

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2018年1月4日(04.01.2018)



(10) 国際公開番号

WO 2018/003924 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 213/61 (2006.01) A61K 31/497 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01) A61P 31/10 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01) A61P 33/00 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01) C07D 401/12 (2006.01)
A01P 5/00 (2006.01) C07D 405/12 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01) C07D 409/12 (2006.01)
A61K 31/443 (2006.01) C07D 411/12 (2006.01)
A61K 31/4436 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2017/023955

(22) 国際出願日: 2017年6月29日(29.06.2017)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願 2016-129158 2016年6月29日(29.06.2016) JP
特願 2016-197920 2016年10月6日(06.10.2016) JP
特願 2017-006154 2017年1月17日(17.01.2017) JP

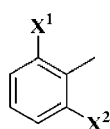
特願 2017-084394 2017年4月21日(21.04.2017) JP

(71) 出願人: 日産化学工業株式会社
(NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/
JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町
3丁目7番地1 Tokyo (JP).

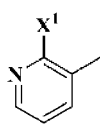
(72) 発明者: 三田 猛志(MITA Takeshi); 〒2748507
千葉県船橋市坪井西2丁目10番1号 日産化学
工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP).
岩佐 基悦(IWASA Motoyoshi); 〒2748507 千葉
県船橋市坪井西2丁目10番1号 日産化学工
業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 田
島 佑樹(TAJIMA Yuki); 〒2748507 千葉県船橋
市坪井西2丁目10番1号 日産化学工業株
式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 吉永 豊
(YOSHINAGA Yutaka); 〒2748507 千葉県船橋
市坪井西2丁目10番1号 日産化学工業株
式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 旭 美穂
(ASAHI Miho); 〒3490294 埼玉県白岡市白岡1
470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所
内 Saitama (JP). 三森 紀彦(MIMORI Norihiko);

(54) Title: ALKYNYPYRIDINE-SUBSTITUTED AMIDE COMPOUND AND PEST CONTROL AGENT

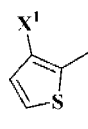
(54) 発明の名称: アルキニルピリジン置換アミド化合物及び有害生物防除剤



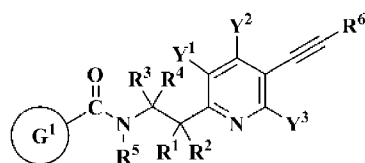
G¹-1



G¹-3



G¹-7



(I)

(57) Abstract: Provided is a novel pest control agent, especially a bactericide or a nematicide. An alkynylpyridine-substituted amide compound represented by formula (I) or a salt thereof; and a pest control agent which contains the compound or the salt. (In the formulae, G¹ represents a structure represented by G¹-1, G¹-3, G¹-7 or the like; X¹ represents a halogen atom, a trifluoromethyl group, a methylsulfonyl group or the like; X² represents a hydrogen atom, a fluorine atom or the like; Y¹ represents a halogen atom or the like; each of Y² and Y³ represents a hydrogen atom or the like; R¹ represents a hydrogen atom, a fluorine atom, a methyl group, a methoxy group or the like, and R² represents a hydrogen atom, a fluorine atom, a methyl group or the like, or alternatively, R¹ and R² combine with each other to form an ethylene chain, thereby forming a cyclopropyl ring together with carbon atoms to which R¹ and R² are bonded; R³ represents a hydrogen atom, a methyl group or the like; R⁴ represents a hydrogen atom or the like; R⁵ represents a hydrogen atom or the like; R⁶ represents a phenyl group substituted by (Z)_m, or the like; Z represents a halogen atom, a C₁-C₄ alkyl group, a C₁-C₄ haloalkyl group, a C₁-C₄ alkoxy group, a C₁-C₄ haloalkoxy group or the like; and m represents 1, 2, 3 or the like.)

WO 2018/003924 A1

〒3490294 埼玉県白岡市白岡 1 4 7 0 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP), 中平 国光(NAKAHIRA Kunimitsu); 〒3490294 埼玉県白岡市白岡 1 4 7 0 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP), 植村 優樹(UEMURA Yuki); 〒3490294 埼玉県白岡市白岡 1 4 7 0 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP).

(74) 代理人: 泉名 謙治, 外 (SENMYO Kenji et al.); 〒1010035 東京都千代田区神田紺屋町 1 7 番地 S I A 神田スクエア 4 階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

一 国際調査報告 (条約第21条(3))

(57) 要約: 新規な有害生物防除剤、特に殺菌剤及び殺線虫剤を提供する。式 (I) で表されるアルキニルピリジン置換アミド化合物又はその塩、及びそれらを含む有害生物防除剤。[式中、 G^1 は G^1-1 、 G^1-3 、 G^1-7 等で表される構造を表し、 X^1 はハロゲン原子、トリフルオロメチル、メチルスルホニル等を表し、 X^2 は水素原子、フッ素原子等を表し、 Y^1 はハロゲン原子等を表し、 Y^2 及び Y^3 は水素原子等を表し、 R^1 は水素原子、フッ素原子、メチル、メトキシ等を表し、 R^2 は水素原子、フッ素原子、メチル等を表すか、或いは、 R^1 と R^2 とが一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表し、 R^3 は水素原子、メチル等を表し、 R^4 は水素原子等を表し、 R^5 は水素原子等を表し、 R^6 は $(Z)_m$ によって置換されたフェニル等を表し、 Z はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ等を表し、 m は1、2、3等を表す。]

明 細 書

発明の名称：

アルキニルピリジン置換アミド化合物及び有害生物防除剤

技術分野

[0001] 本発明は、新規なアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド、又はそれらの塩、およびこれらの化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

背景技術

[0002] 従来、アルキニルピリジン置換アミド化合物に関しては、例えば、N-[2-[3-クロロ-5-(2-フェニルエチニル)ピリジン-2-イル]-1-メチルエチル]-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドが有害生物防除活性を示すこと（特許文献1参照。）、N-[2-[3-クロロ-5-(2-フェニルエチニル)ピリジン-2-イル]-2-(イソプロポキシイミノ)エチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド、N-[2-[3-クロロ-5-[2-[4-(tert-ブチル)フェニル]エチニル]ピリジン-2-イル]-2-(イソプロポキシイミノ)エチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド、N-[2-[3-クロロ-5-[2-(2-ピリジル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-(イソプロポキシイミノ)エチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド、N-[2-[3-クロロ-5-[2-(3-ピリジル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-(イソプロポキシイミノ)エチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド又はN-[2-[3-クロロ-5-[2-(4-ピリジル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-(イソプロポキシイミノ)エチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドが有害生物防除活性を示すこと（特許文献2及び3参照。）、N-[[1-[3-クロロ-5-(3,3,3-トリフルオロ-1-プロピニル)ピリジン-2-イル]シクロプロピル]メチル]-3-フルオロピリジン-2-カルボキサミド、N-[[1-[3-クロロ-5-(3,3,3-トリフルオロ-1-プロピニル)ピリジン-2-

－イル]シクロプロピル]メチル]－3－クロロピリジン－2－カルボキサミド、N－[[1－[3－クロロ－5－(3,3,3－トリフルオロ－1－プロピニル)ピリジン－2－イル]シクロプロピル]メチル]－3－メチルピリジン－2－カルボキサミド又はN－[[1－[3－クロロ－5－(3,3,3－トリフルオロ－1－プロピニル)ピリジン－2－イル]シクロプロピル]メチル]－3－(トリフルオロメチル)ピリジン－2－カルボキサミドが殺線虫活性を示すこと（特許文献4参照。）が知られている。

[0003] しかしながら、本発明に係るアルキニルピリジン置換アミド化合物に関しては何ら開示した文献はこれまで見当たらず、また、それらの有害生物防除剤としての有用性は知られていない。

先行技術文献

特許文献

[0004] 特許文献1：国際公開第2015/125824号
特許文献2：国際公開第2014/010737号
特許文献3：特開第2016-011286号公報
特許文献4：国際公開第2014/173921号

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0005] 病原菌や寄生虫といった有害生物の感染や寄生は、宿主が穀類、果樹、野菜、鑑賞植物等の植物である場合、農作物の品質の低下、収量の大幅な低下、さらに、場合によっては植物の枯死といった深刻な被害を生じ、生産者のみならず、消費者に対しても多大な経済的損失を与える。故に、それら有害生物の有効な防除は効率的・安定的な農作物の生産を達成するために、極めて重要な課題である。また、宿主が伴侶動物・愛玩動物や家畜・家禽等の動物である場合には、対象となる動物の健康を維持する目的で、さらに、対象となる動物が家畜・家禽等である場合には、安全な食料や高品質な羊毛・羽毛・皮革等の生活資材を安定して生産するという目的からもそれら有害生物

の有効な防除は重要な課題である。このような観点から、従来、病原菌や寄生虫の防除を目的とする有害生物防除剤の開発が進み、多数の有効な薬剤が今日まで実用に供されてきた。

しかしながら、こうした薬剤の長年にわたる使用により、近年、病原菌や寄生虫が薬剤抵抗性を獲得し、従来用いられてきた既存の有害生物防除剤による防除が困難となる場面が増えてきている。また、既存の有害生物防除剤の一部のものは毒性が高く、或いはあるものは環境中に長期間残留することにより、生態系を攪乱するという問題も顕在化しつつある。このような状況下、病原菌や寄生虫に対する優れた防除活性を有するのみならず、低毒性且つ低残留性等の高度な防除特性を併せ持つ新規な有害生物防除剤並びに有効な防除方法の開発が常に期待されている。

課題を解決するための手段

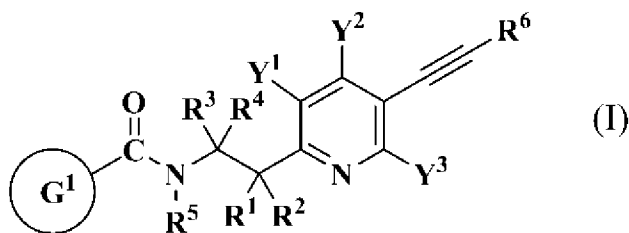
[0006] 本発明者らは、上記の課題解決を目標に鋭意研究を重ねた結果、下記式 (I) で表される新規なアルキニルピリジン置換アミド化合物が優れた有害生物防除活性、特に抗真菌・殺線虫活性を示し、且つ、植物やホ乳動物、魚類、有用昆虫及び天敵等の非標的生物に対してほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物であることを見出し、本発明を完成した。

