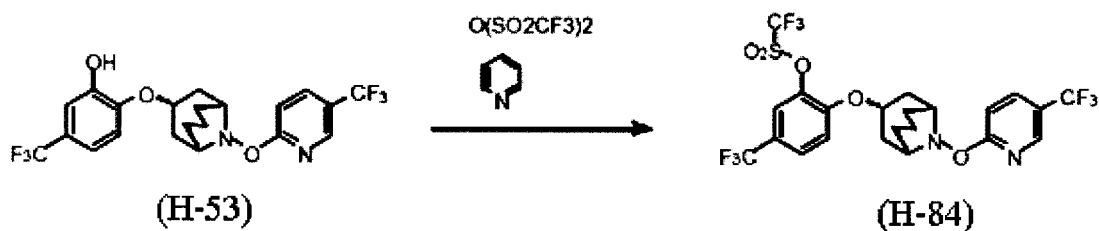


[0204] 化合物（H-53）（0.35 g）と1-ヨードブタン（0.14 g）のTHF（6m l）溶液に、氷冷下、t-ブトキシカリウム（0.085 g）を加えた。混合物を室温に昇温しさらに50℃に加熱して一晩撹拌した。混合物を室温まで冷却し、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物（化合物番号（H-54））（0.24 g、Viscous oil）を得た。

[0205] 実施例 6

3-endo-[2-フェニル-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-9-[5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルオキシ]-9-アザビシクロ  
[3.3.1]ノナン（化合物番号（H-85））の製造

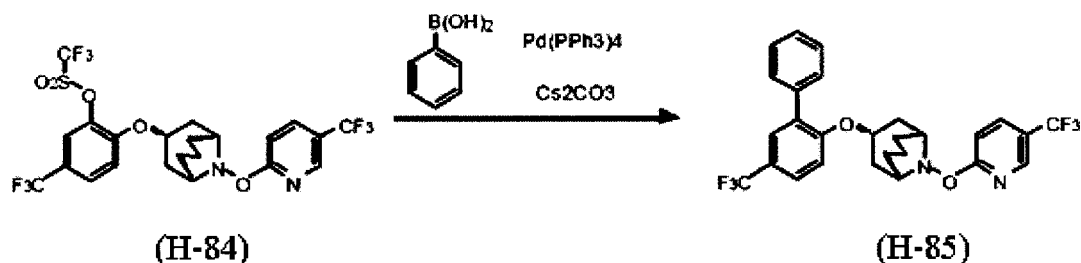
[0206] [化31]



[0207] 化合物（H-53）（5 g）とピリジン（2.14 g）の塩化メチレン（50m l）溶液に、氷冷下、無水トリフルオロメタンスルホン酸（3.66 g）をゆっくり加えた。混合物を室温に昇温し一晩撹拌した。混合物を冷水に注いで、塩化メチレンで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し

、化合物（H-84）（3.7 g、mp127-130°C）を得た。

[0208] [化32]



[0209] 化合物（H-84）（0.4 g）のTHF（4m l）溶液に、窒素雰囲気下、水（2m l）、炭酸セシウム（0.88 g）、フェニルボロン酸（0.098 g）およびテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）（0.078 g）を加えた。混合物を80°Cに昇温して一晩攪拌した。混合物を室温まで冷却し、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物（化合物番号（H-85））（0.2 g、Viscous oil）を得た。

[0210] 上記の製造方法と同様の方法によって得ることができる本発明に係る環状アミン化合物を表1～5に示す。

なお、表1中の $(R^{10})_m$ 、 $(R^{11})_n$ 、A、 $(R^{21})_r$ 、および $Cy^2-(R^{20})_p$ は、式(lg)で表される環状アミン化合物中の各置換基を示している。

表2中の $(R^{10})_m$ 、 $(R^{11})_n$ 、A、 $(R^{21})_r$ 、および $Cy^2-(R^{20})_p$ は、式(lh)で表される環状アミン化合物中の各置換基を示している。

表3中の $(R^{10})_m$ 、 $(R^{11})_n$ 、A、 $(R^{21})_r$ 、 $Cy^1$ 、 $Cy^2$ 、および $(R^{20})_p$ は、式(li)で表される環状アミン化合物中の各置換基を示している。

表4中の $(R^{10})_m$ 、 $(R^{11})_n$ 、A、 $(R^{21})_r$ 、 $Cy^1$ 、 $Cy^2$ 、および $(R^{20})_p$ は、式(lj)で表される環状アミン化合物中の各置換基を示している。

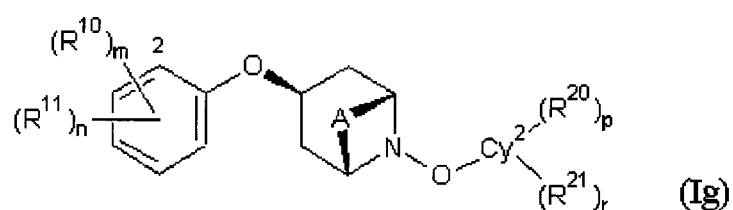
表5中の $(R^{10})_m$ 、 $(R^{11})_n$ 、A、 $(R^{21})_r$ 、 $Cy^1$ 、 $Cy^2$ 、および $(R^{20})_p$ は、式(lk)で表される環状アミン化合物中の各置換基を示している。

表6中の $(R^{10})_m$ 、 $(R^{11})_n$ 、A、 $(R^{21})_r$ 、 $Cy^1$ 、 $Cy^2$ 、および $(R^{20})_p$

$p$ は、式(II)で表される環状アミン化合物中の各置換基を示している。

なお、表1～6において、置換基の前に付された数値は置換位置を示している。また、Etはエチル基、Meはメチル基、 $^n$ Buはn-ブチル基、 $^i$ Buはi-ブチル基、 $^s$ Buはs-ブチル基、 $^t$ Buはt-ブチル基、 $^n$ Penはn-ペンチル基、 $^n$ Hexはn-ヘキシル基、 $^\circ$ Prはシクロプロピル基、 $^\circ$ Buはシクロブチル基、 $^\circ$ Penはシクロペンチル基、 $^\circ$ Hexはシクロヘキシル基、をそれぞれ示している。

[0211] [化33]



[0212]

[表1]

表1

| 化合物<br>番号 | $(R^{10})_m$                                               | $(R^{11})_n$      | A                                | $Cy^2-(R^{20})_p$                             | $(R^{21})_r$ |
|-----------|------------------------------------------------------------|-------------------|----------------------------------|-----------------------------------------------|--------------|
| H-1       | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| H-2       | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| H-3       | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| H-4       | 2-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| H-5       | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| H-6       | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| H-7       | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| H-8       | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| H-9       | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| H-10      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| H-11      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| H-12      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| H-13      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| H-14      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| H-15      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| H-16      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| H-17      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| H-18      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| H-19      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| H-20      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| H-21      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| H-22      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| H-23      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| H-24      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| H-25      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |

[0213]

[表2]

表1(続き)

| 化合物<br>番号 | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                            | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup> -(R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> |
|-----------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|--------------------------------------------------|---------------------------------|
| H-26      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl                | -                               |
| H-27      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl                | -                               |
| H-28      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl                | -                               |
| H-29      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl                | -                               |
| H-30      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl                | -                               |
| H-31      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl                | -                               |
| H-32      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl                | -                               |
| H-33      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl                  | -                               |
| H-34      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl                  | -                               |
| H-35      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl                  | -                               |
| H-36      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl                  | -                               |
| H-37      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl    | -                               |
| H-38      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl    | -                               |
| H-39      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl    | -                               |
| H-40      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl    | -                               |
| H-41      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CN-pyridin-2-yl                                | -                               |
| H-42      | 2-(OEt)                                                    | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-43      | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-44      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CN-pyridin-2-yl                                | -                               |
| H-45      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CN-pyridin-2-yl                                | -                               |
| H-46      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CN-pyridin-2-yl                                | -                               |
| H-47      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CN-pyridazin-3-yl                              | -                               |
| H-48      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CN-pyridazin-3-yl                              | -                               |
| H-49      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CN-pyridazin-3-yl                              | -                               |
| H-50      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CN-pyridazin-3-yl                              | -                               |

[0214]

[表3]

表1(続き)

| 化合物<br>番号 | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                           | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> -(R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> |
|-----------|-----------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|--------------------------------------------------|---------------------------------|
| H-51      | 2-(OCH <sub>2</sub> OMe)                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-52      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 6-CN-pyridazin-3-yl                              | -                               |
| H-53      | 2-OH                                                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-54      | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                     | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-55      | 2-([1,3]Dioxolan-2-yl)                                    | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-56      | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)                     | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-57      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-58      | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-59      | 2-(NH <sup>i</sup> Bu)                                    | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-60      | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                                     | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-61      | 2-(O <sup>s</sup> Bu)                                     | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-62      | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-63      | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-64      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-65      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-66      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-67      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> )                 | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-68      | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                 | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-69      | 2-(OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-70      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-71      | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-72      | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-73      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-74      | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                                    | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-75      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -6-Cl-pyridin-2-yl             | -                               |

[0215]

[表4]

表1(続き)

| 化合物<br>番号 | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                   | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup> -(R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> |
|-----------|-------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|--------------------------------------------------|---------------------------------|
| H-76      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 3-CF <sub>3</sub> -6-Cl-pyridin-2-yl             | -                               |
| H-77      | 2-(OAc)                                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-78      | 2-(OCH <sub>2</sub> [2,2-Cl <sub>2</sub> -3-Ph- <sup>o</sup> Pr]) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-79      | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-80      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-81      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-82      | 2-(O <sup>o</sup> Pen)                                            | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-83      | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                                         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-84      | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-85      | 2-Ph                                                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-86      | 2-(pyridin-3-yl)                                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-87      | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-88      | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-89      | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                             | 4-Cl                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-90      | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>4</sub> H <sub>8</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-91      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                              | 4-Cl                            | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |

[0216]

[表5]

| 表1(続き) |                                                                       |                   |                               |                                 |              |
|--------|-----------------------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                                          | $(R^{11})_n$      | A                             | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-92   | 2-(OCH <sub>3</sub> ), 3- <sup>n</sup> Pr                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-93   | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> )-3                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-94   | 2- <sup>n</sup> Bu                                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-95   | 2- <sup>i</sup> Pen                                                   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-96   | 2-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-97   | 2-(CH=N-OH)                                                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-98   | 2-(CH=N-OCH <sub>3</sub> )                                            | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-99   | 2-(CO <sup>i</sup> Pr)                                                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-100  | 2-(OCH <sub>2</sub> OAc)                                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-101  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-102  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-103  | 2-(OCH <sub>2</sub> Ph)                                               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-104  | 2-(OCH <sub>2</sub> -(pyridine-3-yl))                                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-105  | 2-(OCH <sub>2</sub> -[tetrahydrofuran-2-yl])                          | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-106  | 2-(OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-107  | 2-(OCH <sub>2</sub> CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-108  | 2-(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> NO <sub>2</sub> )                   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-109  | 2-(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-110  | 2-(SCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-111  | 2-(SCH <sub>2</sub> C≡CH)                                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-112  | 2-(SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[表6]

| 表1(続き) |                                                         |                   |                               |                                 |              |
|--------|---------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                            | $(R^{11})_n$      | A                             | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-113  | 2-(SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-114  | 2-(OPh)                                                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-115  | 2-(O-(pyridine-3-yl))                                   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-116  | 2-NH <sub>2</sub>                                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-117  | 2-(N(CH <sub>3</sub> ) <sup>i</sup> Pr)                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-118  | 2-(NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-119  | 2-(NHCH <sub>2</sub> C≡CH)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-120  | 2-(NHAc)                                                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-121  | 2-(NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-122  | 2-(NHSO <sub>2</sub> Ph)                                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-123  | 2-(CONH <sub>2</sub> )                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-124  | 2-(O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-125  | 2-(SPh)                                                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-126  | 2-(S-(pyridin-3-yl))                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-127  | 2-(CS <sup>i</sup> Pr)                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-128  | 2-(CO(S <sup>i</sup> Pr))                               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-129  | 2-(CS(O <sup>i</sup> Pr))                               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-130  | 2-(CS <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-131  | 2-(Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> )                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-132  | 2-NO <sub>2</sub>                                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-133  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-3                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-134  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O)-3                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-135  | 2-(OCH <sub>2</sub> O)-3                                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-136  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-137  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CN)                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[表7]

| 表1(続き) |                                                                              |                   |                               |                                 |              |
|--------|------------------------------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                                                 | $(R^{11})_n$      | A                             | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-138  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-139  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> O <sup>C</sup> Pen)                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-140  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ac)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-141  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH<br>(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-142  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-143  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-144  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -<br>(pyridine-3-yl))                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-145  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -<br>[tetrahydrofuran<br>-2-yl])         | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-146  | 2-(CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-147  | 2-(CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CN)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-148  | 2-(CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> )                                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-149  | 2-(CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> O <sup>C</sup> Pen)                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-150  | 2-(CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ac)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-151  | 2-(CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Ph)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-152  | 2-(CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> -(pyridine<br>-3-yl))                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-153  | 2-(CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> -<br>[tetrahydrofuran<br>-2-yl])         | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0219]

[表8]

| 表1(続き) |                                                                   |                   |                               |                                 |              |
|--------|-------------------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                                      | $(R^{11})_n$      | A                             | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-154  | 2-(CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub><br>[tetrahydrofuran<br>-2-yl]) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-155  | 2-( Spiro[2.2]pent<br>-1-yl )                                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl |              |
| H-156  | 2-(1-CH <sub>3</sub> -spiro[2.2]<br>pent-1-yl)                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl |              |
| H-157  | 2-(1-HOCH <sub>2</sub> -spiro<br>[2.2]pent-1-yl)                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl |              |
| H-158  | 2-(Spiro[2.2]pent-1<br>-yloxy)                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-159  | 2-(Spiro[2.2]pent<br>-1-ylmethoxy)                                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-160  | 2-(2-°Pr-°Pr)                                                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-161  | 2-(2-°Pr-°PrO)                                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-162  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-163  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-164  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )<br>CH <sub>3</sub> )    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-165  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-166  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-167  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-168  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-169  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )<br>CH <sub>3</sub> )    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0220]