すなわち、本発明は下記〔1〕～〔86〕に関するものである。

[0007] 〔1〕

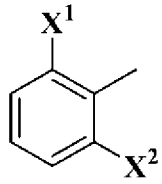
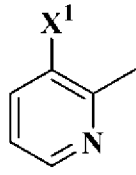
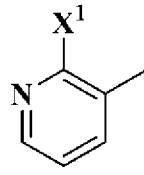
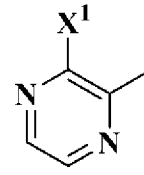
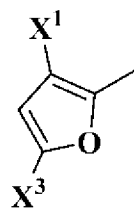
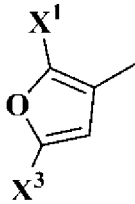
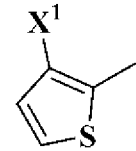
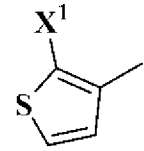
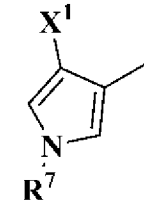
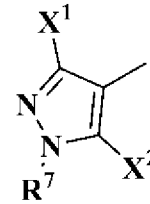
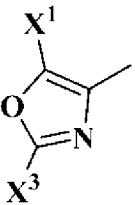
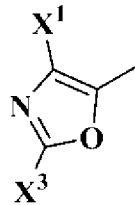
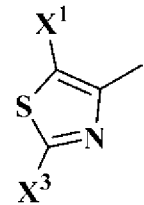
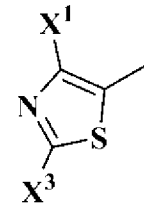
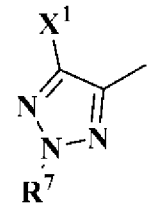
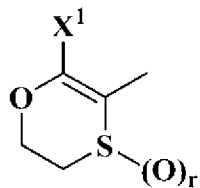
式 (I) で表されるアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[化1]



[式中、G¹は、G¹-1～G¹-16で表される構造を表し、

[化2]

G¹-1G¹-2G¹-3G¹-4G¹-5G¹-6G¹-7G¹-8G¹-9G¹-10G¹-11G¹-12G¹-13G¹-14G¹-15G¹-16

[0008] X¹は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₄アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃ハロアルコキシ、C₁~C₃アルキルチオ、C₁~C₃アルキルスルフィニル、C₁~C₃アルキルスルホニル、C₁~C₃ハロアルキルチオ又はC₁~C₃ハロアルキルスルホニルを表し、

X²は、水素原子又はハロゲン原子を表し、ただし、G¹がG¹-10で表される構造であり、且つX¹がジハロメチルを表す場合には、X²は水素原子を表し、

X³は、水素原子又はC₁~C₄アルキルを表し、

Y¹は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ、C₁~C₄アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃ハロアルコキシ又はC₁~C₃アルキルチオ

を表し、

Y^2 及び Y^3 は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子又はメチルを表し、

R^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、フェニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3\sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロアルキニルオキシ、シアノ($C_1\sim C_4$)アルコキシ、フェニル($C_1\sim C_4$)アルコキシ、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニル($C_1\sim C_4$)アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシアミノ、 $-C(O)NH_2$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

ここで、 R^1 と R^2 とは一緒になって $C_2\sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このとき前記アルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1～2個含んでもよく、且つ $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、オキソ又はチオキソによって任意に置換されていてもよいことを表すか、 R^1 と R^2 とが一緒になって $C_1\sim C_6$ アルキリデン、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキリデン又は $C_1\sim C_4$ アルコキシ($C_1\sim C_2$)アルキリデンを形成することを表し、

R^3 は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^4 は、水素原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

ここで、 R^3 と R^4 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^3 及び R^4 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成してもよく、

R^5 は、水素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 R^8 によって置換された($C_1\sim C_2$)アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_4$ アルケニル、 $C_3\sim C_4$ アルキニル、 $-OH$ 、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $-C(O)R^9$ 又は $C_1\sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^6 は、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル($C_3\sim C_6$)シクロアルキル、フェニル($C_3\sim C_6$)

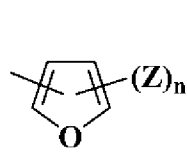
シクロアルキル、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニル又はD-1~D-29を表し、

R^1 がフッ素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_1\sim C_6$ アルコキシを表し、 R^2 がフッ素原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、 R^3 が $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルを表し、且つ R^4 が水素原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表す場合には、 R^6 は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 R^{10} によって任意に置換された($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、ヒドロキシ($C_3\sim C_6$)シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ($C_3\sim C_6$)シクロアルキル、 $C_4\sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_4\sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、トリ($C_1\sim C_4$ アルキル)シリル、フェニルジメチルシリル、 $-C(R^{11})=NOR^{12}$ 又はフェニルを表してもよく、

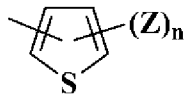
D-1~D-29は、それぞれ下記の構造式で表される芳香族複素環を表し、

[0009]

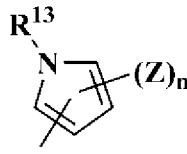
[化3]



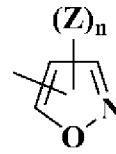
D-1



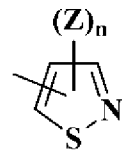
D-2



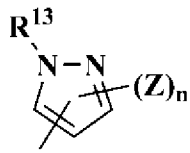
D-3



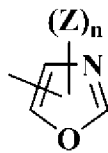
D-4



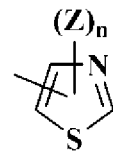
D-5



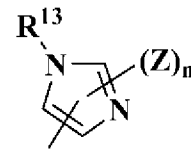
D-6



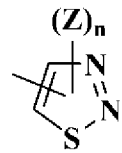
D-7



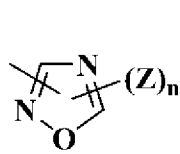
D-8



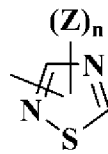
D-9



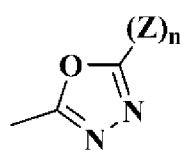
D-10



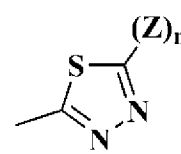
D-11



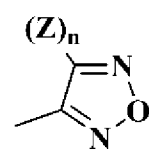
D-12



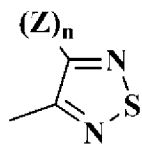
D-13



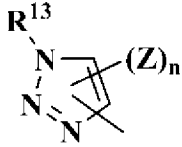
D-14



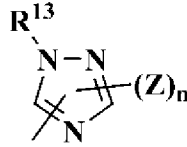
D-15



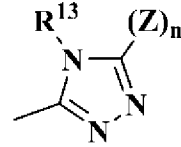
D-16



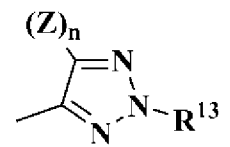
D-17



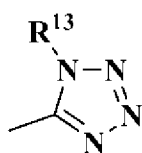
D-18



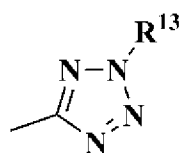
D-19



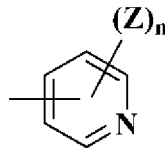
D-20



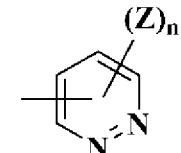
D-21



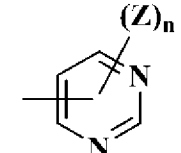
D-22



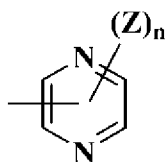
D-23



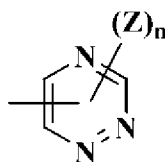
D-24



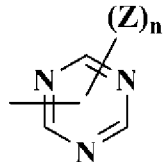
D-25



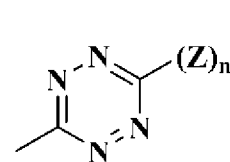
D-26



D-27



D-28



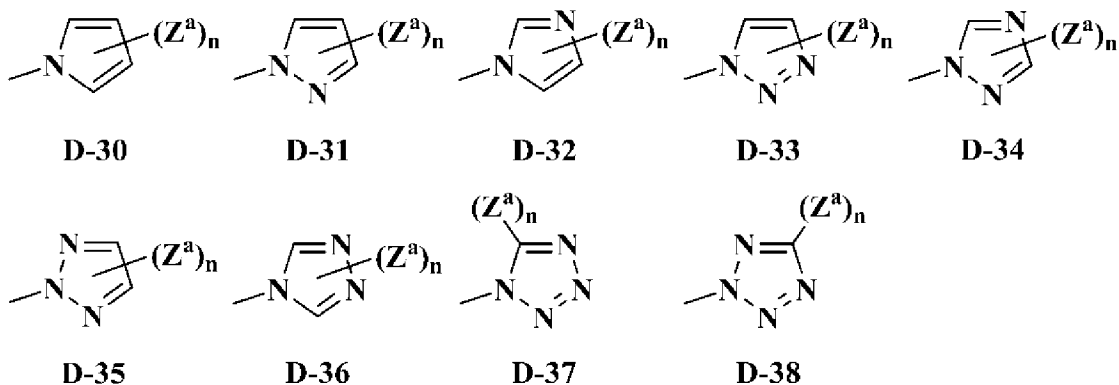
D-29

[0010] Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキル、シアノ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルコキシ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルチオ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルスルフィニル($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルスルホニル($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルチオ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルスルフィニル($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルスルホニル($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_4$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルスルホニル、ジ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル)アミノ、フェニル又はD-30～D-38を表し、m又はnが2以上の場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_r-$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_r\text{CH}_2-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_r-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SO}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{ON}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SN}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{ON}=\text{N}-$ 、 $-\text{SN}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{N}-$ 、 $=\text{NOCH}=\text{}$ 、 $=\text{NSCH}=\text{}$ 、 $=\text{NN}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{}$ 、 $=\text{NON}=\text{}$ 、 $=\text{NSN}=\text{}$ 、 $=\text{NN}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{}$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{NCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{NCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{NN}=\text{CH}-$ 又は $-\text{N}=\text{NCH}=\text{N}-$ を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルコキシ又は $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルチオによって任意に置換されていてもよく、

D-30～D-38は、それぞれ下記の構造式で表される芳香族複素環を表し、

[0011]

[化4]



Z^a は、ハロゲン原子、シアノ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メトキシ又はトリフルオロメチルスルホニルを表し、 n が2以上の場合には、各々の Z^a は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^7 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、

R^8 は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OR^{14}$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)NH_2$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、

R^9 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシメチル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は $C_2 \sim C_4$ アルケニルを表し、

R^{10} は、シアノ、 $-OR^{15}$ 、 $-S(O)_rR^{16}$ 又は $-N(R^{18})R^{17}$ を表し、

R^{11} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{12} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルメチル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキルメチル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキルを表し、

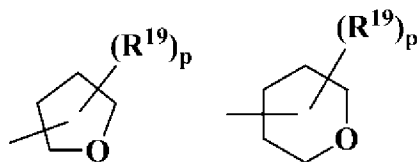
R^{14} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{15} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_2$)アルキル、E-1、E-2、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ ハロアルケニ

ル、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ ハロアルキニル、フェニル又は $(Z)_m$ によって置換されたフェニルを表し、

E-1及びE-2は、それぞれ下記の構造式で表される飽和複素環を表し、

[0012] [化5]



E-1

E-2

R^{16} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ ハロアルキニル、フェニル又は $(Z)_m$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{17} 及び R^{18} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル、フェニル又は $(Z)_m$ によって置換されたフェニルを表すか、

或いは、 R^{17} と R^{18} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{17} 及び R^{18} が結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このとき前記アルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を1個含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、オキソ又はチオキソによって任意に置換されていてもよく、

R^{19} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 p が2の場合には、各々の R^{19} は互いに同一であっても、または互いに相異なってもよく、

m は、1、2、3、4又は5を表し、

n は、0、1、2、3又は4を表し、

p は、0、1又は2を表し、

r は、0、1又は2を表す。]

[0013] [2]

G^1 は、 G^1-1 、 G^1-2 、 G^1-3 、 G^1-4 、 G^1-5 、 G^1-6 、 G^1-7 、 G^1-8 、 G^1-9 、 G^1-10 、 G^1-11 、 G^1-12 、 G^1-14 又は G^1-16 で表される構造を表し、

X^1 は、ハロゲン原子、ニトロ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、メチルチオ、メチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル又はトリフルオロメチルスルホニルを表し、

X^2 は、水素原子、フッ素原子又は塩素原子を表し、ただし、 G^1 が G^1-10 で表される構造を表し、且つ X^1 がジフルオロメチルを表す場合には、 X^2 は水素原子を表し、

X^3 は、メチルを表し、

Y^1 は、ハロゲン原子、メチル、トリフルオロメチル又はメトキシを表し、

Y^2 は、水素原子又はメチルを表し、

Y^3 は、水素原子を表し、

R^1 は、水素原子、フッ素原子、 $C_1\sim C_3$ アルキル、 $C_1\sim C_3$ ハロアルキル、ベンジル、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニルメチル、シクロプロピル、 $C_1\sim C_3$ アルコキシ、 $C_1\sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_4$ アルケニルオキシ、 $C_3\sim C_4$ アルキニルオキシ、シアノメトキシ、ベンジルオキシ、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニルメトキシ、 $C_1\sim C_3$ アルキルチオ又は $C_1\sim C_3$ ハロアルキルチオを表し、

R^2 は、水素原子、フッ素原子又は $C_1\sim C_3$ アルキルを表し、

ここで、 R^1 と R^2 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、 R^1 と R^2 とは一緒になって $C_1\sim C_2$ アルキリデン又は $C_1\sim C_2$ ハロアルキリデンを形成することを表してもよく、

R^3 は、水素原子、 $C_1\sim C_3$ アルキル又は $C_1\sim C_3$ ハロアルキルを表し、

R^4 は、水素原子又は $C_1\sim C_3$ アルキルを表し、

ここで、 R^3 と R^4 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^3 及び R^4 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R⁵は、水素原子、C₁~C₄アルキル、R⁸によって置換された(C₁~C₂)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₂~C₄アルケニル、C₃~C₄アルキニル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルキルチオ、-C(O)R⁹又はC₁~C₄アルコキシカルボニルを表し、

R⁶は、(Z)_mによって置換されたフェニル、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23、D-24、D-25又はD-26を表し、

さらに、R¹がフッ素原子又はC₁~C₃アルキル表し、R²がフッ素原子又はメチルを表し、R³がメチル又はエチルを表し、且つR⁴が水素原子又はメチルを表す場合には、R⁶は水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、R¹⁰によって任意に置換された(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₃~C₆ハロシクロアルキル、ヒドロキシ(C₃~C₆)シクロアルキル、C₁~C₂アルコキシ(C₃~C₆)シクロアルキル、C₄~C₆シクロアルケニル、トリ(C₁~C₄アルキル)シリル、-C(R¹¹)=NOR¹²又はフェニルを表してもよく、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、-SF₅、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルキルチオ、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルホニル、C₁~C₄ハロアルキルチオ、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、D-31~D-35又はD-37を表し、m又はnが2以上を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S(O)_r-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH=CH-, -SCH=CH-, -N(R¹³)CH=CH-, -OCH=N-, -SCH=N-, -N(R¹³)CH=N-, -ON=CH-, -SN=CH-, -N(R¹³)N=CH-, -SN=N-, -N(R¹³)N=N-, =N(R¹³)CH=, =NON=, =NSN=, -CH=CHCH=CH-, -N=CHCH=CH-, -CH=NCH=CH-, -N=NCH=CH-, -N=CHN=CH-, -N=CHCH=N-, -CH=NN=CH-又は-N=NCH=N-を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、シアノ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル又はメ

トキシによって任意に置換されていてもよく、

Z^aは、ハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルを表し、

R⁷は、メチル又はエチルを表し、

R⁸は、シアノ、C₃~C₆シクロアルキル、-OR¹⁴、C₁~C₄アルキルチオ、-C(0)NH₂又は-C(S)NH₂を表し、

R⁹は、C₁~C₄アルキル又はC₃~C₄シクロアルキルを表し、

R¹⁰は、-OR¹⁵又は-S(O)_rR¹⁶を表し、

R¹¹は、水素原子又はメチルを表し、

R¹²は、メチル又はエチルを表し、

R¹³は、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₃~C₄シクロアルキルメチル又はC₃~C₄シクロアルキルを表し、

R¹⁴は、C₁~C₄アルキル又はC₂~C₄ハロアルキルを表し、

R¹⁵は、水素原子、メチル、エチル又はC₁~C₂ハロアルキルを表し、

R¹⁶は、メチル、エチル又はC₁~C₂ハロアルキルを表す、

[1]に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0014] [3]

G¹は、G¹-1、G¹-2、G¹-3、G¹-4、G¹-5、G¹-6、G¹-7、G¹-8、G¹-10、G¹-11、G¹-12、G¹-14又はG¹-16で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子、ニトロ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、メチルチオ、メチルスルホニル又はジフルオロメチルスルホニルを表し、

X²は、水素原子又はフッ素原子を表し、ただし、G¹がG¹-10で表される構造を表し、且つX¹がジフルオロメチルを表す場合には、X²は水素原子を表し、

Y¹は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、

Y²は、水素原子を表し、

R¹は、水素原子、フッ素原子、メチル又はメトキシを表し、

R²は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^1 と R^2 とが一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R^3 は、水素原子、メチル又はエチルを表し、

R^4 は、水素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^3 と R^4 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^3 及び R^4 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R^5 は、水素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 R^8 によって置換された($C_1\sim C_2$)アルキル、シクロプロピル、 $C_2\sim C_4$ アルケニル、 $C_3\sim C_4$ アルキニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $-C(O)R^9$ 又は $C_1\sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^6 は、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニル、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23又はD-25を表し、

さらに、 R^1 がフッ素原子を表し、 R^2 がフッ素原子を表し、 R^3 がメチルを表し、且つ R^4 が水素原子又はメチルを表す場合には、 R^6 は $C_1\sim C_4$ ハロアルキル又は $C_3\sim C_6$ シクロアルキルを表してもよく、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、m又はnが2以上を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^{13})CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、 $-N(R^{13})CH=N-$ 、 $-ON=CH-$ 、 $-SN=CH-$ 、 $-N(R^{13})N=CH-$ 、 $-N(R^{13})N=N-$ 、 $=NN(R^{13})CH=$ 、 $=NO$ 、 $N=$ 、 $=NSN=$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフル

オロメチルによって任意に置換されていてもよく、

R^7 は、メチルを表し、

R^8 は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OR^{14}$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し、

R^9 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

m は、1、2又は3を表し、

n は、0、1、2又は3を表す、

[2]に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0015] [4]

G^1 は、 G^1-1 、 G^1-2 、 G^1-3 、 G^1-4 、 G^1-7 、 G^1-8 、 G^1-10 で表される構造を表し、

Y^1 は、ハロゲン原子を表し、

Y^2 は、水素原子を表し、

R^1 は、水素原子、フッ素原子、メチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロエトキシ、アリルオキシ、プロパルギルオキシ、ベンジルオキシ、メチルチオを表し、

R^2 は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^1 と R^2 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R^3 は、水素原子又はメチルを表し、

R^5 は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 R^8 によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $-C(O)R^9$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^6 は、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニル、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23、D-2

5又はD-26を表し、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、m又はnが2以上を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、

R^7 は、メチルを表し、

R^9 は、 $C_1\sim C_4$ アルキルを表し、

R^{14} は、 $C_1\sim C_4$ アルキルを表し、

mは、1、2又は3を表し、

nは、0、1又は2を表す、

[2]に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0016] [5]

G^1 は、 G^1-1 、 G^1-2 、 G^1-3 、 G^1-4 又は G^1-10 で表される構造を表し、

X^1 は、ハロゲン原子、ニトロ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、メチルチオ、メチルスルホニル又はジフルオロメチルスルホニルを表し、

X^2 は、水素原子を表し、

Y^1 は、ハロゲン原子を表し、

R^1 は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

R⁵は、水素原子を表し、

R⁶は、(Z)_mによって置換されたフェニルを表し、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₄アルキル、トリフルオロメチル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、mが2又は3を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH₂CH₂CH₂-、-OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-、-OCH=CH-、-SCH=CH-、-OCH=N-、-SCH=N-又は-CH=CH-CH=CH-を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、mは1、2又は3を表し、nは0を表す、