[表9]

| 表1(続き) |                                                            |                   |                               |                                 |              |
|--------|------------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                               | $(R^{11})_n$      | A                             | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-170  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-171  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-172  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-173  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-174  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-175  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-176  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                      | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-177  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-178  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-179  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-180  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-181  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                      | 4-SF <sub>5</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-SF <sub>5</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-182  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-183  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-184  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-185  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-186  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                      | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-187  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-Cl-pyridin-2-yl               | -            |
| H-188  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-Cl-pyridin-2-yl               | -            |
| H-189  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-Cl-pyridin-2-yl               | -            |
| H-190  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-Cl-pyridin-2-yl               | -            |

[0221]

[表10]

| 表1(続き) |                                                                |                   |                               |                                 |              |
|--------|----------------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                                   | $(R^{11})_n$      | A                             | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-191  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                          | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-Cl-pyridin-2-yl               | -            |
| H-192  | 2- <sup>n</sup> Bu                                             | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-193  | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                        | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-194  | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)                          | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-195  | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                                        | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-196  | 2-(OEt)                                                        | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-197  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                          | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-198  | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                                          | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-199  | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                          | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-200  | 2-(O <sup>s</sup> Bu)                                          | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-201  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)                           | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-202  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)                           | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-203  | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                          | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-204  | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                        | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-205  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)<br>CH <sub>3</sub> )                | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-206  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )<br>CH <sub>3</sub> ) | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-207  | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                         | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-208  | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                     | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-209  | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                        | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-210  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                       | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-211  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C<br>(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )  | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-212  | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                      | 4-Br              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0222]

[表11]

| 表1(続き) |                                    |                             |                            |                         |              |
|--------|------------------------------------|-----------------------------|----------------------------|-------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                       | $(R^{11})_n$                | A                          | $Cy^2-(R^{20})_p$       | $(R^{21})_r$ |
| H-213  | 2-(OAc)                            | 4-Br                        | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-214  | 2-(OCO $_2^i$ Pr)                  | 4-Br                        | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-215  | 2-(OCONH $^i$ Pr)                  | 4-Br                        | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-216  | 2-(OSO $_2CF_3$ )                  | 4-Br                        | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-217  | 2-(NHCH $_2^i$ Pr)                 | 4-Br                        | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-218  | 2-(CO $_2$ Et)                     | 4-Br                        | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-219  | 2-(S $^n$ Pr)                      | 4-Br                        | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-220  | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)             | 4-Br                        | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-221  | 2-(OCH $_2^i$ Pr)                  | 4-CH( $CF_3$ ) $_2$         | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-222  | 2-(OCH $_2^o$ Pr)                  | 4-CH( $CF_3$ ) $_2$         | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-223  | 2-(CH $_2$ OCH(OCH $_3$ )CH $_3$ ) | 4-CF( $CF_3$ ) $_2$         | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-224  | 2-(CO $_2^i$ Pr)                   | 4-CF( $CF_3$ ) $_2$         | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-225  | 2-(O $^n$ Pr)                      | 4-C( $CF_3$ ) $_2$ OCH $_3$ | $C_3H_6$                   | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-226  | 2- $^n$ Bu                         | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-227  | 2-(CH $_2$ CH=CH $_2$ )            | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-228  | 2-(CH $_2$ O $^i$ Pr)              | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-229  | 2-(CH $_2$ OEt)                    | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-230  | 2-(OEt)                            | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-231  | 2-(O $^n$ Pr)                      | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-232  | 2-(O $^i$ Pr)                      | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-233  | 2-(O $^n$ Bu)                      | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-234  | 2-(O $^s$ Bu)                      | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |
| H-235  | 2-(OCH $_2^i$ Pr)                  | 4- $CF_3$                   | CH $_2$ N(CH $_3$ )CH $_2$ | 5- $CF_3$ -pyridin-2-yl | -            |

[0223]

[表12]

| 表1(続き) |                                                                |                   |                                                    |                                 |              |
|--------|----------------------------------------------------------------|-------------------|----------------------------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                                   | $(R^{11})_n$      | A                                                  | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-236  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                           | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-237  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Bu)                           | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-238  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)                           | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-239  | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-240  | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-241  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)<br>CH <sub>3</sub> )                | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-242  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )<br>CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-243  | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                         | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-244  | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-245  | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-246  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-247  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C<br>(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-248  | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-249  | 2-(OAc)                                                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-250  | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                           | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-251  | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-252  | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-253  | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-254  | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                                         | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-255  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                            | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-256  | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0224]

[表13]

| 表1(続き) |                                                            |                   |                                                    |                                 |              |
|--------|------------------------------------------------------------|-------------------|----------------------------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                               | $(R^{11})_n$      | A                                                  | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-257  | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-258  | 2-nBu                                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-259  | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-260  | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-261  | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-262  | 2-(OEt)                                                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-263  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-264  | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-265  | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-266  | 2-(O <sup>s</sup> Bu)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-267  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-268  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-269  | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-270  | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-271  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub> )                | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-272  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-273  | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-274  | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                 | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-275  | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-276  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-277  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0225]

[表14]

| 表1(続き) |                                         |                   |                                                 |                                 |              |
|--------|-----------------------------------------|-------------------|-------------------------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                            | $(R^{11})_n$      | A                                               | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-278  | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)               | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-279  | 2-(OAc)                                 | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-280  | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-281  | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)               | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-282  | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-283  | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-284  | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-285  | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-286  | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-287  | 2- <sup>n</sup> Bu                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-288  | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-289  | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-290  | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                 | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-291  | 2-(OEt)                                 | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-292  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-293  | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-294  | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-295  | 2-(O <sup>s</sup> Bu)                   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-296  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-297  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-298  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-299  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-300  | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-301  | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                 | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0226]

[表15]

| 表1(続き) |                                                            |                   |                                                 |                                 |              |
|--------|------------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                               | $(R^{11})_n$      | A                                               | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-302  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub> )                | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-303  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-304  | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-305  | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                 | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-306  | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-307  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-308  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-309  | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-310  | 2-(OAc)                                                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-311  | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-312  | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                                  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-313  | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-314  | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-315  | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-316  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-317  | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-318  | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-319  | 2- <sup>n</sup> Bu                                         | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-320  | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0227]

[表16]

| 表1(続き) |                                                                |                   |                                  |                                 |              |
|--------|----------------------------------------------------------------|-------------------|----------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                                   | $(R^{11})_n$      | A                                | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-321  | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-322  | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-323  | 2-(OEt)                                                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-324  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-325  | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-326  | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-327  | 2-(O <sup>s</sup> Bu)                                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-328  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)                           | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-329  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu)                           | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-330  | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                          | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-331  | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-332  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)<br>CH <sub>3</sub> )                | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-333  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )<br>CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-334  | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                         | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-335  | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )O<br>CH <sub>3</sub> )                 | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-336  | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-337  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-338  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C<br>(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-339  | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-340  | 2-(OAc)                                                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-341  | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                           | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0228]

[表17]

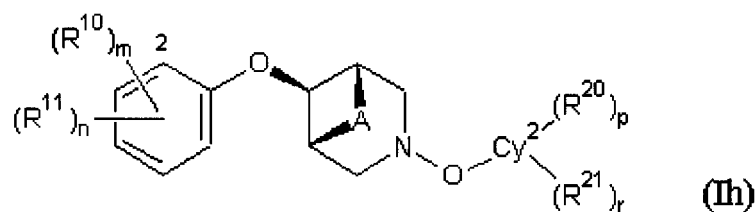
| 表1(続き) |                                             |                                 |                                                                  |                                                  |                                 |
|--------|---------------------------------------------|---------------------------------|------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------|---------------------------------|
| 化合物番号  | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>             | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                                                | Cy <sup>2</sup> -(R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> |
| H-342  | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                   | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-343  | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-344  | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-345  | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                      | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-346  | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-347  | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                      | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-348  | 2- <sup>n</sup> Bu                          | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-349  | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )     | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-350  | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-351  | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                     | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-352  | 2-(OEt)                                     | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-353  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-354  | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-355  | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-356  | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-357  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-358  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr)        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-359  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu)        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-360  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-361  | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-362  | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                     | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |
| H-363  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl                  | -                               |

[0229]

[表18]

| 表1(続き) |                                                            |                   |                                                                  |                                 |              |
|--------|------------------------------------------------------------|-------------------|------------------------------------------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                               | $(R^{11})_n$      | A                                                                | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| H-364  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-365  | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-366  | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                 | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-367  | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-368  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                   | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-369  | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-370  | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-371  | 2-(OAc)                                                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-372  | 2-(OCO <sup>i</sup> Pr)                                    | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-373  | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                                  | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-374  | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-375  | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-376  | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-377  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-378  | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| H-379  | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0230] [化34]



[0231]

[表19]

表2

| 化合物<br>番号 | $(R^{10})_m$                                               | $(R^{11})_n$      | A                                | $Cy^2-(R^{20})_p$                             | $(R^{21})_r$ |
|-----------|------------------------------------------------------------|-------------------|----------------------------------|-----------------------------------------------|--------------|
| J-21      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| J-22      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| J-23      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| J-24      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| J-25      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| J-26      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| J-27      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| J-28      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| J-29      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| J-30      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| J-31      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| J-32      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| J-33      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| J-34      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| J-35      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| J-36      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| J-37      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| J-38      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| J-39      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| J-40      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| J-41      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| J-42      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| J-43      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| J-44      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl               | -            |
| J-45      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |

[0232]

[表20]

表2(続き)

| 化合物<br>番号 | $(R^{10})_m$                                               | $(R^{11})_n$      | A                                | $Cy^2-(R^{20})_p$                             | $(R^{21})_r$ |
|-----------|------------------------------------------------------------|-------------------|----------------------------------|-----------------------------------------------|--------------|
| J-46      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>°</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| J-47      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| J-48      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 6-CF <sub>3</sub> -pyridazin-3-yl             | -            |
| J-49      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| J-50      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>°</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| J-51      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| J-52      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyrimidin-2-yl             | -            |
| J-53      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| J-54      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>°</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| J-55      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| J-56      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl               | -            |
| J-57      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| J-58      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>°</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| J-59      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |
| J-60      | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -<br>[1,3,4]thiadiazol-2-yl | -            |

[0233]

[表21]

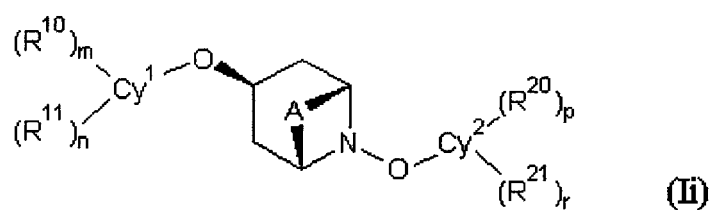
| 表2(続き) |                                                           |                   |                               |                                 |              |
|--------|-----------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|---------------------------------|--------------|
| 化合物番号  | $(R^{10})_m$                                              | $(R^{11})_n$      | A                             | $Cy^2-(R^{20})_p$               | $(R^{21})_r$ |
| J-61   | 2-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-62   | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CN-pyridin-2-yl               | -            |
| J-63   | 2-(OEt)                                                   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-64   | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-65   | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-66   | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 6-CN-pyridazin-3-yl             | -            |
| J-67   | 2-OH                                                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-68   | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-69   | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-70   | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-71   | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-72   | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                                   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-73   | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-74   | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-75   | 2-(O <sup>s</sup> Bu)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-76   | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-77   | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-78   | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-79   | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-80   | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-81   | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> )                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-82   | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-83   | 2-(OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-84   | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-85   | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-86   | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |
| J-87   | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | -            |

[0234]

[表22]

| 表2(続き) |                                                                   |                   |                                  |                                 |   |
|--------|-------------------------------------------------------------------|-------------------|----------------------------------|---------------------------------|---|
| J-88   | 2-(OAc)                                                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-89   | 2-(OCH <sub>2</sub> [2,2-Cl <sub>2</sub> -3-Ph- <sup>o</sup> Pr]) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-90   | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-91   | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-92   | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-93   | 2-(O <sup>o</sup> Pen)                                            | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-94   | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                                         | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-95   | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-96   | 2-Ph                                                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-97   | 2-(pyridin-3-yl)                                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-98   | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-99   | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-100  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                             | 4-Cl              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-101  | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>4</sub> H <sub>8</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |
| J-102  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                              | 4-Cl              | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> -pyridin-2-yl | - |

[0235] [化35]



[0236]

[表23]

表3

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub> | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub>                            | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| K-5       | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-6       | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-7       | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-8       | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-9       | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-10      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-11      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-12      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-18      | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-19      | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-20      | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-21      | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-22      | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-23      | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-24      | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-25      | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-30      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-31      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-32      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-33      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-34      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-35      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-36      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| K-37      | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |

[0237]

[表24]

表3 (続き)