[4]に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0017] [6]

G¹は、G¹-1、G¹-2、G¹-3、G¹-4又はG¹-10で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、

X²は、水素原子を表し、

Y¹は、ハロゲン原子を表し、

R¹は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

R²は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

ここで、R¹とR²とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R¹及びR²が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R⁴は、水素原子を表し、

R⁵は、水素原子、エチル、シアノメチル、プロピニル又は-C(O)R⁹を表し、

R^6 は、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニルを表し、

Z は、ハロゲン原子、トリフルオロメチル、又はトリフルオロメトキシを表し、 m 又は n が2以上を表す場合には、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの Z が隣接する場合には、隣接する2つの Z は $-OCH_2O-$ を形成することにより、それぞれの Z が結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子によって任意に置換されていてもよく、

R^9 は、メチルを表し、

m は、1、2又は3を表す、

[3]に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0018] [7]

G^1 は、 G^1-2 又は G^1-10 で表される構造を表し、

R^1 は、水素原子又はメチルを表し、

R^2 は、水素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^1 と R^2 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R^3 は、水素原子又はメチルを表し、

R^5 は、水素原子を表し、

Z は、ハロゲン原子を表し、

m は、1を表す、

[6]に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0019] [8]

G^1 は、 G^1-1 で表される構造を表し、

X^1 は、ハロゲン原子、ニトロ、メチル、トリフルオロメチル又はメチルスルホニルを表し、

X²は、水素原子を表す、

[1] ~ [6] のいずれか 1 項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0020] [9]

G¹は、G¹⁻¹で表される構造を表し、

X¹及びX²は、水素原子を表す、

[1] ~ [6] のいずれか 1 項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0021] [10]

G¹は、G¹⁻¹で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、

X²は、フッ素原子又は塩素原子を表す

[1] ~ [6] のいずれか 1 項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0022] [11]

G¹は、G¹⁻¹で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルを表し、

X²は、水素原子又はフッ素原子を表す、

[1] ~ [6] のいずれか 1 項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0023] [12]

G¹は、G¹⁻²又はG¹⁻³で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メチルチオ、メチルスルホニル又はジフルオロメチルスルホニルを表す、

[1] ~ [7] のいずれか 1 項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0024] [13]

G¹は、G¹⁻²で表される構造を表し、

X¹は、メトキシ又はトリフルオロメチルスルホニルを表す、
〔1〕～〔7〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0025] 〔14〕

G¹は、G¹⁻⁴で表される構造を表し、
X¹は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表す、
〔1〕～〔6〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0026] 〔15〕

G¹は、G¹⁻⁴で表される構造を表し、
X¹は、メチル又はジフルオロメチルを表す、
〔1〕～〔6〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0027] 〔16〕

G¹は、G¹⁻⁵又はG¹⁻⁶で表される構造を表し、
X¹は、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、
X³は、水素原子又はメチルを表す、
〔1〕～〔6〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0028] 〔17〕

G¹は、G¹⁻⁷又はG¹⁻⁸で表される構造を表し、
X¹は、ハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルを表す、
〔1〕～〔6〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0029] 〔18〕

G¹は、G¹⁻⁷又はG¹⁻⁸で表される構造を表し、
X¹は、ジフルオロメチルを表す、
〔1〕～〔6〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、

物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0030] [19]

G¹は、G¹⁻⁹で表される構造を表し、

X¹は、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、

R⁷は、メチルを表す、

[1] ~ [6] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0031] [20]

G¹は、G¹⁻¹⁰で表される構造を表し、

X¹は、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、

X²は、水素原子を表し、

R⁷は、メチルを表す、

[1] ~ [7] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0032] [21]

G¹は、G¹⁻¹⁰で表される構造を表し、

X¹は、メチル、エチル又はトリフルオロメチルを表し、

X²は、フッ素原子又は塩素原子を表し、

R⁷はメチルを表す、

[1] ~ [7] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0033] [22]

G¹は、G¹⁻¹¹又G¹⁻¹²はで表される構造を表し、

X¹は、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、

X³は、水素原子又はメチルを表す、

[1] ~ [7] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0034] [23]

G¹は、G¹-1 3はで表される構造を表し、

X¹は、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、

X³は、メチルを表す、

〔1〕、〔4〕又は〔5〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0035] [24]

G¹は、G¹-1 4で表される構造を表し、

X¹はジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、

X³はメチルを表す

R⁷はメチルを表す、

〔1〕～〔6〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0036] [25]

G¹は、G¹-1 5で表される構造を表し、

X¹はジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、

R⁷はメチルを表す、

〔1〕～〔6〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0037] [26]

G¹は、G¹-1 6で表される構造を表し、

X¹はメチル又はトリフルオロメチルを表し、

rは0、1又は2を表す、

〔1〕～〔6〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0038] [27]

Y¹は、ハロゲン原子を表し、

Y²及びY³が水素原子である、

〔1〕～〔26〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化

合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0039] [28]

Y¹は、メチル、トリフルオロメチル又はメトキシを表し、

Y²及びY³が同時に水素原子である、

[1] ~ [26] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0040] [29]

Y¹は、ハロゲン原子又はメチルを表し、

Y²は、メチルを表し、

Y³は、水素原子を表す、

[1] ~ [26] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0041] [30]

R¹が、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、ベンジル及び(Z)_mによって置換されたフェニルメチルを表し、

R²、R³及びR⁴が水素原子を表し、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ又はトリフルオロメチルスルホニルを表し、mは1又は2を表し、mが2を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0042] [31]

R¹が、C₁~C₃アルキルを表し、

R²が、水素原子を表し、

R³が、メチルを表し、

R⁴が、水素原子を表す、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0043] [32]

R¹が、C₁~C₃アルキルを表し、

R²が、フッ素原子及びメチルを表し、

R³及びR⁴が、水素原子を表す、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0044] [33]

R¹が、C₁~C₃アルキルを表し、

R²が、フッ素原子及びメチルを表し、

R³が、メチルを表し、

R⁴が、水素原子を表す、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0045] [34]

R¹は、(Z)_mによって置換されたフェニルメチル又はシクロプロピルを表し、

R²、R³及びR⁴は水素原子を表し、

R⁴は、水素原子を表す、

Zはハロゲン原子を表し、mは1又は2を表し、mが2を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0046] [35]

R¹が、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃ハロアルコキシ、C₃~C₄アルケニルオキシ、C₃~C₄アルキニルオキシ、シアノメトキシ、ベンジルオキシ、(Z)_mによ

って置換されたフェニルメトキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオを表し、

R^2 が、水素原子を表し、

R^3 が、水素原子及びメチルを表し、

R^4 が、水素原子を表し、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ又はトリフルオロメチルスルホニルを表し、mは1又は2を表し、mが2を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0047] [36]

R^1 は、フッ素原子、メチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロエトキシ、アリルオキシ、プロパルギルオキシ、ベンジルオキシ又はメチルチオを表し、

R^2 が、水素原子を表し、

R^3 が、水素原子及びメチルを表し、

R^4 が、水素原子を表す、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0048] [37]

R^1 及び R^2 が各々独立してフッ素原子又はメチルを表し、

R^3 及び R^4 が水素原子を表す、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0049] [38]

R¹が、フッ素原子又はメチルを表し、

R²が、フッ素原子を表し、

R³が、メチル又はエチルを表し、

R⁴が、水素原子又はメチルを表す、

〔1〕～〔29〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0050] 〔39〕

R¹及びR²が水素原子を表し、

R³は、水素原子又はメチルを表し、

R⁴は、水素原子を表す、

〔1〕～〔29〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0051] 〔40〕

R¹及びR²が、水素原子を表し、

R³が、C₁～C₃アルキル又はC₁～C₃ハロアルキルを表し、

R⁴が、水素原子又はC₁～C₃アルキルを表す、

〔1〕～〔29〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0052] 〔41〕

R¹及びR²が、水素原子を表し、

R³及びR⁴がメチルを表し、又はR³及びR⁴が一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R³及びR⁴が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成する、

〔1〕～〔29〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0053] 〔42〕

R¹とR²とが一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R¹及びR²が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成し、

R^3 及び R^4 が、水素原子を表す、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0054] [43]

R^1 と R^2 とが一緒になって $C_1 \sim C_2$ アルキリデン又は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキリデンを形成し、

R^3 及び R^4 が、水素原子を表す、

[1] ~ [29] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0055] [44]

R^5 が、水素原子を表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0056] [45]

R^5 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0057] [46]

R^5 が、 R^8 によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキルを表し、

R^8 が、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル又は $-OR^{14}$ を表し、

R^{14} が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0058] [47]

R^5 が、 R^8 によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキルを表し、

R^8 が、 $-OR^{14}$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $-C(O)NH_2$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、

R^{14} が、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキルを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化

合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0059] [48]

R⁵が、シクロプロピルを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0060] [49]

R⁵が、C₂~C₄アルケニル又はC₃~C₄アルキニルを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0061] [50]

R⁵が、C₁~C₄ハロアルキルチオを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0062] [51]

R⁵が、-C(0)R⁹又はC₁~C₄アルコキシカルボニルを表し、

R⁹が、C₁~C₄アルキルを表し、

R¹⁴が、C₁~C₄アルキルを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0063] [52]

R⁵が、-C(0)R⁹を表し、

R⁹が、C₃~C₄シクロアルキルを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[53]

R⁵が、C₃~C₆シクロアルキルを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0064] [54]

R⁵が、C₁~C₄アルコキシを表す、

[1] ~ [43] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[55]

R⁶が、C₁~C₄アルキルを表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0065] [56]

R⁶が、C₃~C₆シクロアルキルを表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[57]

R⁶が、R¹⁰によって任意に置換された(C₁~C₄)アルキルを表し、

R¹⁰は、-OR¹⁵を表し、

R¹⁵は水素原子、メチル、エチル又はC₁~C₂ハロアルキルを表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0066] [58]

R⁶が、トリ(C₁~C₄アルキル)シリルを表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[59]

R⁶が、-CH=NOR¹²を表し、

R¹²は、メチル又はエチルを表し、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0067] [60]

R⁶が、フェニルを表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0068] [61]