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                            | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|
| K-38      | pyridin-3-yl    | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                      | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-39      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu                                         | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-40      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-41      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                        | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-42      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-43      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-44      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )                  | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-45      | pyrazol-5-yl    | 1-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-46      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-47      | pyrazol-5-yl    | 1-([1,3]dioxolan-2-yl)                                     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-48      | pyrazol-5-yl    | 2-(CH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-49      | pyrazol-5-yl    | 2-(CH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                        | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-50      | pyrazol-5-yl    | 2- <sup>n</sup> Bu                                         | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-51      | pyrazol-5-yl    | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-52      | pyrazol-5-yl    | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-53      | pyrazol-5-yl    | 2-(CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )                  | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-54      | pyrazol-5-yl    | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-55      | pyrazol-5-yl    | 2-(CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-56      | pyrazol-5-yl    | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                                     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-57      | pyrazol-5-yl    | 1,3-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                        | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-58      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-CH <sub>3</sub>                       | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-59      | pyrazol-5-yl    | 1-CH <sub>3</sub>                                          | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-60      | pyrazol-5-yl    | 1-Et                                                       | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-61      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Pr                                         | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-62      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Pen                                        | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |

[0238]

[表25]

表3(続き)

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|
| K-63      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Hex                            | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-64      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>i</sup> Pr                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-65      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>t</sup> Bu                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-66      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )        | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-67      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CN)                         | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-68      | pyrazol-5-yl    | 1-((CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CN)         | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-69      | pyrazol-5-yl    | 1-Bn                                           | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-70      | pyrazol-5-yl    | 1-(2-Cl-Bn)                                    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-71      | pyrazol-5-yl    | 1-Ph                                           | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-72      | pyrazol-5-yl    | 1-(3-Cl-Ph)                                    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-73      | pyrazol-5-yl    | 1-(3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph)                    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-74      | pyrazol-5-yl    | 1-(Py-2-yl)                                    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-75      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu                             | 3-CF <sub>3</sub><br>4-Cl       | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-76      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu                             | 3-CF <sub>3</sub><br>4-Br       | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-77      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-4-Ph                        | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-78      | pyrazol-5-yl    | 1-CH <sub>3</sub> -4-(CHO)                     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-79      | pyrazol-5-yl    | 1-CH <sub>3</sub> -4-(CH=NOCH <sub>3</sub> )   | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-80      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-4-(CHO)                     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-81      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-Ph                        | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-82      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-(3-Cl-Ph)                 | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-83      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-(4-Cl-Ph)                 | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-84      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-(3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph) | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-85      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-(3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph) | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |

[0239]

[表26]

表3(続き)

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                   | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|-------------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|
| K-86      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu                                                | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            |
| K-87      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu                                                | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | 5-NO <sub>2</sub>               | —                               |
| K-88      | pyrazol-5-yl    | 1-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)                                         | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-89      | pyrazol-5-yl    | 1-(3-CH <sub>3</sub> -Ph)                                         | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-90      | pyrazol-5-yl    | 1-(Py-2-yl)<br>3-(3,4,5-F <sub>3</sub> -Ph)                       | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-91      | pyrazol-5-yl    | 1-(Py-2-yl)<br>3-(3,5-F <sub>2</sub> -Ph)                         | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-92      | pyrazol-5-yl    | 1-(3-Cl-Py-2-yl)                                                  | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-93      | pyrazol-5-yl    | 1-(6-CH <sub>3</sub> -Py-2-yl)                                    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-94      | pyrazol-5-yl    | 1-(4-CF <sub>3</sub> -thiazol-2-yl)                               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-95      | pyrazol-5-yl    | 1,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-96      | pyrazol-5-yl    | 1-CH <sub>3</sub> -4-(CH <sub>2</sub> OH)                         | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-97      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-4-CH <sub>3</sub>                              | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-98      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu<br>3-(3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Ph) | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-99      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-(3,5-F <sub>2</sub> -Ph)                     | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-100     | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-(3,4,5-F <sub>3</sub> -Ph)                   | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-101     | pyrazol-5-yl    | 1,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -3-(CO <sub>2</sub> Et)       | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-102     | pyrazol-5-yl    | 1-CH <sub>3</sub>                                                 | 4-Cl<br>3-CF <sub>3</sub>       | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-103     | pyrazol-5-yl    | —                                                                 | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-104     | pyrazol-5-yl    | 1-(C(=O) <sup>t</sup> Bu)                                         | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-105     | pyrazol-5-yl    | 1-(Py-2-yl)<br>3-(3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph)                        | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-106     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |

[0240]

[表27]

表3(続き)

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                         | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|-------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|
| K-107     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> OEt)                                                 | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-108     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                   | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-109     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt)                                 | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-110     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH(OEt) <sub>2</sub> )                               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-111     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-112     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(OEt) <sub>2</sub> )               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-113     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> ([1,3]dioxolan-2-yl))                                | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-114     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> (tetrahydro-furan-2-yl))                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-115     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ([1,3]dioxolan-2-yl))                | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-116     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ([1,3]dioxan-2-yl))                  | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-117     | pyrazol-5-yl    | 1-Ac                                                                    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-118     | pyrazol-5-yl    | 1-(C(=O)Et)                                                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-119     | pyrazol-5-yl    | 1-(C(=O) <sup>n</sup> Pr)                                               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-120     | pyrazol-5-yl    | 1-(C(=O) <sup>n</sup> Bu)                                               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-121     | pyrazol-5-yl    | 1-(C(=O)Ph)                                                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-122     | pyrazol-5-yl    | 1-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                                    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-123     | pyrazol-5-yl    | 1-(CO <sub>2</sub> Et)                                                  | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-124     | pyrazol-5-yl    | 1-(CO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr)                                     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-125     | pyrazol-5-yl    | 1-(CO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu)                                     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-126     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CHO)                                                 | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-127     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CHO)                                 | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |

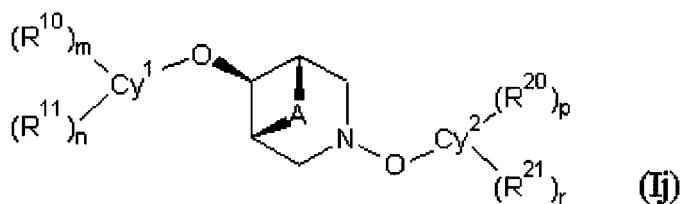
[0241]

[表28]

表3(続き)

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                                    | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|
| K-128     | pyrazol-5-yl    | 1-CH <sub>3</sub> -4-(CH=NOH)                                                      | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-129     | pyrazol-5-yl    | 1-CH <sub>3</sub> -4-(CH=NOEt)                                                     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-130     | pyrazol-5-yl    | 3-(3,5-F <sub>2</sub> -Ph)                                                         | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-131     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-3-(3,5-F <sub>2</sub> -Ph) | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-132     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> ([1,3]dioxolan-2-yl))-3-(3,5-F <sub>2</sub> -Ph)                | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-133     | pyrazol-5-yl    | 1-(Py-2-yl)-3-(thiophen-2-yl)                                                      | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-134     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                            | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-135     | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(Et) <sub>2</sub> )                           | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| K-136     | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>i</sup> Pen                                                                | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |

[0242] [化36]



[0243] [表29]

表4

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub> | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub>                            | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| L-5       | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-6       | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-7       | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-8       | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-9       | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-10      | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-11      | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-12      | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-18      | pyridazin-3-yl  | -                               | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-19      | pyridazin-3-yl  | -                               | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-20      | pyridazin-3-yl  | -                               | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-21      | pyridazin-3-yl  | -                               | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-22      | pyridazin-3-yl  | -                               | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-23      | pyridazin-3-yl  | -                               | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-24      | pyridazin-3-yl  | -                               | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-25      | pyridazin-3-yl  | -                               | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |

[0244] [表30]

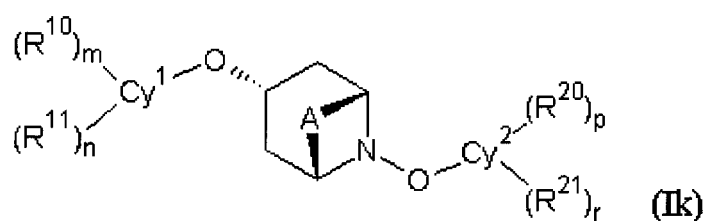
| 表4(続き) |                 |                                 |                                 |                               |                 |                                                           |                                 |
|--------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------|-----------------------------------------------------------|---------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub> | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub>                           | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
| L-26   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                      | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-27   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-28   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OEt)                                                   | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-29   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                     | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-30   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                    | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-31   | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-32   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-OH                                                      | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-33   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                     | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-34   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                                    | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-35   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)                     | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-36   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-37   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                                   | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-38   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                     | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-39   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                                     | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-40   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                     | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-41   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                      | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-42   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-43   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                  | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-44   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-45   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)                      | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-46   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> )                 | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-47   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                 | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-48   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-49   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)                      | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-50   | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                   | 4-CF <sub>3</sub>               |

[0245]

[表31]

| 表4 (続き) |                 |                                 |                                 |                                  |                 |                                                                   |                                 |
|---------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|-----------------|-------------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| 化合物番号   | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub> | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub>                                   | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
| L-51    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-52    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                                            | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-53    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OAc)                                                           | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-54    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> [2,2-Cl <sub>2</sub> -3-Ph- <sup>o</sup> Pr]) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-55    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                           | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-56    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-57    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-58    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(O <sup>o</sup> Pen)                                            | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-59    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                                         | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-60    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                             | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-61    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-Ph                                                              | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-62    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(pyridin-3-yl)                                                  | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-63    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(S <sup>o</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-64    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                           | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-65    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                             | 4-Cl                            |
| L-66    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>4</sub> H <sub>8</sub>    | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub>               |
| L-67    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                              | 4-Cl                            |

[0246] [化37]



[0247]

[表32]

表5

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                            | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|
| M-5       | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-6       | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-7       | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-8       | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-9       | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-10      | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-11      | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-12      | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-17      | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| M-18      | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| M-19      | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| M-20      | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| M-21      | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| M-22      | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>c</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| M-23      | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| M-24      | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |

[0248]

[表33]

| 表5(続き) |                 |                                        |                                 |                               |                 |                                 |                                 |
|--------|-----------------|----------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>        | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
| M-25   | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-26   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CN                            |
| M-27   | Ph              | 2-(OEt)                                | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-28   | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-29   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-30   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridazin-3-yl  | —                               | 6-CN                            |
| M-31   | Ph              | 2-OH                                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-32   | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-33   | Ph              | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                 | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-34   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-35   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-36   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-37   | Ph              | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-38   | Ph              | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-39   | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-40   | Ph              | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-41   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |

[0249]

[表34]

| 表5(続き) |                 |                                                                   |                                 |                               |                 |                                 |                                 |
|--------|-----------------|-------------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                   | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
| M-42   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                          | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-43   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-44   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-45   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> )                         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-46   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-47   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> )         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-48   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-49   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-50   | Ph              | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-51   | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                                            | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-52   | Ph              | 2-(OAc)                                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-53   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> [2,2-Cl <sub>2</sub> -3-Ph- <sup>c</sup> Pr]) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-54   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-55   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-56   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-57   | Ph              | 2-(O <sup>c</sup> Pen)                                            | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-58   | Ph              | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                                         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |

[0250]

[表35]

| 表5(続き) |                 |                                         |                                 |                                  |                 |                                                            |                                 |
|--------|-----------------|-----------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>         | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub>                            | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
| M-59   | Ph              | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-60   | Ph              | 2-Ph                                    | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-61   | Ph              | 2-(pyridin-3-yl)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-62   | Ph              | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-63   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-64   | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                   | 4-Cl                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-65   | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>4</sub> H <sub>8</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-66   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)    | 4-Cl                            | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-67   | pyridin-2-yl    | —                                       | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-68   | pyridin-2-yl    | —                                       | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-69   | pyridin-2-yl    | —                                       | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-70   | pyridin-2-yl    | —                                       | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-71   | pyridin-2-yl    | —                                       | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-72   | pyridin-2-yl    | —                                       | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-73   | pyridin-2-yl    | —                                       | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-74   | pyridin-2-yl    | —                                       | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-75   | Pyridazin-3-yl  | —                                       | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |

[0251]

[表36]

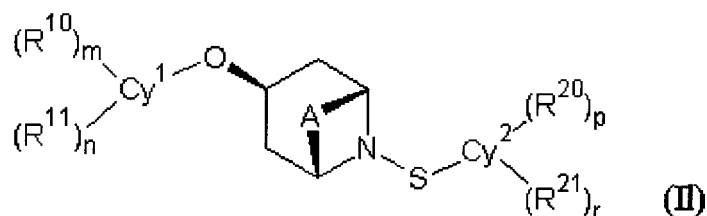
| 表5(続き) |                 |                                                         |                                 |                                  |                 |                                                            |                                 |
|--------|-----------------|---------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                         | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub>                            | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
| M-76   | Pyridazin-3-yl  | —                                                       | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-77   | Pyridazin-3-yl  | —                                                       | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-78   | Pyridazin-3-yl  | —                                                       | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-79   | Pyridazin-3-yl  | —                                                       | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-80   | Pyridazin-3-yl  | —                                                       | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-81   | Pyridazin-3-yl  | —                                                       | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-82   | Pyridazin-3-yl  | —                                                       | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| M-83   | Pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu                                      | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-84   | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-85   | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Pen                                     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-86   | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Hex                                     | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-87   | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>i</sup> Pr                                      | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-88   | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                 | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-89   | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CN)                                  | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-90   | pyrazol-5-yl    | 1-Bn                                                    | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-91   | pyrazol-5-yl    | 1-(Py-2-yl)                                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | —                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |

[0252]

[表37]

| 表5(続き) |                 |                                                                                    |                                 |                               |                 |                                 |                                 |
|--------|-----------------|------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                                    | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
| M-92   | pyrazol-5-yl    | 1- <sub>n</sub> Bu-3-(3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Ph)                     | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-93   | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-(3,5-F <sub>2</sub> -Ph)                                      | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-94   | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu-3-(3,4,5-F <sub>3</sub> -Ph)                                    | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-95   | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                                              | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-96   | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> OEt)                                                            | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-97   | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                              | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-98   | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt)                                            | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-99   | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH(OEt) <sub>2</sub> )                                          | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-100  | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )            | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-101  | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(OEt) <sub>2</sub> )                          | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-102  | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> ([1,3]dioxolan-2-yl))                                           | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| M-103  | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-3-(3,5-F <sub>2</sub> -Ph) | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-2-yl    | -                               | 5-CF <sub>3</sub>               |

[0253] [化38]



[0254]

[表38]

表6

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                            | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup>    | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|--------------------|---------------------------------|---------------------------------|
| N-1       | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-<br>2-yl   | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-2       | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-<br>2-yl   | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-3       | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-<br>2-yl   | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-4       | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-<br>2-yl   | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-5       | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridin-<br>2-yl   | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-6       | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridin-<br>2-yl   | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-7       | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridin-<br>2-yl   | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-8       | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridin-<br>2-yl   | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-9       | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridazin-<br>3-yl | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| N-10      | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridazin-<br>3-yl | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| N-11      | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridazin-<br>3-yl | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| N-12      | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridazin-<br>3-yl | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| N-13      | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridazin-<br>3-yl | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| N-14      | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridazin-<br>3-yl | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |
| N-15      | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridazin-<br>3-yl | —                               | 6-CF <sub>3</sub>               |

[0255]

[表39]

表6(続き)

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup>    | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>     | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup>    | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub>                            | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| N-16      | Ph                 | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | pyridazin<br>-3-yl | -                                                          | 6-CF <sub>3</sub>               |
| N-17      | pyridin-<br>2-yl   | -                                   | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph                 | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-18      | pyridin-<br>2-yl   | -                                   | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph                 | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-19      | pyridin-<br>2-yl   | -                                   | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph                 | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-20      | pyridin-<br>2-yl   | -                                   | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph                 | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-21      | pyridin-<br>2-yl   | -                                   | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph                 | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-22      | pyridin-<br>2-yl   | -                                   | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph                 | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-23      | pyridin-<br>2-yl   | -                                   | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph                 | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-24      | pyridin-<br>2-yl   | -                                   | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph                 | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-25      | pyridazin<br>-3-yl | -                                   | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph                 | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-26      | pyridazin<br>-3-yl | -                                   | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph                 | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-27      | pyridazin<br>-3-yl | -                                   | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph                 | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-28      | pyridazin<br>-3-yl | -                                   | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | Ph                 | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-29      | pyridazin<br>-3-yl | -                                   | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph                 | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-30      | pyridazin<br>-3-yl | -                                   | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph                 | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               |

[0256]

[表40]

表6(続き)

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                   | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                | Cy <sup>2</sup> | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub>                            | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|-----------------|-------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|-----------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|
| N-31      | pyridazin-3-yl  | -                                                                 | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-32      | pyridazin-3-yl  | -                                                                 | 6-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> iPr)                                    | 4-CF <sub>3</sub>               |
| N-33      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu                                                | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-34      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )           | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-35      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Pen                                               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-36      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Hex                                               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-37      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>i</sup> Pr                                                | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-38      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                           | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-39      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> CN)                                            | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-40      | pyrazol-5-yl    | 1-Bn                                                              | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-41      | pyrazol-5-yl    | 1-(Py-2-yl)                                                       | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-42      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu<br>3-(3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -Ph) | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-43      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu<br>3-(3,5-F <sub>2</sub> -Ph)                  | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-44      | pyrazol-5-yl    | 1- <sup>n</sup> Bu<br>3-(3,4,5-F <sub>3</sub> -Ph)                | -                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-45      | pyrazol-5-yl    | 1-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               |

[0257]

[表41]

表6(続き)

| 化合物<br>番号 | Cy <sup>1</sup>  | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                                       | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             | Cy <sup>2</sup>  | (R <sup>21</sup> ) <sub>r</sub> | (R <sup>20</sup> ) <sub>p</sub> |
|-----------|------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|------------------|---------------------------------|---------------------------------|
| N-46      | pyrazol-<br>5-yl | 1-(CH <sub>2</sub> OEt)                                                               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-<br>2-yl | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-47      | pyrazol-<br>5-yl | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                                 | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-<br>2-yl | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-48      | pyrazol-<br>5-yl | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt)                                               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-<br>2-yl | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-49      | pyrazol-<br>5-yl | 1-(CH <sub>2</sub> CH(OEt) <sub>2</sub> )                                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-<br>2-yl | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-50      | pyrazol-<br>5-yl | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )               | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-<br>2-yl | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-51      | pyrazol-<br>5-yl | 1-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(OEt) <sub>2</sub> )                             | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-<br>2-yl | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-52      | pyrazol-<br>5-yl | 1-(CH <sub>2</sub> ([1,3]dioxolan-2-<br>yl))                                          | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-<br>2-yl | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |
| N-53      | pyrazol-<br>5-yl | 1-(CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )<br>3-(3,5-F <sub>2</sub> -Ph) | —                               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> | pyridin-<br>2-yl | —                               | 5-CF <sub>3</sub>               |

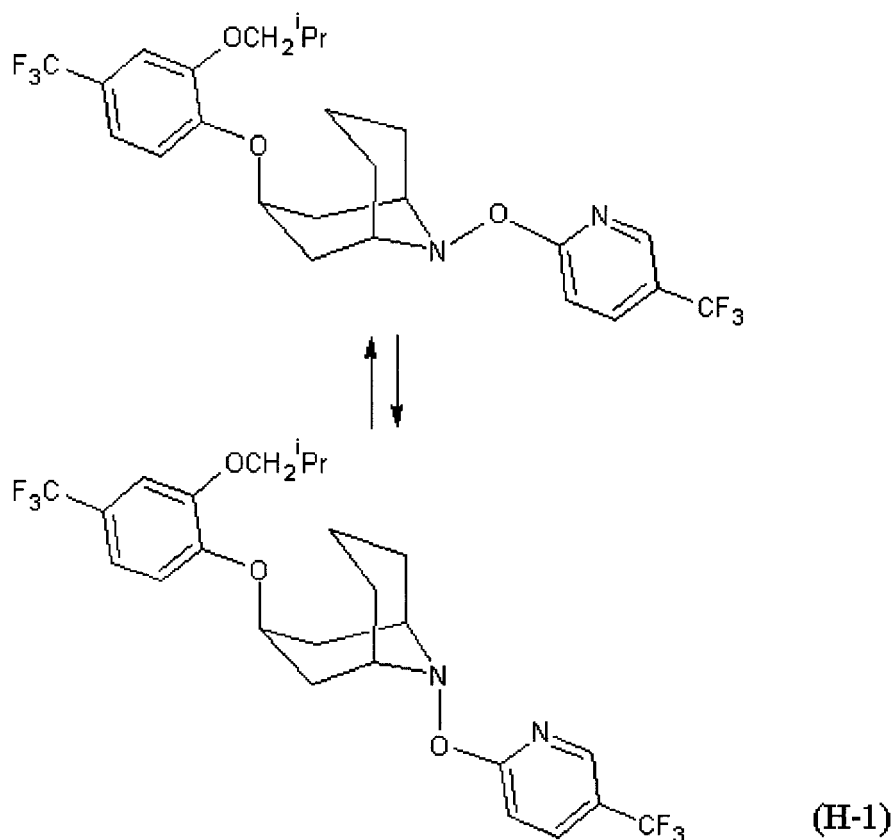
[0258] 表1～6に例示した化合物のうちの一部の化合物について物理定数を示す。  
なお、「vis」は「viscous oil」を意味する。

[0259] 化合物H-1 : vis ; <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm, 測定温度25°C) 8.49(s, 1H), 7.90–7.86(m, 1H), 7.39(d, 0.8H), 7.26(d, 0.2H), 7.15(d, 1H), 7.08(s, 1H), 6.91(d, 1H), 4.91–4.89(m, 0.8H), 4.65(m, 0.2H), 3.78(d, 2H), 3.59( brs, 2H), 2.76–2.30(m, 3H), 2.16–2.04(m, 3H), 1.83–1.67(m, 4H), 1.41–1.37(m, 1H), 1.07(d-like, 6H)

なお、化合物H-1は、下式のような、9-アザビシクロ [3. 3. 1] ノナン環の7位のメチレンと9位のピリジルオキシとの間の距離が近い化合物と、それが遠い化合物との2種の配座異性の混合物と推定される。

[0260]

[化39]



[0261] 化合物H-2 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度20.2°C) 8.49(s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.17(d, 1H), 7.08(s, 1H), 6.95(d, 1H), 5.00–4.92(m, 0.8H), 4.67(m, 0.2H), 3.87(d, 2H), 3.59(brs, 2H), 2.75–2.41(m, 3H), 2.14–2.05(m, 2H), 1.83–1.71(m, 3H), 1.43–1.24(m, 3H), 0.66–0.60(m, 2H), 0.39–0.35(m, 2H)

[0262] 化合物H-5 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度22.7°C) 7.77(d, 1H), 7.68(d, 1H), 7.17(d, 1H), 7.08(s, 1H), 6.91(d, 1H), 4.95–4.90(m, 0.7H), 4.63(m, 0.3H), 3.78(d, 2H), 3.62(brs, 2H), 2.80–2.43(m, 2H), 2.19–2.03(m, 2H), 1.85–1.75(m, 2H), 1.41–1.37(m, 1H), 1.05(d, 6H)

[0263] 化合物H-41 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度20.7°C) 8.53(d, 1H), 7.90(dd, 1H), 7.40(d, 1H), 7.16(d, 1H), 7.08(s, 1H), 6.90(s, 1H), 4.90–4.85(m, 0.7H), 4.60(m, 0.3H), 3.78(d, 2H), 3.58(brs, 2H), 2.74–2.40(m, 3H), 2.18–2.05(m, 3H), 1.82–1.72(m, 3H), 1.41–1.34(m, 2H)

, 1.06(d, 6H)

[0264] 化合物H-42 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度22.3°C) 8.49 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.17(d, 1H), 7.09(s, 1H), 6.95(d, 1H), 4.98–4.94(m, 0.8H), 4.60(m, 0.2H), 4.10(q, 2H), 3.59(brs, 2H), 2.74–2.40(m, 3H), 2.11–2.05(m, 2H), 1.81–1.69(m, 3H), 1.49–1.37(m, 5H)

[0265] 化合物H-43 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.3°C) 8.49 (s, 1H), 7.87(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.17(d, 1H), 7.09(s, 1H), 6.92(d, 1H), 4.95–4.90(m, 0.9H), 4.60(m, 0.1H), 3.98(t, 2H), 3.59(brs, 2H), 2.75–2.40(m, 3H), 2.14–2.04(m, 2H), 1.89–1.69(m, 6H), 1.41–1.36(m, 1H), 1.08(t, 3H)

[0266] 化合物K-8 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.0°C) 8.44(d, 1H), 8.04(d, 1H), 7.79–7.63(m, 3H), 6.81(d, 1H), 5.78(m, 0.7H), 5.50(m, 0.3H), 5.32–5.24(m, 1H), 3.57(brs, 2H), 2.78–2.68(m, 2H), 2.42–1.90(m, 4H), 1.77–1.60(m, 2H), 1.45–1.26(m, 8H)

[0267] 化合物K-12 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度20.8°C) 8.43 (s, 1H), 8.07(d, 1H), 7.76(dd, 1H), 7.68(d, 1H), 7.26(s, 1H), 6.84(d, 1H), 5.69–5.64(m, 0.7H), 5.51(m, 0.3H), 5.33–5.24(m, 1H), 4.47(d, 0.5H), 4.00(dd, 3.5H), 3.54–3.27(d, d, d, 2H), 2.85–2.68(m, 2H), 2.27(d, 0.3H), 1.91(d, 1.7H), 1.41(d, 6H)

[0268] 化合物H-51 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.2°C) 8.49 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.40–7.35(d, d, total 2H), 7.26(s, 1H), 6.98(d, 1H), 5.22(s, 2H), 5.06–5.01(m, 1H), 3.62(brs, 2H), 3.53(s, 3H), 2.75–2.65(m, 2H), 2.50–2.39(m, 1H), 2.14–2.04(m, 2H), 1.79–1.67(m, 3H), 1.45–1.33(m, 2H)

[0269] 化合物H-52 : 融点[107–110°C]

[0270] 化合物H-53 : 融点[141–144°C]

[0271] 化合物H-54 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.3°C) 8.49 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.17(d, H), 7.08(s, 1H), 6.92(d,

1H), 4.93–4.91(m, 1H), 4.01(t, 2H), 3.59(brs, 2H), 2.74–2.40(m, 3H), 2.14–2.05(m, 2H), 1.86–1.74(m, 5H), 1.70–1.49(m, 2H), 1.41–1.39(m, 2H), 1.01(t, 3H)

[0272] 化合物H-55 : vis ; <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm, 測定温度21.3°C) 8.50 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.80(s, 1H), 7.58(d, 1H), 7.36(d, 1H), 6.99(d, 1H), 6.16(s, 1H), 5.12–5.09(m, 1H), 4.19–4.01(m, 4H), 3.64(brs, 2H), 2.77–2.03(m, 3H), 1.80–1.66(m, 3H), 1.47–1.35(m, 2H)

[0273] 化合物H-56 : <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm, 測定温度22.1°C) 8.51(s, 1H), 7.89(dd, 1H), 7.71(s, 1H), 7.49(d, 1H), 7.38(d, 1H), 6.92(d, 1H), 5.08–5.04(m, 1H), 4.57(s, 2H), 3.77–3.67(m, brs, total 3H), 2.79–2.69(m, 2H), 2.44–2.02(m, 3H), 1.80–1.59(m, 3H), 1.48–1.44(m, 2H), 1.25(d, 6H)