R⁶は、(Z)_mによって置換されたフェニル、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23又はD-25を表し、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルキルチオ、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルホニル、C₁~C₄ハロアルキルチオ、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、m又はnが2以上を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂O-、-OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-、-OCH=CH-、-SCH=CH-、-N(R¹³)CH=CH-、-OCH=N-、-SCH=N-、-N(R¹³)CH=N-、-ON=CH-、-SN=CH-、-N(R¹³)N=CH-、-N(R¹³)N=N-、=NN(R¹³)CH=、=NON=、=NSN=又は-CH=CHCH=CH-を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、

R¹³は、C₁~C₄アルキル又はC₁~C₄ハロアルキルを表し、

mは、1、2又は3を表し、

nは、0、1、2又は3を表す、

[1] ~ [8] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0069] [62]

R⁶が、(Z)_mによって置換されたフェニルを表し、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₄アルキル、トリフルオロメチル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、メチルチオ、メチルスルフ

イニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、 m が2又は3を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{ON}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SN}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{N}-$ 、 $=\text{NN}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{}$ 、 $=\text{NON}=\text{}$ 、 $=\text{NSN}=\text{}$ 又は $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、

R^{13} は $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル又は $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルを表し、

m は1、2又は3を表し、

n は0を表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0070] [63]

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、トリフルオロメチル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルコキシ、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表す、

[62] に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0071] [64]

G^1 は、 G^1-1 、 G^1-2 、 G^1-3 、 G^1-4 、 G^1-5 、 G^1-6 、 G^1-7 、 G^1-8 、 G^1-10 、 G^1-11 、 G^1-12 、 G^1-14 又は G^1-16 で表される構造を表し、

X^1 は、ハロゲン原子、ニトロ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロ

メチル、メトキシ、メチルチオ、メチルスルホニル又はジフルオロメチルスルホニルを表し、

X^2 は、水素原子又はフッ素原子を表し、ただし、 G^1 が G^1-10 で表される構造を表し、且つ X^1 がジフルオロメチルを表す場合には、 X^2 は水素原子を表し、

Y^1 は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、

Y^2 は、水素原子を表し、

R^1 は、水素原子、フッ素原子、メチル又はメトキシを表し、

R^2 は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^1 と R^2 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R^3 は、水素原子、メチル又はエチルを表し、

R^4 は、水素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^3 と R^4 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^3 及び R^4 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R^5 は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 R^8 によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、シクロプロピル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $-C(O)R^9$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^7 は、メチルを表し、

R^8 は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OR^{14}$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し、

R^9 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

m は、1、2又は3を表し、

n は、0、1、2又は3を表す、

[63]に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0072] [65]

2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{ON}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SN}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{N}-$ 、 $=\text{NN}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{N}-$ 、 $=\text{NON}=\text{N}-$ 、 $=\text{NSN}=\text{N}-$ 又は $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよい、

[62]に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0073] [66]

G^1 は、 G^1-1 、 G^1-2 、 G^1-3 、 G^1-4 、 G^1-5 、 G^1-6 、 G^1-7 、 G^1-8 、 G^1-10 、 G^1-11 、 G^1-12 、 G^1-14 又は G^1-16 で表される構造を表し、

X^1 は、ハロゲン原子、ニトロ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、メチルチオ、メチルスルホニル又はジフルオロメチルスルホニルを表し、

X^2 は、水素原子又はフッ素原子を表し、ただし、 G^1 が G^1-10 で表される構造を表し、且つ X^1 がジフルオロメチルを表す場合には、 X^2 は水素原子を表し、

Y^1 は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、

Y^2 は、水素原子を表し、

R^1 は、水素原子、フッ素原子、メチル又はメトキシを表し、

R^2 は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^1 と R^2 とが一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R^3 は、水素原子、メチル又はエチルを表し、

R^4 は、水素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^3 と R^4 とが一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^3 及

びR⁴が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R⁵は、水素原子、C₁~C₄アルキル、R⁸によって置換された(C₁~C₂)アルキル、シクロプロピル、C₂~C₄アルケニル、C₃~C₄アルキニル、C₁~C₄ハロアルキルチオ、-C(O)R⁹又はC₁~C₄アルコキシカルボニルを表し、

R⁷は、メチルを表し、

R⁸は、シアノ、C₃~C₆シクロアルキル、-OR¹⁴又はC₁~C₄アルキルチオを表し、

R⁹は、C₁~C₄アルキルを表し、

R¹⁴は、C₁~C₄アルキルを表し、

mは、1、2又は3を表し、

nは、0、1、2又は3を表す、

[64]に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0074] [67]

Zはハロゲン原子、メチル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルキルチオ、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルホニル、C₁~C₄ハロアルキルチオ、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、D-31~D-35又はD-37を表し、mが2、3、4又は5を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂H₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S(O)_r-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH=CH-, -SCH=CH-, -N(R¹³)CH=CH-, -OCH=N-, -SCH=N-, -N(R¹³)CH=N-, -ON=CH-, -SN=CH-, -N(R¹³)N=CH-, -SN=N-, -N(R¹³)N=N-, =NN(R¹³)CH=, =NON=, =NSN=, -CH=CHCH=CH-, -N=CHCH=CH-, -CH=NCH=CH-, -N=NCH=CH-, -N=CHN=CH-, -N=CHCH=N-, -CH=NN=CH-又は-N=NCH=N-を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハ

ロゲン原子、シアノ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル又はメトキシによって任意に置換されていてもよく、

Z^a はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルを表し、

R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルメチル又は $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し、

m は1、2、3、4又は5を表し、

n は0又は1を表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0075] [68]

R^6 が、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23、D-24、D-25又はD-26を表し、

Zは、Zはハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルを表し、 n が2、3又は4を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なっているてもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは $-CH=CH-CH=CH-$ を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、 n は0、1、2、3又は4を表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0076] [69]

R^6 が、D-1、D-2、D-6、D-8又はD-23を表し、

Zは、Zはハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又はトリフルオロメチルを表し、 n が2を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なっているてもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは $-CH=C$
 $HCH=CH-$ を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に6員

環を形成してもよく、

R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

n は0、1、2又は3を表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0077] [70]

R^6 が、水素原子を表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[71]

R^6 が、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0078] [72]

R^6 が、 R^{10} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキルを表し、

R^{10} は $-S(0)_r$ 、 R^{16} を表し、

R^{16} はメチル、エチル又は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルを表し、

r は0、1又は2を表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0079] [73]

R^6 が、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキルを表す、

[1] ~ [54] のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[74]

R^6 が、 $-C(R^{11})=NOR^{12}$ を表し、

R^{11} はメチルを表し、

R^{12} はメチル又はエチルを表す、

〔1〕～〔54〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0080] 〔75〕

R¹がフッ素原子を表し、

R²がフッ素原子を表し、

R³がメチルを表し、

R⁴が水素原子を表し、

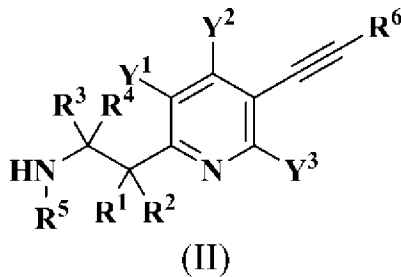
R⁶は、C₁～C₄ハロアルキル又はC₃～C₆シクロアルキルを表す、

〔1〕～〔29〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[0081] 〔76〕

下記式 (II) で表される、〔1〕～〔75〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩の製造中間体。

[化6]



[式中、Y¹は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、

Y²は、水素原子を表し、

Y³は、水素原子を表し、

R¹は、水素原子、フッ素原子、メチル又はメトキシを表し、

R²は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

ここで、R¹とR²とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R¹及びR²が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R³は、水素原子、メチル又はエチルを表し、

R⁴は、水素原子又はメチルを表し、

ここで、R³とR⁴とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R³及びR⁴が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R⁵は、水素原子、C₁~C₄アルキル又はシクロプロピルを表し、

R⁶は、(Z)_mによって置換されたフェニル、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23又はD-25を表し、

さらに、R¹がフッ素原子を表し、R²がフッ素原子を表し、R³がメチルを表し、且つR⁴が水素原子又はメチルを表す場合には、R⁶はC₁~C₄ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル又はトリ(C₁~C₄アルキル)シリルを表してもよく、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルキルチオ、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルホニル、C₁~C₄ハロアルキルチオ、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、m又はnが2以上を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH₂CH₂CH₂-、-OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-、-OCH=CH-、-SCH=CH-、-N(R¹³)CH=CH-、-OCH=N-、-SCH=N-、-N(R¹³)CH=N-、-ON=CH-、-SN=CH-、-N(R¹³)N=CH-、-N(R¹³)N=N-、=NN(R¹³)CH=、=NON=、=NSN=又は-CH=CHCH=CH-を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、

R¹³は、C₁~C₄アルキル又はC₁~C₄ハロアルキルを表し、

mは、1、2又は3を表し、

nは、0、1、2又は3を表す。]

[0082] [77]

〔1〕～〔75〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシドおよびそれらの塩からなる群より選ばれる1種以上を有効成分として含有する有害生物防除剤組成物。

〔78〕

〔1〕～〔75〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシドおよびそれらの塩からなる群より選ばれる1種以上を有効成分として含有する哺乳動物又は鳥類の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

[0083] 〔79〕

哺乳動物又は鳥類に経口投与するための〔78〕に記載の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

〔80〕

哺乳動物又は鳥類に非経口投与するための〔78〕に記載の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

[0084] 〔81〕

哺乳動物又は鳥類に非経口投与する方法が、注射による投与である〔80〕に記載の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

〔82〕

哺乳動物又は鳥類に非経口投与する方法が、経皮投与である〔80〕に記載の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

[0085] 〔83〕

〔1〕～〔75〕のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシドおよびそれらの塩からなる群より選ばれる1種以上を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤又は殺線虫剤組成物。

[0086] 〔84〕

植物に茎葉散布するための〔83〕に記載の農園芸用殺菌剤又は殺線虫剤組成物。

〔85〕

植物が生育する土壌を処理するための〔83〕に記載の農園芸用殺菌剤又は殺線虫剤組成物。

[0087] 〔86〕

植物の種子、塊根又は根茎を処理するための〔83〕に記載の農園芸用殺菌剤又は殺線虫剤組成物。

発明の効果

[0088] 式 (I) で表される本発明化合物及び該化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤は農園芸分野又は畜産・衛生分野等における有害生物、特に真菌類及び線形動物に対して優れた防除効果を発揮し、既存の薬剤に対して抵抗性を獲得したそれらの有害生物に対しても十分な防除効果を発揮する。さらに、植物やホ乳動物、魚類、有用昆虫及び天敵等の非標的生物に対してほとんど悪影響を及ぼさず、低残留性で環境に対する負荷も軽い。