[0274] 化合物H-57 : vis ; <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm, 測定温度21.3°C) 8.50 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.66(s, 1H), 7.51(d, 1H), 7.39(d, 1H), 6.93(d, 1H), 5.07–5.03(m, 1H), 4.52(s, 2H), 3.65(brs, 2H), 3.50(s, 3H), 2.79–2.68(m, 2H), 2.40–2.02(m, 3H), 1.80–1.61(m, 3H), 1.40–1.30(m, 2H)

[0275] 化合物H-58 : vis ; <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm, 測定温度21.3°C) 8.50 (s, 1H), 7.88(d, 1H), 7.69(s, 1H), 7.50(d, 1H), 7.38(d, 1H), 6.93(d, 1H), 5.04(m, 1H), 4.57(s, 2H), 3.66–3.58(brs, q, total 4H), 2.78–2.68(m, 2H), 2.40–2.04(m, 3H), 1.79–1.60(m, 3H), 1.40–1.33(m, 2H), 1.26(t, 3H)

[0276] 化合物H-59 : vis ; <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm, 測定温度21.3°C) 8.50 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.36(s, 1H), 6.87(d, 1H), 6.78(s, 1H), 6.74(d, 1H), 5.05–5.01(m, 1H), 4.41(brt, 1H), 3.64(brs, 2H), 2.98(t, 2H), 2.80–2.70(m, 2H), 2.44–1.90(m, 4H), 1.80–1.65(m, 3H), 1.49–1.43(m, 2H), 1.01(d, 6H)

[0277] 化合物H-60 : vis ; <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm, 測定温度21.2°C) 8.49

(s, 1H), 7.87(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.18(d, 1H), 7.13(s, 1H), 6.94(d, 1H), 4.97-4.92(m, 1H), 4.59-4.50(m, 1H), 3.59(brs, 2H), 2.74-2.41(m, 3H), 2.14-2.05(m, 2H), 1.81-1.69(m, 3H), 1.42-1.35(m, d, total 8H)

[0278] 化合物H-61 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.7°C) 8.49 (s, 1H), 7.87(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.16(d, 1H), 7.10(d, 1H), 6.93(d, 1H), 4.95-4.91(m, 1H), 4.36-4.30(m, 1H), 3.58(brs, 2H), 2.74-2.40(m, 3H), 2.13-2.04(m, 2H), 1.81-1.56(m, 5H), 1.41-1.33(m, 2H), 1.31(d, 3H), 1.00(t, 3H)

[0279] 化合物H-62 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.6°C) 8.49 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.48(d, 1H), 7.40(d, 1H), 7.36(s, 1H), 7.06(d, 1H), 5.09-5.06(m, 1H), 5.01-4.93(m, 1H), 3.62(brs, 2H), 2.76-2.66(m, 2H), 2.40-2.05(m, 3H), 1.77-1.61(m, 3H), 1.38(d, 6H), 1.45-1.33(m, 2H)

[0280] 化合物H-63 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度19.7°C) 8.50 (s, 1H), 7.89(d, 1H), 7.46(d, 1H), 7.41-7.38(d, s, total 2H), 7.19-7.02(m, 1H), 5.11-5.04(m, 1H), 4.45(d, 1H), 3.63(brs, 2H), 2.76-2.66(m, 2H), 2.44-2.20(m, 1H), 2.11-2.05(m, 2H), 1.80-1.63(m, 3H), 1.49-1.44(m, 2H)

[0281] 化合物H-64 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度22.2°C) 8.49 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.20(d, 1H), 7.10(s, 1H), 6.96(d, 1H), 6.11-6.02(m, 1H), 5.49-5.28(m, 2H), 5.00-4.99(m, 1H), 4.60(d, 2H), 3.61(brs, 2H), 2.75-2.30(m, 3H), 1.82-1.69(m, 3H), 1.45-1.35(m, 2H)

[0282] 化合物H-65 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度22.0°C) 8.49 (s, 1H), 7.87(d, 1H), 7.38(d, 1H), 7.17(d, 1H), 7.10(s, 1H), 6.96(d, 1H), 5.47(t, 2H), 5.01-4.95(m, 1H), 4.58(d, 2H), 3.59(brs, 2H), 2.73-2.40(m, 3H), 2.14-2.02(m, 2H), 1.77(d, 6H), 1.79-1.68(m, 3H), 1.41-

1.37 (m, 2H)

[0283] 化合物H-66 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.7°C) 8.49 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.16(d, 1H), 7.07(s, 1H), 6.88(d, 1H), 4.87-4.82(m, 1H), 3.65(s, 2H), 3.58(brs, 2H), 2.78-2.63(m, 2H), 2.50-2.41(m, 1H), 2.17-2.05(m, 2H), 1.82-1.71(m, 3H), 1.43-1.36(m, 2H), 1.08(s, 9H)

[0284] 化合物H-67 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.7°C) 8.49 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.24(d, 1H), 7.11(s, 1H), 6.97(d, 1H), 6.18(t, 1H), 5.08-5.00(m, 1H), 4.72(d, 2H), 3.62(brs, 2H), 2.74-2.64(m, 2H), 2.49-2.36(m, 1H), 2.15-2.04(m, 2H), 1.80-1.66(m, 3H), 1.45-1.33(m, 2H)

[0285] 化合物H-68 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.7°C) 8.49 (s, 1H), 7.87(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.27-7.25(d, s, total 2H), 6.98(d, 1H), 5.09-5.01(m, 1H), 4.77(s, 2H), 3.63(brs, 2H), 2.74-2.59(m, 2H), 2.54(s, 1H), 2.53-2.35(m, 1H), 2.13-2.01(m, 2H), 1.81-1.67(m, 3H), 1.45-1.33(m, 2H)

[0286] 化合物H-69 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.9°C) 8.49 (s, 1H), 7.87(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.17(d, 1H), 7.10(s, 1H), 6.93(d, 1H), 5.14(s, 1H), 5.00(s, 1H), 4.98-4.93(m, 1H), 4.48(s, 2H), 3.59(brs, 2H), 2.76-2.40(m, 3H), 2.15-2.03(m, 2H), 1.85(s, 3H), 1.80-1.70(m, 3H), 1.43-1.34(m, 2H)

[0287] 化合物H-70 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.5°C) 8.49 (s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.16(d, 1H), 7.07(s, 1H), 6.90(d, 1H), 4.90-4.88(m, 1H), 3.89-3.77(m, 2H), 3.59(brs, 2H), 2.76-2.30(m, 3H), 2.20-2.05(m, 2H), 1.92-1.55(m, 6H), 1.40-1.26(m, 2H), 1.06(d, 3H), 0.97(t, 3H)

[0288] 化合物H-71 : vis ;  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.8°C) 8.50 (s, 1H), 7.89(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.30(s, 1H), 7.06(d, 1H), 5.17-5.

13(m, 1H), 4.86(s, 2H), 3.68(brs, 2H), 2.77–2.66(m, 2H), 2.46–2.02(m, 3H), 1.80–1.62(m, 3H), 1.50–1.45(m, 2H)

[0289] 化合物H-72 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.1°C) 8.49(s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.32(s, 1H), 7.25(d, 1H), 6.98(d, 1H), 5.33(q, 1H), 5.04–5.02(m, 1H), 3.63(brs, 2H), 3.44(s, 3H), 2.76–2.65(m, 2H), 2.50–2.40(m, 1H), 2.17–2.07(m, 2H), 1.80–1.68(m, 3H), 1.53(d, 3H), 1.50–1.30(m, 2H)

[0290] 化合物H-73 : 融点[87–89°C]

[0291] 化合物H-74 : 融点[93–97°C]

[0292] 化合物H-75 : 融点[102–105°C]

[0293] 化合物H-76 : 融点[114–117°C]

[0294] 化合物H-77 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.3°C) 8.50(s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.48(d, 1H), 7.37(d, 1H), 7.32(s, 1H), 7.04(d, 1H), 5.30–5.01(m, 1H), 3.62(brs, 2H), 2.77–2.67(m, 2H), 2.46–2.10(m, 3H), 2.26(s, 3H), 1.77–1.41(m, 5H)

[0295] 化合物H-78 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.2°C) 8.48(s, 1H), 7.86(dd, 1H), 7.38–7.23(m, 8H), 6.97(d, 1H), 4.99–4.95(m, 1H), 4.50(q, 1H), 4.37(d, 2H), 3.56(brs, 2H), 2.73(d, 1H), 2.73–2.64(m, 2H), 2.54–2.47(m, 1H), 2.09–1.99(m, 2H), 1.74–1.68(m, 3H), 1.47–1.35(m, 2H)

[0296] 化合物H-79 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.8°C) 8.50(s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.28(d, 1H), 7.04(s, 1H), 6.98(d, 1H), 5.07–5.04(m, 1H), 4.57(s, 2H), 3.60(brs, 2H), 2.78–2.35(m, 3H), 2.35(s, 3H), 2.27–2.07(m, 2H), 1.79–1.61(m, 3H), 1.58–1.40(m, 2H)

[0297] 化合物H-80 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.4°C) 8.49(s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.21(d, 1H), 7.14(s, 1H), 6.97(d, 1H), 5.14–5.10(m, 1H), 4.23–4.19(m, 1H), 4.09–4.03(m, 1H), 3.87–3.82(m, 1H), 3.63(brs, 2H), 2.96(d, 1H), 2.75–2.41(m, 3H), 2.13–2.06(m, 2H),

1.79–1.60 (m, 3H), 1.4

[0298] 化合物H-81 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度22.0°C) 8.49(s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.18(d, 1H), 7.10(s, 1H), 6.92(d, 1H), 4.95–4.93(m, 1H), 4.04–4.01(m, 1H), 3.94–3.89(m, 1H), 3.78–3.73(m, 1H), 3.60(brs, 2H), 3.46(s, 3H), 2.76–2.50(m, 3H), 2.11–2.04(m, 2H), 1.80–1.68(m, 3H), 1.4

[0299] 化合物H-82 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.7°C) 8.49(s, 1H), 7.87(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.15(d, 1H), 7.13(s, 1H), 6.92(d, 1H), 4.90–4.84(m, 1H), 4.83–4.79(m, 1H), 3.58(brs, 2H), 2.74–2.60(m, 2H), 2.41–2.08(m, 3H), 1.91–1.63(m, 11H), 1.38–1.34(m, 2H)

[0300] 化合物H-83 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.2°C) 8.49(s, 1H), 7.87(dd, 1H), 7.44(d, 1H), 7.38–7.36(m, 2H), 7.03(d, 1H), 5.07(m, 1H), 4.95(d, 1H), 3.92–3.86(m, 1H), 3.62(brs, 2H), 2.75–2.65(m, 2H), 2.44–2.01(m, 3H), 1.77–1.61(m, 3H), 1.43–1.34(m, 2H), 1.30(d, 6H)

[0301] 化合物H-84 : 融点[127–130°C]

[0302] 化合物H-85 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度23.3°C) 8.48(s, 1H), 7.86(dd, 1H), 7.58–7.52(m, 4H), 7.49–7.33(m, 4H), 7.03(d, 1H), 5.02(m, 1H), 3.53(brs, 2H), 2.71–2.61(m, 2H), 2.25–1.89(m, 3H), 1.62–1.51(m, 3H), 1.50–1.40(m, 2H).

[0303] 化合物H-86 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度23.1°C) 8.79(s, 1H), 8.59(t, 1H), 8.49(s, 1H), 7.89–7.81(m, 1H), 7.65–7.57(dd, s, total 2H), 7.38–7.34(m, 2H), 7.09(d, 1H), 5.11(m, 1H), 3.56(brs, 2H), 2.74–2.64(m, 2H), 2.25–1.90(m, 3H), 1.70–1.54(m, 3H), 1.26–1.00(m, 2H).

[0304] 化合物H-87 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.8°C) 8.50(s, 1H), 7.89(dd, 1H), 7.41–7.36(d, d, s, total 3H), 6.90(d, 1H), 5.07–5.05(m, 1H), 3.64(brs, 2H), 2.87(t, 2H), 2.75–2.68(m, 2H), 2.45–2.08(m, 3H), 1.83–1.42(m, 7H), 1.08(t, 3H)

[0305] 化合物H-88 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度22.0°C) 8.33(s, 1H),

7.74(dd, 1H), 7.58(d, 1H), 7.47(s, 1H), 7.32(d, 1H), 7.18(d, 1H), 5.80–5.66(m, 1H), 5.30–5.05(m, 3H), 3.68(brs, 2H), 2.97–2.85(m, 2H), 2.77–2.39(m, 2H), 2.39–2.00(m, 3H), 1.79–1.26(m, 5H)

[0306] 化合物H-89 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度23.5°C) 8.48(s, 1H), 7.87(dd, 1H), 7.37(d, 1H), 6.91–6.83(m, 3H), 4.82–4.77(m, 1H), 3.94(t, 2H), 3.57(brs, 2H), 2.69–2.30(m, 3H), 2.12–2.04(m, 2H), 1.89–1.60(m, 5H), 1.41–1.32(m, 2H), 1.07(t, 3H)

[0307] 化合物H-90 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度20.8°C) 8.49(s, 1H), 7.91(dd, 1H), 7.48(d, 1H), 7.17(d, 1H), 7.08(s, 1H), 6.99(d, 1H), 5.02–4.98(m, 1H), 3.98(t, 2H), 3.60–3.58(m, 2H), 2.58–2.49(m, 2H), 2.30–2.20(m, 2H), 1.91–1.75(m, 7H), 1.07(t, 3H)

[0308] 化合物H-29 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度20.4°C) 8.50(s, 1H), 7.89(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.16(d, 1H), 7.09(s, 1H), 7.03(d, 1H), 4.97–4.95(m, 1H), 3.97(q, 4H), 3.79(d, 2H), 3.58–3.33(ddd, 2H), 2.74–2.65(m, 2H), 2.19–2.12(m, 1H), 1.98(brd, 2H), 1.06(d, 6H)

[0309] 化合物J-42 : 融点[170–172°C]

[0310] 化合物K-38 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.5°C) 8.49(s, 1H), 7.88(dd, 1H), 7.39(d, 1H), 7.19(d, 1H), 7.07(d, 1H), 4.98–4.93(m, 1H), 4.34(t, 2H), 3.60(brs, 2H), 2.75–2.30(m, 3H), 2.14–2.07(m, 2H), 1.86–1.67(m, 5H), 1.44–1.38(m, 2H), 1.04(t, 3H)

[0311] 化合物K-39 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度22.3°C) 8.51(s, 1H), 7.90(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 5.78(s, 1H), 5.10–4.80(m, 1H), 4.00(t, 2H), 3.66(brs, 2H), 2.75–1.20(m, 14H), 0.97(t, 3H)

[0312] 化合物N-1 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度20.8°C) 8.64(s, 1H), 7.85–7.81(m, 1H), 7.74–7.69(m, 1H), 7.17(d, 1H), 7.08(s, 1H), 6.92(d, 1H), 4.69(m, 1H), 3.80(d, 2H), 3.36(brs, 2H), 2.61–2.56(m, 2H), 2.17–2.05(m, 3H), 1.91–1.86(m, 1H), 1.65–1.53(m, 3H), 1.27–1.26(m, 2H), 1.08(d, 6H)

[0313] 化合物H-92 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.3°C) 8.50(s, 1H), 7

. 88(d, 1H), 7.37(d, 1H), 7.31(d, 1H), 6.84(d, 1H), 5.11–5.07(m, 0.8H)  
 , 4.75(m, 0.2H), 3.88(s, 3H), 3.66(brs, 2H), 2.77–2.67(m, 4H), 2.50–2.  
 .25(m, 1H), 2.13–2.04(m, 3H), 1.80–1.48(m, 6H), 1.02(t, 3H)

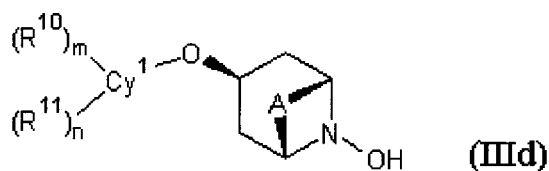
[0314] 化合物H-93 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度20.2°C) 8.49(s, 1H), 7.  
 .87(dd, 1H), 7.38(d, 1H), 7.05(d, 1H), 6.85(d, 1H), 5.20–4.80(m, 2H)  
 , 3.61(brs, 2H), 3.52–3.44 (m, 1H) , 3.01–2.90(m, 1H), 2.70–2.33(m, 3  
 H), 2.10–2.01(m, 3H), 1.79–1.55(m, 4H), 1.48(d, 3H)

[0315] 次に、本発明に係る環状アミン化合物の製造中間体として好適なヒドロキ  
 シアミン化合物の例を表15～表20に示す。なお、これらヒドロキシアミ  
 ン化合物は、実施例に示した製造方法と同様の方法における工程の中間で生  
 成される物質である。

表7中の $(\text{R}^{10})_m$ 、 $(\text{R}^{11})_n$ 、およびAは、式(III d)で表されるヒドロ  
 キシアミン化合物中の各置換基を示している。

表8中の $(\text{R}^{10})_m$ 、 $(\text{R}^{11})_n$ 、およびAは、式(III e)で表されるヒドロ  
 キシアミン化合物中の各置換基を示している。

[0316] [化40]



[0317]

[表42]

表7

| 化合物番号 | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                            | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                |
|-------|-----------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|
| e-1   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-2   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-3   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-4   | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-5   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| e-6   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| e-7   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| e-8   | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| e-9   | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-11  | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-12  | pyridin-2-yl    | -                                                          | 5-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| e-13  | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-14  | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                     | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-15  | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| e-16  | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-17  | pyridin-3-yl    | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                      | 6-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-18  | pyrazol-5-yl    | 1-( <sup>n</sup> Bu)                                       | 3-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |

[0318]

[表43]

| 表7(続き) |                 |                                                                   |                                 |                               |
|--------|-----------------|-------------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                   | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             |
| e-20   | Ph              | 2-(OEt)                                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-22   | Ph              | 2-OH                                                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-23   | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-24   | Ph              | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                                            | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-25   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-26   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-27   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-28   | Ph              | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-29   | Ph              | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-30   | Ph              | 2-(O <sup>s</sup> Bu)                                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-31   | Ph              | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-32   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-33   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                          | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-34   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-35   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-36   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> )                         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-37   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-38   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> )         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-39   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-40   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-41   | Ph              | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-42   | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                                            | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-43   | Ph              | 2-(OAc)                                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-44   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> [2,2-Cl <sub>2</sub> -3-Ph- <sup>o</sup> Pr]) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-45   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-46   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-47   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |

[0319]

[表44]

| 表7(続き) |                 |                                                                       |                                 |                                  |
|--------|-----------------|-----------------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                       | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                |
| e-48   | Ph              | 2-(O <sup>o</sup> Pen)                                                | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-49   | Ph              | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-50   | Ph              | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                                 | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-51   | Ph              | 2-Ph                                                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-52   | Ph              | 2-(pyridin-3-yl)                                                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-53   | Ph              | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                                                 | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-54   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                               | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-55   | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                                 | 4-Cl                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-56   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                                  | 4-Cl                            | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| e-57   | Ph              | 2- <sup>n</sup> Bu                                                    | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-58   | Ph              | 2- <sup>i</sup> Pen                                                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-59   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH)                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-60   | Ph              | 2-(CH=N-OH)                                                           | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-61   | Ph              | 2-(CH=N-OCH <sub>3</sub> )                                            | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-62   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-63   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-64   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> Ph)                                               | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-65   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> -(pyridin-3-yl))                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-66   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> -[tetrahydrofuran-2-yl])                          | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-67   | Ph              | 2-(SCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                              | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-68   | Ph              | 2-(SCH <sub>2</sub> C≡CH)                                             | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-69   | Ph              | 2-(SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-70   | Ph              | 2-(SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )               | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-71   | Ph              | 2-(OPh)                                                               | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-72   | Ph              | 2-(O-(pyridin-3-yl))                                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-73   | Ph              | 2-NH <sub>2</sub>                                                     | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| e-74   | Ph              | 2-(N(CH <sub>3</sub> ) <sup>i</sup> Pr)                               | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |

[0320]

[表45]

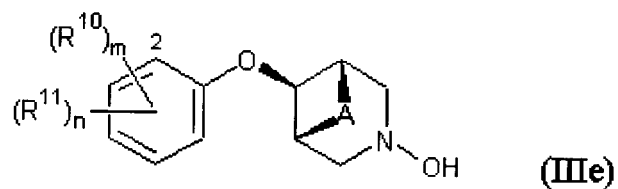
| 表7(続き) |                 |                                                                          |                                 |                               |
|--------|-----------------|--------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                                          | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             |
| e-75   | Ph              | 2-(NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                                | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-76   | Ph              | 2-(NHCH <sub>2</sub> C≡CH)                                               | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-77   | Ph              | 2-(NHAc)                                                                 | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-78   | Ph              | 2-(NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-79   | Ph              | 2-(NHSO <sub>2</sub> Ph)                                                 | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-80   | Ph              | 2-(CONH <sub>2</sub> )                                                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-81   | Ph              | 2-(O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )                                | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-82   | Ph              | 2-(SPh)                                                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-83   | Ph              | 2-(S-(pyridin-3-yl))                                                     | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-84   | Ph              | 2-(CS <sup>i</sup> Pr)                                                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-85   | Ph              | 2-(CO(S <sup>i</sup> Pr))                                                | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-86   | Ph              | 2-(CS(O <sup>i</sup> Pr))                                                | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-87   | Ph              | 2-(CS <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-88   | Ph              | 2-(Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> )                                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-89   | Ph              | 2-NO <sub>2</sub>                                                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-90   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                    | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-91   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-3                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-92   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O)-3                                 | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-93   | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> O)-3                                                 | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-94   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                    | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-95   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CN)                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-96   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-97   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> O <sup>c</sup> Pen)                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-98   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ac)                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-99   | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-100  | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )    | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-101  | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph)                                  | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |

[0321]

[表46]

| 表7(続き) |                 |                                                              |                                 |                               |
|--------|-----------------|--------------------------------------------------------------|---------------------------------|-------------------------------|
| 化合物番号  | Cy <sup>1</sup> | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                              | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                             |
| e-102  | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -(pyridin-3-yl))         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-103  | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -[tetrahydrofuran-2-yl]) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-104  | Ph              | 3-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-105  | Ph              | 3-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                         | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-106  | Ph              | 3-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )   | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-107  | Ph              | 3-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                          | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-108  | Ph              | 3-(O <sup>n</sup> Pr)                                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-109  | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                         | 4-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-110  | Ph              | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                         | 4-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-111  | Ph              | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )   | 4-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-112  | Ph              | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                          | 4-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| e-113  | Ph              | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                        | 4-CN                            | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |

[0322] [化41]



[0323] [表47]

表8

| 化合物番号 | (R <sup>10</sup> ) <sub>m</sub>                            | (R <sup>11</sup> ) <sub>n</sub> | A                                |
|-------|------------------------------------------------------------|---------------------------------|----------------------------------|
| f-5   | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-6   | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-7   | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-8   | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-9   | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| f-10  | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                       | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| f-11  | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| f-12  | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                        | 4-CF <sub>3</sub>               | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |

[0324] [表48]

| 表8(続き)    |                                                                   |                   |                               |
|-----------|-------------------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|
| 化合物<br>番号 | $(R^{10})_m$                                                      | $(R^{11})_n$      | A                             |
| f-13      | 2-(OEt)                                                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-14      | 2-OH                                                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-15      | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-16      | 2-([1,3]dioxolan-2-yl)                                            | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-17      | 2-(CH <sub>2</sub> O <sup>i</sup> Pr)                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-18      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-19      | 2-(CH <sub>2</sub> OEt)                                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-20      | 2-(NHCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-21      | 2-(O <sup>i</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-22      | 2-(O <sup>n</sup> Bu)                                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-23      | 2-(OCO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-24      | 2-(OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-25      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                          | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-26      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )         | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-27      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-28      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> )                         | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-29      | 2-(OCH <sub>2</sub> C≡CH)                                         | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-30      | 2-(OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> )         | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-31      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>s</sup> Bu)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-32      | 2-(OCH <sub>2</sub> CN)                                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-33      | 2-(OCH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub> )                        | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-34      | 2-(CO <sub>2</sub> Et)                                            | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-35      | 2-(OAc)                                                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-36      | 2-(OCH <sub>2</sub> [2,2-Cl <sub>2</sub> -3-Ph- <sup>o</sup> Pr]) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-37      | 2-(OCH <sub>2</sub> Ac)                                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-38      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OH)CH <sub>3</sub> )                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |

[0325]

[表49]

| 表8(続き)    |                                                                       |                   |                                  |
|-----------|-----------------------------------------------------------------------|-------------------|----------------------------------|
| 化合物<br>番号 | $(R^{10})_m$                                                          | $(R^{11})_n$      | A                                |
| f-39      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )            | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-40      | 2-(O <sup>o</sup> Pen)                                                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-41      | 2-(OCONH <sup>i</sup> Pr)                                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-42      | 2-(OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )                                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-43      | 2-Ph                                                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-44      | 2-(pyridin-3-yl)                                                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-45      | 2-(S <sup>n</sup> Pr)                                                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-46      | 2-(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-47      | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                                 | 4-Cl              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-48      | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                                  | 4-Cl              | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> |
| f-49      | 2- <sup>n</sup> Bu                                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-50      | 2- <sup>i</sup> Pen                                                   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-51      | 2-(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-52      | 2-(CH=N-OH)                                                           | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-53      | 2-(CH=N-OCH <sub>3</sub> )                                            | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-54      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-55      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-56      | 2-(OCH <sub>2</sub> Ph)                                               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-57      | 2-(OCH <sub>2</sub> -(pyridin-3-yl))                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-58      | 2-(OCH <sub>2</sub> -[tetrahydrofuran-2-yl])                          | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-59      | 2-(SCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-60      | 2-(SCH <sub>2</sub> C≡CH)                                             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-61      | 2-(SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-62      | 2-(SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |
| f-63      | 2-(OPh)                                                               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>    |

[0326]

[表50]

| 表8(続き)    |                                                         |                   |                               |
|-----------|---------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|
| 化合物<br>番号 | $(R^{10})_m$                                            | $(R^{11})_n$      | A                             |
| f-64      | 2-(O-(pyridin-3-yl))                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-65      | 2-NH <sub>2</sub>                                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-66      | 2-(N(CH <sub>3</sub> ) <sup>i</sup> Pr)                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-67      | 2-(NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> )               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-68      | 2-(NHCH <sub>2</sub> C≡CH)                              | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-69      | 2-(NHAc)                                                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-70      | 2-(NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-71      | 2-(NHSO <sub>2</sub> Ph)                                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-72      | 2-(CONH <sub>2</sub> )                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-73      | 2-(O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-74      | 2-(SPh)                                                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-75      | 2-(S-(pyridin-3-yl))                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-76      | 2-(CS <sup>i</sup> Pr)                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-77      | 2-(CO(S <sup>i</sup> Pr))                               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-78      | 2-(CS(O <sup>i</sup> Pr))                               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-79      | 2-(CS <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-80      | 2-(Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> )                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-81      | 2-NO <sub>2</sub>                                       | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-82      | 2-(OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-83      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> )-3                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-84      | 2-(OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O)-3                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-85      | 2-(OCH <sub>2</sub> O)-3                                | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-86      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )   | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-87      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CN)                 | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-88      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> )  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-89      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> O <sup>c</sup> Pen) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |

[0327]

[表51]

| 表8(続き)    |                                                                          |                   |                               |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------|-------------------|-------------------------------|
| 化合物<br>番号 | $(R^{10})_m$                                                             | $(R^{11})_n$      | A                             |
| f-90      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ac)                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-91      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-92      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-93      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph)                                  | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-94      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -(pyridin-3-yl))                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-95      | 2-(CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -[tetrahydrofuran-2-yl])             | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-96      | 3-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-97      | 3-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                                     | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-98      | 3-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )               | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-99      | 3-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                                      | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-100     | 3-(O <sup>n</sup> Pr)                                                    | 4-CF <sub>3</sub> | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-101     | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                                     | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-102     | 2-(OCH <sub>2</sub> <sup>o</sup> Pr)                                     | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-103     | 2-(CH <sub>2</sub> OCH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> )               | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-104     | 2-(CO <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr)                                      | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |
| f-105     | 2-(O <sup>n</sup> Pr)                                                    | 4-CN              | C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> |

[0328] 表7～8に例示した化合物のうちの一部の化合物について物理定数を示す

。

[0329] 化合物 e-1 : 融点[112-115℃]

[0330] 化合物 e-2 : 融点[118-123℃]

[0331] 化合物 e-9 : 融点[94-100℃]

[0332] 化合物 e-11 : 融点[105-110℃]

[0333] 化合物 e-12 : 融点[110-113℃]

[0334] 化合物 e-13 : <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ ppm, 測定温度 20.2℃) 8.02 (s, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 5.70-5.66 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.52 (brs, 2H), 2.74-2.64 (m, 2H), 2.37-2.34 (m, 1H), 1.98-1.80 (m, 2H), 1.71-1.34 (m, 5H)

[0335] 化合物e-14 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度20.4°C) 7.34 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 5.21 (s, 2H), 5.08–5.00 (m, 1H), 3.56–3.51 (brs, s, total 5H), 2.70–2.60 (m, 2H), 2.38–2.26 (m, 1H), 2.02–1.96 (m, 2H), 1.71–1.57 (m, 3H), 1.40–1.33 (m, 2H)

[0336] 化合物e-15 : 融点[104–107°C]

[0337] 化合物e-16 : 融点[112–115°C]

[0338] 化合物e-17 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度21.7°C) 7.17 (d, 1H), 7.07 (d, 1H), 5.01–4.97 (m, 1H), 4.35 (t, 2H), 3.47 (brs, 2H), 2.65–1.23 (m, 12H), 1.03 (t, 3H)

[0339] 化合物e-18 :  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm, 測定温度22.6°C) 5.78 (s, 1H), 5.30–4.90 (m, 1H), 3.99 (t, 2H), 3.50 (brs, 2H), 2.66–2.29 (m, 3H), 1.96–1.15 (m, 11H), 0.95 (t, 3H)

[0340] 本発明の殺ダニ剤の製剤実施例を若干示すが、添加物および添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

[0341] 製剤実施例 1                      水和剤

|                 |     |
|-----------------|-----|
| 本発明化合物          | 40部 |
| 珪藻土             | 53部 |
| 高級アルコール硫酸エステル   | 4部  |
| アルキルナフタレンスルホン酸塩 | 3部  |

以上を均一に混合して微細に粉砕して、有効成分40%の水和剤を得た。

[0342] 製剤実施例 2                      乳剤

|                      |     |
|----------------------|-----|
| 本発明化合物               | 30部 |
| キシレン                 | 33部 |
| ジメチルホルムアミド           | 30部 |
| ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル | 7部  |

以上を混合溶解して、有効成分30%の乳剤を得た。

[0343] 本発明の環状アミン化合物またはその塩が、殺ダニ剤の有効成分として有

用であることを以下の試験例で示す。

[0344] 試験例 1 ナミハダニに対する効力試験

3 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ～ 10 日を経過した第 1 本葉上に、有機リン剤抵抗性のナミハダニ雌成虫を 17 頭接種した。次いで、前記製剤実施例 2 に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物の濃度 125 ppm になるように水で希釈し、その希釈液を前記インゲンに散布した。該インゲンを、温度 25℃、湿度 65% の恒温室内に置いた。散布から 3 日経過後に殺成虫率を調査した。試験は 2 反復で行った。

化合物番号：H-1、H-2、H-5、H-29、H-41、H-42、H-43、H-51、H-52、H-54、H-55、H-56、H-57、H-58、H-59、H-60、H-61、H-62、H-63、H-64、H-65、H-66、H-67、H-68、H-70、H-71、H-72、H-73、H-74、H-75、H-79、H-80、H-82、H-83、H-84、H-85、H-86、H-87、H-89、H-90、K-8、K-12、K-38、および K-39 の環状アミン化合物をそれぞれ含有する乳剤について、上記試験を行った。その結果、いずれの化合物も、濃度 125 ppm に希釈した場合における殺虫率が、80% 以上であった。

また、化合物番号 H-81 は、濃度 8 ppm に希釈した場合における殺虫率が、80% 以上であった。

[0345] 試験例 2 ミカンハダニに対する効力試験

シャーレに入れたミカン葉上に、殺ダニ剤抵抗性のミカンハダニ雌成虫を 10 頭接種した。次いで前記製剤実施例 2 に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物の濃度 125 ppm になるように水で希釈し、その希釈液を回転散布塔にて前記ミカンに散布した。該ミカンを、温度 25℃、湿度 65% の恒温室内に置いた。散布から 3 日経過後に殺成虫率を調査した。

化合物番号：H-1、H-2、H-5、H-29、H-41、H-42、H-43、H-51、H-55、H-57、H-58、H-62、H-64

、H-66、H-69、H-72、H-73、H-74、H-75、H-81、H-82、H-83、H-84、H-85、H-87、H-89、H-90、K-8、K-12、K-38、およびK-39の環状アミン化合物をそれぞれ含有する乳剤について、上記試験を行った。その結果、いずれの化合物も、濃度125 ppmに希釈した場合における殺虫率が、80%以上であった。

また、化合物番号H-54、H-56、H-59、H-60、H-61、H-63、H-68、H-70、およびH-80は、濃度31 ppmに希釈した場合における殺虫率が、80%以上であった。

[0346] 試験例3 ナミハダニ卵に対する殺卵力試験

シャーレに入れたインゲン葉上に、ナミハダニ雌成虫を接種し、1日間産卵させた。次いで前記製剤実施例2に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物の濃度125 ppmになるように水で希釈し、その希釈液を回転散布塔にて前記インゲン葉に散布した。該インゲン葉を、温度25℃、湿度65%の恒温室内に置いた。散布から7日後に産付された卵が孵化し得たか否かを調査し殺卵率を求めた。

化合物番号：H-1、H-2、H-29、H-43、H-54、H-56、およびH-73の環状アミン化合物をそれぞれ含有する乳剤について、上記試験を行った。その結果、いずれの化合物も、濃度125 ppmに希釈した場合における殺卵率が、80%以上であった。

[0347] 試験例4 ミカンハダニ卵に対する殺卵力試験

シャーレに入れたミカン葉上に、ミカンハダニ雌成虫を接種し、1日間産卵させた。次いで前記製剤実施例2に示された処方の乳剤を調製した。この乳剤を化合物の濃度125 ppmになるように水で希釈し、その希釈液を回転散布塔にて前記ミカン葉に散布した。該ミカン葉を、温度25℃、湿度65%の恒温室内に置いた。散布から7日後に産付された卵が孵化し得たか否かを調査し殺卵率を求めた。

化合物番号H-1、H-2、H-29、H-43、H-54、H-56、

およびH-73の環状アミン化合物をそれぞれ含有する乳剤について、上記試験を行った。その結果、いずれの化合物も、濃度125 ppmに希釈した場合における殺卵率が、80%以上であった。

[0348] 試験例5 フタトゲチマダニに対する殺虫試験

本発明化合物をアセトンに希釈して、400 ppm濃度の薬液を調製した。薬液118  $\mu$ Lを20 mL容のガラスバイアル内面に塗布した後、アセトンを揮発させて本発明化合物の薄膜をガラスバイアル内面に作成した。用いたガラスバイアルの内面は47  $\text{cm}^2$ なので、処理薬量は1  $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ となる。これにフタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*) の幼ダニ8頭を入れ、蓋をして25°C恒温温室に收容した。5日後の死虫数を調査し、下記の計算式から死虫率を計算した。

$$\text{死虫率 (\%)} = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

化合物番号：H-5、H-29、H-43、H-55、H-63、H-73、H-83、H-90、J-42、K-38、K-39

[0349] 試験例6 ネコノミに対する殺虫試験

本発明化合物をアセトンに希釈して、400 ppm濃度の薬液を調製した。薬液118  $\mu$ Lを20 mL容のガラスバイアル内面に塗布した後、アセトンを揮発させて本発明化合物の薄膜をガラスバイアル内面に作成した。用いたガラスバイアルの内面は47  $\text{cm}^2$ なので、処理薬量は1  $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ となる。これにネコノミ (Cat flea) 幼虫8頭を入れ、蓋をして25°C恒温温室に收容した。1日後の死虫数を調査し、下記の計算式から死虫率を計算した。

$$\text{死虫率 (\%)} = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

化合物番号：H-73、K-38、K-39

[0350] 以上の結果から、本発明の環状アミン化合物またはその塩はダニに対して

優れた殺作用を示すことがわかる。

### 産業上の利用可能性

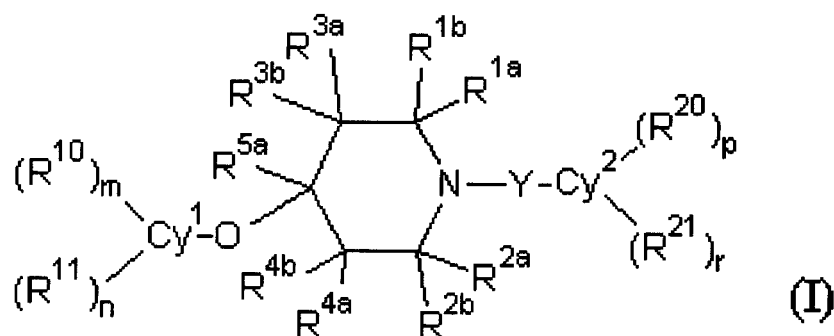
[0351] 本発明に係る環状アミン化合物またはその塩は、農作物や衛生面において有害なダニ類などを効果的に防除することができる。

また、本発明に係るヒドロキシアミン化合物またはその塩を用いると、本発明に係る環状アミン化合物またはその塩を容易に合成することができる、産業上有用である。

## 請求の範囲

[請求項1]

式 (I)



〔式 (I) 中、

Cy<sup>1</sup>およびCy<sup>2</sup>は、それぞれ独立に、C 6～10アリール基、またはヘテロシクリル基を示す。

R<sup>1a</sup>、R<sup>1b</sup>、R<sup>2a</sup>、R<sup>2b</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup>、R<sup>4a</sup>、R<sup>4b</sup>、およびR<sup>5a</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、または無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキル基を示し、

且つ R<sup>1a</sup>とR<sup>2a</sup>またはR<sup>3a</sup>とR<sup>4a</sup>は、一緒になって、

無置換の若しくは置換基を有するC 3～6アルキレン基、

無置換の若しくは置換基を有するC 3～6アルケニレン基、

式：—CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>—で表される基、

式：—CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>—で表される基、

式：—CH<sub>2</sub>C(=O)CH<sub>2</sub>—で表される基、

または式：—CH<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>CH<sub>2</sub>—で表される基

(ただし、R<sup>6</sup>は、水素原子、

無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキル基、

無置換の若しくは置換基を有するC 1～7アシル基、

または無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。)を形成している。

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>20</sup>、およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立に、

無置換の若しくは置換基を有するC1～6アルキル基、  
無置換の若しくは置換基を有するC3～8シクロアルキル基、  
無置換の若しくは置換基を有するC2～6アルケニル基、  
無置換の若しくは置換基を有するC2～6アルキニル基、  
無置換の若しくは置換基を有するC1～6アルコキシ基、  
オキシ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC1～6アルコキシ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC3～8シクロアルコキシ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC2～6アルケニルコキシ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC2～6アルキニルコキシ基、  
カルボキシ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC1～7シル基、  
無置換の若しくは置換基を有するC1～6アルコキシニル基、  
無置換の若しくは置換基を有するC3～8シクロアルコキシニル基、  
ポニル基、  
無置換の若しくは置換基を有するC2～6アルケニルコキシカルボニル基、  
無置換の若しくは置換基を有するC6～10アリールコキシカルボニル基、  
無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルコキシカルボニル基、  
、  
無置換の若しくは置換基を有するC1～7シルコキシ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC1～6アルコキシカルボニルコキシ基、  
シ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC3～8シクロアルコキシカルボニルコキシ基、  
ポニルコキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 2～6 アルケニルオキシカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 2～6 アルキニルオキシカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 1～6 アルキルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 3～8 シクロアルキルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 2～6 アルケニルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 2～6 アルキニルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 6～10 アリールアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するアミノオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 1～6 アルキリデンアミノオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 6～10 アリール基、

無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリル基、

無置換の若しくは置換基を有するC 6～10 アリールオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシ基、