従って、本発明は有用な新規有害生物防除剤を提供することができる。

発明を実施するための形態

[0089] 本発明に包含される式 (I) で表されるアルキニルピリジン置換アミド化合物においては、置換基によっては1個又は2個以上の不斉炭素原子の存在に起因する光学活性体が存在する場合があるが、本発明は全ての光学活性体又はラセミ体を包含する。また、本発明に包含される化合物においては、置換基によってはE-体及びZ-体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明はこれらE-体、Z-体又はE-体及びZ-体を任意の割合で含む混合物を包含するものである。

[0090] 本明細書において、以下の用語又は表現は、それぞれ、以下の意味又は用法で使用される。

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。

置換基の具体的な説明において、以下「n-」との表記は「ノルマル」を、「i-」は「イソ」を、「sec-」は「セカンダリー」を、「tert-」は「ターシ

ャリー」を各々意味する。

[0091] 「C_a~C_bアルキル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素を表し、例えばメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、1-エチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、ヘキシル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0092] 「C_a~C_bハロアルキル」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。例えばフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリクロロメチル、ブロモジフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、1,1-ジフルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、2-ブロモ-2,2-ジフルオロエチル、1,1,2,2-テトラフルオロエチル、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2-ジフルオロプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、3-ブロモ-3,3-ジフルオロプロピル、2,2,3,3-テトラフルオロプロピル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル、2,2,2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル、2,2,2-トリフルオロ-1,1-ジメチルエチル、2,2,3,4,4,4-ヘキサフルオロブチル、2,2,3,3,4,4,4-ヘプタフルオロブチル、ノナフルオロブチル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0093] 「C_a~C_bシクロアルキル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる環状の

炭化水素を表し、3員環から10員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキルによって任意に置換されていてもよい。例えばシクロプロピル、シクロブチル、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロプロピル、シクロペンチル、2,2-ジメチルシクロプロピル、1-メチルシクロブチル、シクロヘキシル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0094] 「C_a~C_bハロシクロアルキル」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる環状の炭化水素を表し、3員環から10員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキルによって任意に置換されていてもよく、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、又ははそれらの両方であってもよく、さらに、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、若しくは互いに相異なってもよい。例えば1-フルオロシクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、2-クロロシクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、2,2-ジクロロシクロプロピル、2,2-ジブromoシクロプロピル、2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル、2,2-ジブromo-1-メチルシクロプロピル、3-フルオロシクロブチル、2,2,3,3-テトラフルオロシクロブチル、1-フルオロシクロペンチル、1-クロロ-2,2-ジメチルシクロプロピル、1-フルオロシクロヘキシル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0095] 「C_a~C_bアルケニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に少なくとも1個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素を表し、例えばビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、3-メチル-3-ブテニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

- [0096] 「 $C_a \sim C_b$ ハロアルケニル」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に少なくとも1個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素を表す。このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。例えば2-フルオロビニル、2-クロロビニル、1,2-ジクロロビニル、2,2-ジクロロビニル、2,2-ジブロモビニル、2-フルオロ-2-プロペニル、2-クロロ-2-プロペニル、3-クロロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、2,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、2,3,3-トリフルオロ-2-プロペニル、2,3,3-トリクロロ-2-プロペニル、1-(トリフルオロメチル)エテニル、4,4-ジフルオロ-3-ブテニル、3,4,4-トリフルオロ-3-ブテニル、2,4,4,4-テトラフルオロ-2-ブテニル、3-クロロ-4,4,4-トリフルオロ-2-ブテニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。
- [0097] 「 $C_a \sim C_b$ シクロアルケニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の、且つ少なくとも1個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素を表し、3員環から10員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキルによって任意に置換されていてもよく、さらに、二重結合はendo-又はexo-のどちらの形式であってもよい。例えば1-シクロペンテニル、2-シクロペンテニル、1-シクロヘキセニル、2-シクロヘキセニル、ビスクロ[2.2.1]-5-ヘプテン-2-イル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。
- [0098] 「 $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルケニル」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の、且つ分子内に少なくとも1個個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素を表し、3員環から10員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキルによって任意に置換されていてもよく、さらに、二重結合はendo-又はexo-のどちらの形式で

あってもよい。このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、例えば2-クロロ-1-シクロブテニル、2-ブロモ-1-シクロペンテニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0099] 「C_a~C_bアルキニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に少なくとも1個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素を表し、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、1-ヘキシニル、3-ヘキシニル、3-メチル-1-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、3,3-ジメチル-1-ブチニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

「C_a~C_bハロアルキニル」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に少なくとも1個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素を表す。このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、例えば2-クロロエチニル、2-ブロモエチニル、2-ヨードエチニル、3-フルオロ-1-プロピニル、3-クロロ-1-プロピニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-ブロモ-1-プロピニル、3-ブロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、3,3-ジフルオロ-1-プロピニル、3,3,3-トリフルオロ-1-プロピニル、3-ブロモ-1-ブチニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0100] 「C_a~C_bアルコキシ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキル-0-を表し、例えばメトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、i-プロピルオキシ、n-ブチルオキシ、i-ブチルオキシ、sec-ブチルオキシ、tert-ブチルオキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0101] 「C_a~C_bハロアルコキシ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるハロアルキル-0-を表し、例えばジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2,-テトラフルオロエトキシ、2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルオキシ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0102] 「C_a~C_bアルケニルオキシ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルケニル-0-を表し、例えば2-プロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ、1-メチル-2-プロペニルオキシ、2-メチル-2-プロペニルオキシ、3-メチル-2-ブテニルオキシ、1, 1-ジメチル-2-プロペニルオキシ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

「C_a~C_bハロアルケニルオキシ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるハロアルケニル-0-を表し、例えば2-フルオロ-2-プロペニルオキシ、2-クロロ-2-プロペニルオキシ、3-クロロ-2-プロペニルオキシ、3, 3-ジフルオロ-2-プロペニルオキシ、2, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ、3, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ、2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニルオキシ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0103] 「C_a~C_bアルキニルオキシ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキニル-0-を表し、例えば2-プロピニルオキシ、2-ブチニルオキシ、1-メチル-2-プロピニルオキシ、1, 1-ジメチル-2-プロピニルオキシ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

「C_a~C_bハロアルキニルオキシ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるハロアルキニル-0-を表し、例えば3-クロロ-2-プロピニルオキシ、3-ブロモ-2-プロピニルオキシ、3-ヨード-2-プロピニルオキシ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

。

[0104] 「C_a~C_bアルキルチオ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキル-S-を表し、例えばメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、sec-ブチルチオ、tert-ブチルチオ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0105] 「C_a~C_bアルキルスルフィニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキル-S(0)-を表し、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、i-プロピルスルフィニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

「C_a~C_bアルキルスルホニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキル-SO₂-を表し、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、i-プロピルスルホニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0106] 「C_a~C_bハロアルキルチオ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S-を表し、例えばジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、ブromジフルオロメチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ、2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルチオ、ヘプタフルオロプロピルチオ、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチルチオ、ノナフルオロブチルチオ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0107] 「C_a~C_bハロアルキルスルフィニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S(0)-を表し、例えばジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

「C_a~C_bハロアルキルスルホニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりな

る前記の意味であるハロアルキル-SO₂-を表し、例えばジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0108] 「ジ(C_a~C_bアルキル)アミノ」の表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキルによって置換されたアミノを表し、例えばジメチルアミノ、エチル(メチル)アミノ、ジエチルアミノ、ジ(n-プロピル)アミノ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0109] 「C_a~C_bアルコキシアミノ」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキル-OH-を表し、例えばメトキシアミノ、エトキシアミノ、n-プロピルオキシアミノ、i-プロピルオキシアミノ、n-ブチルオキシアミノ、i-ブチルオキシアミノ、sec-ブチルオキシアミノ、tert-ブチルオキシアミノ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

「トリ(C_a~C_bアルキル)シリル」の表記は、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキルによって置換されたシリルを表し、例えばトリメチルシリル、トリエチルシリル、トリ(n-プロピル)シリル、エチルジメチルシリル、n-プロピルジメチルシリル、n-ブチルジメチルシリル、i-ブチルジメチルシリル、tert-ブチルジメチルシリル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0110] 「C_a~C_bアルキルカルボニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキル-C(=O)-を表し、例えばアセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、2-メチルブタノイル、ピバロイル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

「C_a~C_bシクロアルキルカルボニル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるシクロアルキル-C(=O)-を表し、例えばシクロプロピル

カルボニル、シクロブチルカルボニル、1-メチルシクロプロピルカルボニル、2-メチルシクロプロピルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、2,2-ジメチルシクロプロピルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0111] 「 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル- $O-C(=O)-$ を表し、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロピルオキシカルボニル、 i -プロピルオキシカルボニル、 n -ブトキシカルボニル、 i -ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0112] 「シアノ($C_d \sim C_e$)アルキル」、「 $C_a \sim C_b$ アルコキシメチル」、「 $C_a \sim C_b$ アルコキシ($C_d \sim C_e$)アルキル」、「 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ($C_d \sim C_e$)アルキル」、「 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ($C_d \sim C_e$)アルキル」、「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル($C_d \sim C_e$)アルキル」、「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル($C_d \sim C_e$)アルキル」、「 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオ($C_d \sim C_e$)アルキル」、「 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニル($C_d \sim C_e$)アルキル」、「 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル($C_d \sim C_e$)アルキル」、「フェニル($C_d \sim C_e$)アルキル」又は「 $(Z)_m$ によって置換されたフェニル($C_d \sim C_e$)アルキル」の表記は、それぞれ前記の意味である任意のシアノ、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオ、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル、フェニル又は $(Z)_m$ によって置換されたフェニルによって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換されたメチル又は炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるアルキルを表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0113] 「 R^8 によって置換された($C_a \sim C_b$)アルキル」の表記は、任意の R^8 によって、炭素原子に結合した水素原子が置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキルを表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択され