置換基を有するスルホニルオキシ基、

アミノ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 1～6 アルキルアミノ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 3～8 シクロアルキルアミノ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 2～6 アルケニルアミノ基、

無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルキニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>6</sub>～10アリールアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するヒドロキシアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～7アシルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルコキシカルボニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルケニルオキシカルボニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルキニルオキシカルボニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>6</sub>～10アリールオキシカルボニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシカルボニルアミノ基、  
置換基を有するスルホニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するアミノカルボニル基、  
メルカプト基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキルチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>3</sub>～8シクロアルキルチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルケニルチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルキニルチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>6</sub>～10アリールチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルチオ基、  
(無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキル)チオカルボニル基、  
(無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルコキシ)チオカルボニル基、

(無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキルチオ)カルボニル基、

(無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキルチオ)チオカルボニル基、

置換基を有するスルフィニル基、

置換基を有するスルホニル基、

ペンタフルオロスルファニル基

トリC<sub>1</sub>～6アルキル置換シリル基、

トリC<sub>6</sub>～10アリール置換シリル基、

シアノ基、

ニトロ基、

またはハロゲン原子を示す。

C<sub>y<sup>1</sup></sub>上のR<sup>10</sup>またはR<sup>11</sup>は、それぞれの中で、または相互に、またはC<sub>y<sup>1</sup></sub>上で結合する原子と一緒に環を形成してもよく、C<sub>y<sup>2</sup></sub>上のR<sup>20</sup>またはR<sup>21</sup>は、それぞれの中で、または相互に、またはC<sub>y<sup>2</sup></sub>上で結合する原子と一緒に環を形成してもよい。

mはR<sup>10</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。mが2以上のとき、R<sup>10</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

nはR<sup>11</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、R<sup>11</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

pはR<sup>20</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。pが2以上のとき、R<sup>20</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

rはR<sup>21</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。rが2以上のとき、R<sup>21</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

Yは、酸素原子または硫黄原子を示す。〕で表される環状アミン化合物またはその塩。

[請求項2]

式(1)中、C<sub>y<sup>1</sup></sub>が、フェニル基、ピラゾリル基、チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、またはピリダジニル基であって、

且つC<sub>y</sub><sup>2</sup>が、フェニル基、ピラゾリル基、チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、またはピリダジニル基である、請求項1に記載の環状アミン化合物またはその塩。

[請求項3]

式(I)中、

R<sup>10</sup>が、

C<sub>1</sub>～6アルキル基、C<sub>1</sub>～6アルコキシC<sub>1</sub>～6アルキル基、C<sub>1</sub>～6アルコキシC<sub>1</sub>～6アルコキシC<sub>1</sub>～6アルキル基、C<sub>2</sub>～6アルケニル基、水酸基、C<sub>1</sub>～6アルコキシ基、C<sub>1</sub>～6ハロアルコキシ基、C<sub>3</sub>～8シクロアルコキシ基、C<sub>2</sub>～6アルケニルオキシ基、C<sub>2</sub>～6ハロアルケニルオキシ基、C<sub>2</sub>～6アルキニルオキシ基、C<sub>2</sub>～6ハロアルキニルオキシ基、C<sub>1</sub>～6アルコキシC<sub>1</sub>～6アルコキシ基、C<sub>3</sub>～8シクロアルキルC<sub>1</sub>～6アルコキシ基、シアノC<sub>1</sub>～6アルコキシ基、C<sub>1</sub>～7アシルC<sub>1</sub>～6アルコキシ基、ヒドロキシC<sub>1</sub>～6アルコキシ基、C<sub>1</sub>～7アシルオキシ基、C<sub>1</sub>～6アルコキシカルボニル基、C<sub>2</sub>～6アルケニルオキシカルボニル基、C<sub>2</sub>～6アルキニルオキシカルボニル基、C<sub>1</sub>～6アルコキシカルボニルオキシ基、C<sub>1</sub>～6アルキルアミノカルボニルオキシ基、C<sub>6</sub>～10アリール基、ヘテロシクリル基、C<sub>1</sub>～6ハロアルキルスルホニルオキシ基、C<sub>1</sub>～6アルキリデンアミノオキシ基、C<sub>1</sub>～6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>7</sub>～11アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC<sub>7</sub>～11アラルキルオキシ基、C<sub>1</sub>～6アルキルチオ基、またはニトロ基であって、

R<sup>11</sup>が、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C<sub>1</sub>～6ハロアルキル基、C<sub>2</sub>～6ハロアルケニル基、またはC<sub>2</sub>～6ハロアルキニル基であって、

R<sup>20</sup>が、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C<sub>1</sub>～6ハロアルキル基、C<sub>2</sub>～6ハロアルケニル基、またはC<sub>2</sub>～6ハロアルキニル基であって、且つ

$R^{21}$ が、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルコキシC 1～6 アルキル基、水酸基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 2～6 ハロアルケニルオキシ基、C 2～6 ハロアルキニルオキシ基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルコキシ基、C 3～8 シクロアルキルC 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、C 2～6 アルケニルオキシカルボニル基、C 2～6 アルキニルオキシカルボニル基、C 1～6 アルキリデンアミノオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11 アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11 アラルキルオキシ基、またはニトロ基である、

請求項 1 または 2 に記載の環状アミン化合物またはその塩。

[請求項4]

式 (I) 中、

$C_{y^1}$ がフェニル基であり；

$R^{1b}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ および $R^{5a}$ が水素原子であり；

$R^{1a}$ と $R^{2a}$ は、それらが一緒になってなる、無置換の若しくは置換基を有するC 3～6 アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有するC 3～6 アルケニレン基、式： $-CH_2OCH_2-$ で表される基、式： $-CH_2SCH_2-$ で表される基、式： $-CH_2C(=O)CH_2-$ で表される基、または式： $-CH_2NR^6CH_2-$ で表される基（ただし、 $R^6$ は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するC 1～6 アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1～7 アシル基、または無置換の若しくは置換基を有するC 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。）であり；

$C_{y^2}$ がピリジン-2-イル基であり；

Yは酸素原子であり；

rはゼロであり；且つ

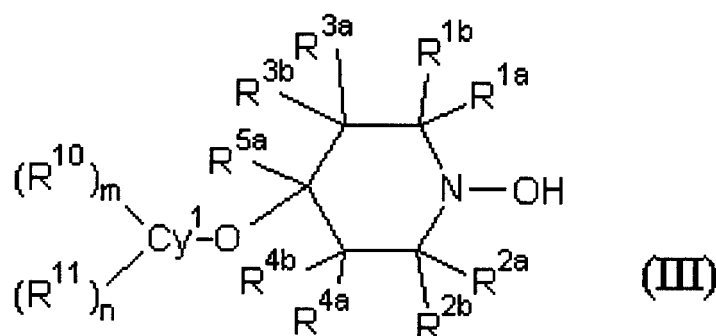
pは0～4のいずれかの整数である、請求項 1～3のいずれか 1 項

に記載の環状アミン化合物またはその塩。

[請求項5] 請求項 1 ～ 4 のいずれか一項に記載の環状アミン化合物またはその塩から選ばれる少なくとも 1 種を有効成分として含有する有害生物防除剤。

[請求項6] 請求項 1 ～ 4 のいずれか一項に記載の環状アミン化合物またはその塩から選ばれる少なくとも 1 種を有効成分として含有する殺ダニ剤。

[請求項7] 式 (III)



〔式 (III) 中、

Cy<sup>1</sup>は、C 6 ～ 10 アリール基、またはヘテロシクリル基を示す。

R<sup>1a</sup>、R<sup>1b</sup>、R<sup>2a</sup>、R<sup>2b</sup>、R<sup>3a</sup>、R<sup>3b</sup>、R<sup>4a</sup>、R<sup>4b</sup>、およびR<sup>5a</sup>は、それぞれ独立に、水素原子、または無置換の若しくは置換基を有するC 1 ～ 6 アルキル基を示し、且つ R<sup>1a</sup>とR<sup>2a</sup>またはR<sup>3a</sup>とR<sup>4a</sup>は、一緒になって、無置換の若しくは置換基を有するC 3 ～ 6 アルキレン基、無置換の若しくは置換基を有するC 3 ～ 6 アルケニレン基、式：—CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>—で表される基、式：—CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>—で表される基、式：—CH<sub>2</sub>C(=O)CH<sub>2</sub>—で表される基、または式：—CH<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>CH<sub>2</sub>—で表される基（ただし、R<sup>6</sup>は、水素原子、無置換の若しくは置換基を有するC 1 ～ 6 アルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 1 ～ 7 アシル基、または無置換の若しくは置換基を有するC 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基を示す。）を形成している。

R<sup>10</sup>、およびR<sup>11</sup>は、それぞれ独立に、

無置換の若し＜は置換基を有するC 1～6アルキル基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 3～8シクロアルキル基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 2～6アルケニル基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 2～6アルキニル基、

水酸基、

オキシ基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 1～6アルコキシ基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 3～8シクロアルコキシ基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 2～6アルケニルオキシ基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 2～6アルキニルオキシ基、

カルボキシル基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 1～7シル基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニル基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 3～8シクロアルキルオキシカル

ボニル基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 2～6アルケニルオキシカルボニ

ル基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 2～6アルキニルオキシカルボニ

ル基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 6～10アリールオキシカルボニ

ル基、

無置換の若し＜は置換基を有するヘテロシクリルオキシカルボニル基

、

無置換の若し＜は置換基を有するC 1～7シルオキシ基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 1～6アルコキシカルボニルオキ

シ基、

無置換の若し＜は置換基を有するC 3～8シクロアルキルオキシカル

ボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 2～6 アルケニルオキシカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 2～6 アルキニルオキシカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 1～6 アルキルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 3～8 シクロアルキルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 2～6 アルケニルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 2～6 アルキニルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 6～10 アリールアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルアミノカルボニルオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するアミノオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 1～6 アルキリデンアミノオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 6～10 アリール基、

無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリル基、

無置換の若しくは置換基を有するC 6～10 アリールオキシ基、

無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシ基、

置換基を有するスルホニルオキシ基、

アミノ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 1～6 アルキルアミノ基、

無置換の若しくは置換基を有するC 3～8 シクロアルキルアミノ基、

無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルケニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルキニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>6</sub>～10アリールアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するヒドロキシアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～7アシルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルコキシカルボニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルケニルオキシカルボニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルキニルオキシカルボニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>6</sub>～10アリールオキシカルボニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルオキシカルボニルアミノ基、  
置換基を有するスルホニルアミノ基、  
無置換の若しくは置換基を有するアミノカルボニル基、  
メルカプト基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキルチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>3</sub>～8シクロアルキルチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルケニルチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>2</sub>～6アルキニルチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するC<sub>6</sub>～10アリールチオ基、  
無置換の若しくは置換基を有するヘテロシクリルチオ基、  
(無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルキル)チオカルボニル基、  
(無置換の若しくは置換基を有するC<sub>1</sub>～6アルコキシ)チオカルボ

ニル基、

(無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルチオ)カルボニル基、

(無置換の若しくは置換基を有するC 1～6アルキルチオ)チオカルボニル基、

置換基を有するスルフィニル基、

置換基を有するスルホニル基、

ペンタフルオロスルファニル基

トリC 1～6アルキル置換シリル基、

トリC 6～10アリール置換シリル基、

シアノ基、

ニトロ基、

またはハロゲン原子を示す。

C y<sup>1</sup>上のR<sup>10</sup>またはR<sup>11</sup>は、それぞれの中で、または相互に、またはC y<sup>1</sup>上で結合する原子と一緒になって環を形成してもよい。

mはR<sup>10</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。mが2以上のとき、R<sup>10</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。

nはR<sup>11</sup>の数を示し且つ0～5のいずれかの整数である。nが2以上のとき、R<sup>11</sup>同士は互いに同一でも異なってもよい。]

で表されるヒドロキシアミン化合物またはその塩。

[請求項8]

式(III)中、C y<sup>1</sup>が、フェニル基、ピラゾリル基、チアジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、またはピリダジニル基である、請求項7に記載のヒドロキシアミン化合物またその塩。

[請求項9]

式(III)中、

R<sup>10</sup>が、C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6アルコキシC 1～6アルキル基、C 2～6アルケニル基、水酸基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 3～8シクロアルコキシ基、C 2～6アルケニル

オキシ基、C 2～6 ハロアルケニルオキシ基、C 2～6 アルキニルオキシ基、C 2～6 ハロアルキニルオキシ基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルコキシ基、C 3～8 シクロアルキルC 1～6 アルコキシ基、シアノC 1～6 アルコキシ基、C 1～7 アシルC 1～6 アルコキシ基、ヒドロキシC 1～6 アルコキシ基、C 1～7 アシルオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、C 2～6 アルケニルオキシカルボニル基、C 2～6 アルキニルオキシカルボニル基、C 1～6 アルコキシカルボニルオキシ基、C 1～6 アルキルアミノカルボニルオキシ基、C 6～10 アリール基、ヘテロシクリル基、C 1～6 ハロアルキルスルホニルオキシ基、C 1～6 アルキリデンアミノオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11 アラルキル基、無置換の若しくは置換基を有するC 7～11 アラルキルオキシ基、C 1～6 アルキルチオ基、またはニトロ基であって、且つ

R<sup>11</sup>が、シアノ基、ハロゲン原子、ペンタフルオロスルファニル基、C 1～6 ハロアルキル基、C 2～6 ハロアルケニル基、またはC 2～6 ハロアルキニル基である、請求項7または8に記載のヒドロキシアミン化合物またはその塩。