る。このとき、(C_a~C_b)アルキル上の置換基R⁸が2個以上存在するとき、それぞれのR⁸は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。

「R¹⁰によって任意に置換された(C_a~C_b)アルキル」の表記は、任意のR¹⁰によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数がa~b個よりなる前記の意味であるアルキルを表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの(C_a~C_b)アルキル上の置換基R¹⁰が2個以上存在するとき、それぞれのR¹⁰は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。

[0114] 「C_a~C_bシクロアルキル(C_d~C_e)シクロアルキル、ヒドロキシ(C_d~C_e)シクロアルキル」、「C_a~C_bアルコキシ(C_d~C_e)シクロアルキル」又はフェニル(C_d~C_e)シクロアルキルの表記は、それぞれ前記の意味である任意のC_a~C_bシクロアルキル、水酸基、前記の意味である任意のC_a~C_bアルコキシ又はフェニルによって、炭素原子に結合した水素原子が置換された炭素原子数がd~e個よりなる前記の意味であるシクロアルキルを表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

「C_a~C_bアルキリデン」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、二重結合によって結合した炭化水素を表し、例えばメチリデン、エチリデン、プロピリデン、1-メチルエチリデン、ブチリデン、1-メチルプロピリデン、ペンチリデン、1-メチルブチリデン、1-エチルエチリデン、ヘキシリデン等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0115] 「C_a~C_bハロアルキリデン」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、二重結合によって結合した炭化水素を表す。このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。例えばフルオロメチリデン、クロロメチリデン、ジフルオロメチリデン、ジクロロメチリデン、2, 2, 2-トリフルオロエチリデン等が具体例として挙げられ、各々の指

定の炭素原子数の範囲で選択される。

「 $C_a \sim C_b$ アルコキシ($C_d \sim C_e$)アルキリデン」の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルコキシによって、炭素原子に結合した水素原子が置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるアルキリデンを表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0116] 「シアノ($C_a \sim C_b$)アルコキシ」、「フェニル($C_a \sim C_b$)アルコキシ」又は「(Z)_mによって置換されたフェニル($C_a \sim C_b$)アルコキシ」の表記は、シアノ、フェニル又は(Z)_mによって置換されたフェニルによって、炭素原子に結合した水素原子が置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルコキシを表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

「 R^1 と R^2 とは一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成し、ここで R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このとき前記アルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1～2個含んでもよく、」の表記の具体例として、例えばシクロプロパン、オキシラン、チイラン、アジリジン、シクロブタン、オキセタン、チエタン、アゼチジン、シクロペンタン、オキソラン、チオラン、ピロリジン、ジオキソラン、ジチオラン、シクロヘキサン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロチオピラン、ピペリジン、1,3-ジオキササン、1,3-ジチアサン等の環が挙げられ、各々の指定の原子数の範囲で選択される。

[0117] 「 R^{17} と R^{18} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{17} 及び R^{18} が結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このとき前記アルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を1個含んでもよく、」の表記の具体例としては、例えばアジリジン、アゼチジン、ピロリジン、オキサゾリジン、チアゾリジン、ピペリジン、2H-3,4,5,6-テトラヒドロ-1,3-オキサジン、モルホリン、2H-3,4,5,6-テトラヒドロ-1,3-チアジン、チオモルホリン等の環が挙げられ、各々の指定の原子数の範囲で選択される。

[0118] 本発明において、 G^1 で表される置換基の好ましい範囲として、例えば下記

のG¹-I~G¹-XVIIIの各群が挙げられる。

すなわち、G¹-I : G¹-1 [ここで、X¹はハロゲン原子、ニトロ、メチル、トリフルオロメチル又はメチルスルホニルを表し、X²は水素原子を表す。]。

G¹-II : G¹-1 [ここで、X¹及びX²はフッ素原子を表す。]。

G¹-III : G¹-2及びG¹-3 [ここで、X¹はハロゲン原子、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メチルチオ、メチルスルホニル又はジフルオロメチルスルホニルを表す。]。

[0119] G¹-IV : G¹-4 [ここで、X¹はハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表す。]。

G¹-V : G¹-7及びG¹-8 [ここで、X¹はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルを表す。]。

G¹-VI : G¹-10 [ここで、X¹はジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、X²は水素原子を表し、R⁷はメチルを表す。]。

G¹-VII : G¹-14 [ここで、X¹はジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、X³はメチルを表す。]。

G¹-VIII : G¹-1 [ここで、X¹はハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、X²はフッ素原子又は塩素原子を表す。]。

G¹-IX : G¹-2及びG¹-3 [ここで、X¹はメトキシ又はトリフルオロメチルスルホニルを表す。]。

[0120] G¹-X : G¹-4 [ここで、X¹はメチル又はジフルオロメチルを表す。]。

G¹-XI : G¹-5及びG¹-6 [ここで、X¹はジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、X³は水素原子又はメチルを表す。]。

G¹-XII : G¹-7及びG¹-8 [ここで、X¹はジフルオロメチルを表す。]。

G¹-XIII : G¹-9 [ここで、X¹はジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、R⁷はメチルを表す。]。

[0121] G¹-XIV : G¹-10 [ここで、X¹はメチル、エチル又はトリフルオロメチルを表し、X²はフッ素原子又は塩素原子を表し、R⁷はメチルを表す。]。

G¹-XV : G¹-11及びG¹-12 [ここで、X¹はジフルオロメチル又はトリフルオロ

メチルを表し、 X^3 は水素原子又はメチルを表す。]

G^1 -XVI : G^1 -13 [ここで、 X^1 はジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、 X^3 はメチルを表す。]

G^1 -XVII : G^1 -15 [ここで、 X^1 はジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、 R^7 はメチルを表す。]

G^1 -XVIII : G^1 -16 [ここで、 X^1 はメチル又はトリフルオロメチルを表し、 r は0、1又は2を表す。]

[0122] これらのうち、 G^1 で表される置換基の範囲としては G^1 -I~ G^1 -VII、 G^1 -XI、 G^1 -XIII、 G^1 -XVII又は G^1 -XVIIIがより好ましく、さらに、 G^1 -I~ G^1 -VIIが特に好ましい。

本発明において、 Y^1 、 Y^2 及び Y^3 で表される置換基の好ましい範囲の組み合わせとして、例えば下記Y-I~Y-IIIの各群が挙げられる。

すなわち、Y-I : Y^1 がハロゲン原子、且つ Y^2 及び Y^3 が同時に水素原子。

Y-II : Y^1 がメチル、トリフルオロメチル又はメトキシ、且つ Y^2 及び Y^3 が同時に水素原子。

[0123] Y-III : Y^1 がハロゲン原子又はメチル、 Y^2 がメチル、且つ Y^3 が水素原子。

これらのうち、 Y^1 、 Y^2 及び Y^3 で表される置換基の組み合わせとしてはY-I及びY-IIがより好ましく、さらに、Y-Iが特に好ましい。

本発明において、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 で表される置換基の好ましい範囲の組み合わせとして、例えば下記R-I~R-XIVの各群が挙げられる。

すなわち、R-I : R^1 及び R^2 が水素原子、 R^3 が水素原子又はメチル、且つ R^4 が水素原子。

[0124] R-II : R^1 が $(Z)_m$ によって置換されたフェニルメチル [ここで、 Z はハロゲン原子を表し、 m は1又は2を表し、 m が2を表す場合には、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい。] 及びシクロプロピル、且つ R^2 、 R^3 及び R^4 が水素原子。

R-III : R^1 がフッ素原子、メチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロエトキシ、アリルオキシ、プロパルギルオキシ、ベンジルオキシ又はメチルチオ

、 R^2 が水素原子、 R^3 が水素原子又はメチル、且つ R^4 が水素原子。

R-IV : R^1 及び R^2 が各々独立してフッ素原子又はメチル、且つ R^3 及び R^4 が水素原子。

R-V : R^1 がフッ素原子又はメチル、 R^2 がフッ素原子、 R^3 がメチル又はエチル、且つ R^4 が水素原子又はメチル。

[0125] R-VI : R^1 と R^2 とが一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成し、且つ R^3 及び R^4 が水素原子。

R-VII : R^1 と R^2 とが一緒になって $C_1 \sim C_2$ アルキリデン又は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキリデンを形成し、且つ R^3 及び R^4 が水素原子。

R-VIII : R^1 及び R^2 が水素原子、 R^3 が $C_1 \sim C_3$ アルキル又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、且つ R^4 が水素原子又は $C_1 \sim C_3$ アルキル。

R-IX : R^1 及び R^2 が水素原子、且つ R^3 及び R^4 がメチル又は R^3 及び R^4 が一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^3 及び R^4 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成。

[0126] R-X : R^1 が $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、ベンジル又は $(Z)_m$ によって置換されたフェニルメチル [ここで、Zはハロゲン原子、シアノ、ニトロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ又はトリフルオロメチルスルホニルを表し、mは1又は2を表し、mが2を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい。]、且つ R^2 、 R^3 及び R^4 が水素原子。

[0127] R-XI : R^1 が $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_4$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_4$ アルキニルオキシ、シアノメトキシ、ベンジルオキシ、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニルメトキシ [ここで、Zはハロゲン原子、シアノ、ニトロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル

、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ又はトリフルオロメチルスルホニルを表し、 m は1又は2を表し、 m が2を表す場合には、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい。]、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオ、 R^2 が水素原子、 R^3 が水素原子又はメチル、且つ R^4 が水素原子。

[0128] R-XII : R^1 が $C_1 \sim C_3$ アルキル、 R^2 が水素原子、 R^3 がメチル、且つ R^4 が水素原子。

R-XIII : R^1 が $C_1 \sim C_3$ アルキル、 R^2 がフッ素原子又はメチル、且つ R^3 及び R^4 が水素原子。

R-XIV : R^1 が $C_1 \sim C_3$ アルキル、 R^2 がフッ素原子又はメチル、 R^3 がメチル、且つ R^4 が水素原子。

[0129] これらのうち、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 で表される置換基の範囲の組み合わせとしてとしてはR-I~R-VII、R-VIII及びR-XIがより好ましく、さらに、R-I、R-III~R-V、R-VI及びR-VIIが特に好ましい。

[0130] 本発明に包含される化合物において、 R^5 で表される置換基の好ましい範囲として、例えば下記の R^5 -I~ R^5 -XIの各群が挙げられる。

すなわち、 R^5 -I : 水素原子。

R^5 -II : $C_1 \sim C_4$ アルキル。

R^5 -III : R^8 によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル [ここで、 R^8 はシアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル又は $-OR^{14}$ を表し、 R^{14} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表す。]。

R^5 -IV : シクロプロピル。

R^5 -V : $C_2 \sim C_4$ アルケニル又は $C_3 \sim C_4$ アルキニル。

R^5 -VI : $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ。

R^5 -VII : $-C(O)R^9$ [ここで、 R^9 は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表す。] 又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル。

[0131] R^5 -VIII : R^8 によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル [ここで、 R^8 は $-OR^{14}$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $-C(O)NH_2$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、 R^{14} は $C_2 \sim C_4$ ハロアルキルを表す。]。

R^5 -IX : $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル。

R^5 -X : $C_1 \sim C_4$ アルコキシ。

R^5 -XI : $-C(O)R^9$ [ここで、 R^9 は $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表す。]。

これらのうち、 R^5 で表される置換基の範囲としては R^5 -I \sim R^5 -VIII及び R^5 -X
Iがより好ましく、さらに、 R^5 -I \sim R^5 -III及び R^5 -V \sim R^5 -VIIが特に好ましい。

[0132] 本発明において、 R^6 で表される置換基の好ましい範囲として、例えば下記の R^6 -II \sim R^6 -XVの各群が挙げられる。

すなわち、 R^6 -I : $C_1 \sim C_4$ アルキル。

R^6 -II : $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル。

R^6 -III : R^{10} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル [ここで、 R^{10} は
 $-OR^{15}$ を表し、 R^{15} は水素原子、メチル、エチル又は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルを表
す。]。

R^6 -IV : トリ($C_1 \sim C_4$ アルキル)シリル。

R^6 -V : $-\text{CH}=\text{NOR}^{12}$ [ここで、 R^{12} はメチル又はエチルを表す。]。

R^6 -VI : フェニル。

[0133] R^6 -VII : (Z) $_m$ によって置換されたフェニル [ここで、 Z はハロゲン原子、シ
アノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 C
 $_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル
、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオ
ロメチルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、 m が2又は3を表す場合に
は、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さら
に、2つの Z が隣接する場合には、隣接する2つの Z は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$
 $-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-$
 $\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{ON}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SN}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{N}-$ 、 $=$
 $\text{NN}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{}$ 、 $=\text{NON}=\text{}$ 、 $=\text{NSN}=\text{}$ 又は $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、それぞ
れの Z が結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このと
き、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチ
ル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、 R^{13} は $C_1 \sim$

C_4 アルキル又は $C_1\sim C_4$ ハロアルキルを表し、 m は1、2又は3を表し、 n は0を表す。]

[0134] R^6 -VIII : D-1、D-2、D-6、D-8又はD-23 [ここで、 Z はハロゲン原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル又はトリフルオロメチルを表し、 n は0、1、2又は3を表し、 n が2又は3を表す場合には、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの Z が隣接する場合には、隣接する2つの Z は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、それぞれの Z が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、 R^{13} は $C_1\sim C_4$ アルキルを表す。]

R^6 -IX : 水素原子。

R^6 -X : ハロゲン原子又は $C_1\sim C_4$ ハロアルキル。

R^6 -XI : R^{10} によって任意に置換された($C_1\sim C_4$)アルキル [ここで、 R^{10} は $-S(O)_rR^{16}$ を表し、 R^{16} はメチル、エチル又は $C_1\sim C_2$ ハロアルキルを表し、 r は0、1又は2を表す。]

R^6 -XII : $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル。

R^6 -XIII : $-C(R^{11})=NOR^{12}$ [ここで、 R^{11} はメチルを表し、 R^{12} はメチル又はエチルを表す。]

[0135] R^6 -XIV : (Z) $_m$ によって置換されたフェニル [ここで、 Z はハロゲン原子、メチル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、D-31~D-35又はD-37を表し、 m が2、3、4又は5を表す場合には、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの Z が隣接する場合には、隣接する2つの Z は $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S(O)_r-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^{13})CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、 $-N(R^{13})CH=N-$ 、 $-ON=CH-$ 、 $-SN=CH-$ 、 $-N(R^{13})N=CH-$ 、 $-SN=N-$ 、 $-N(R^{13})N=N-$ 、 $=NN(R^{13})CH=$ 、 $=NON=$ 、 $=NSN=$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 、 $-N=CHCH=CH-$ 、 $-CH=NCH=CH-$ 、 $-N=NCH=CH-$ 、 $-N=CHN=CH-$ 、 $-N=CHCH=N-$ 、 $-CH=NN=CH-$ 又は $-N=NCH=N-$ を形成することにより、それぞれの

Zが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、シアノ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル又はメトキシによって任意に置換されていてもよく、Z^aはハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルを表し、R¹⁻³はC₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₃~C₄シクロアルキルメチル又はC₃~C₄シクロアルキルを表し、mは1、2、3、4又は5を表し、nは0又は1を表す。]

[0136] R⁶-XV : D-1、D-2、D-6、D-8、D-23、D-24、D-25又はD-26 [ここで、Zはハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ又はC₁~C₄アルキルスルホニルを表し、nが2、3又は4を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH=CHCH=CH-を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、R¹⁻³はC₁~C₄アルキル又はC₁~C₄ハロアルキルを表し、nは0、1、2、3又は4を表す。]

[0137] これらのうち、R⁶で表される置換基の範囲としてはR⁶-I~R⁶-VIII、R⁶-X、R⁶-XII、R⁶-XIV又はR⁶-XVがより好ましく、さらに、R⁶-I~R⁶-VIIIが特に好ましい。

これらの本発明における各置換基の好ましい範囲を示す各群はそれぞれ任意に組み合わせることができ、それぞれ本発明化合物の好ましい範囲を表す。

式(I)で表される化合物のG¹、R¹~R⁴(R-I~R-XIVで表記)及びR⁶についての好ましい範囲の組み合わせの例としては、例えば以下の第1表に示す組み合わせが挙げられる。但し、第1表の組み合わせは例示のためのものであって、式(I)で表される化合物はこれらのみ限定されるものではない。

[0138]

[表1-1]

第1表

| G ¹ | R ¹ ~R ⁴ | R ⁶ |
|-------------------|--------------------------------|----------------------|
| G ¹ -I | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-I | R ⁶ -XIV |
| G ¹ -I | R-I | R ⁶ -XV |
| G ¹ -I | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-II | R ⁶ -XIV |
| G ¹ -I | R-II | R ⁶ -XV |
| G ¹ -I | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-III | R ⁶ -XIV |
| G ¹ -I | R-III | R ⁶ -XV |
| G ¹ -I | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-IV | R ⁶ -XIV |
| G ¹ -I | R-IV | R ⁶ -XV |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -III |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -V |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -IX |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -X |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -XI |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -XII |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -XIII |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -XIV |
| G ¹ -I | R-V | R ⁶ -XV |
| G ¹ -I | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-VI | R ⁶ -XIV |
| G ¹ -I | R-VI | R ⁶ -XV |
| G ¹ -I | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-VII | R ⁶ -XIV |
| G ¹ -I | R-VII | R ⁶ -XV |
| G ¹ -I | R-VIII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-VIII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-IX | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-IX | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-X | R ⁶ -VII |

第1表 (続き)

| G ¹ | R ¹ ~R ⁴ | R ⁶ |
|---------------------|--------------------------------|----------------------|
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -IX |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -X |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -XI |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -XII |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -XIII |
| G ¹ -VI | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-VIII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-VIII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-IX | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-IX | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-X | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-X | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-XI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-XI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-XII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-XII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-XIII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-XIII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-XIV | R ⁶ -I |
| G ¹ -VI | R-XIV | R ⁶ -II |
| G ¹ -VI | R-XIV | R ⁶ -IV |
| G ¹ -VI | R-XIV | R ⁶ -VI |
| G ¹ -VI | R-XIV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-XIV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VII | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VII | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VII | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VII | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VII | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VII | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VII | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VII | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VII | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -VII | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -VII | R-V | R ⁶ -III |
| G ¹ -VII | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -VII | R-V | R ⁶ -V |
| G ¹ -VII | R-V | R ⁶ -VI |

[0139] [表1-2]

| | | | | | |
|--------------------|--------|----------------------|----------------------|--------|----------------------|
| G ¹ -I | R-X | R ⁶ -VIII | G ¹ -VII | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-XI | R ⁶ -VII | G ¹ -VII | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-XI | R ⁶ -VIII | G ¹ -VII | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-XII | R ⁶ -VII | G ¹ -VII | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-XII | R ⁶ -VIII | G ¹ -VII | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-XIII | R ⁶ -VII | G ¹ -VII | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-XIII | R ⁶ -VIII | G ¹ -VII | R-VIII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-XIV | R ⁶ -I | G ¹ -VII | R-VIII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-XIV | R ⁶ -II | G ¹ -VII | R-IX | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-XIV | R ⁶ -IV | G ¹ -VII | R-IX | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-XIV | R ⁶ -VI | G ¹ -VII | R-X | R ⁶ -VII |
| G ¹ -I | R-XIV | R ⁶ -VII | G ¹ -VII | R-X | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -I | R-XIV | R ⁶ -VIII | G ¹ -VII | R-XI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-I | R ⁶ -VII | G ¹ -VII | R-XI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-I | R ⁶ -VIII | G ¹ -VII | R-XI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-I | R ⁶ -XIV | G ¹ -VII | R-XII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-I | R ⁶ -XV | G ¹ -VII | R-XII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-II | R ⁶ -VII | G ¹ -VII | R-XIII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-II | R ⁶ -VIII | G ¹ -VII | R-XIII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-II | R ⁶ -XIV | G ¹ -VII | R-XIV | R ⁶ -I |
| G ¹ -II | R-II | R ⁶ -XV | G ¹ -VII | R-XIV | R ⁶ -II |
| G ¹ -II | R-III | R ⁶ -VII | G ¹ -VII | R-XIV | R ⁶ -IV |
| G ¹ -II | R-III | R ⁶ -VIII | G ¹ -VII | R-XIV | R ⁶ -VI |
| G ¹ -II | R-III | R ⁶ -XIV | G ¹ -VII | R-XIV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-III | R ⁶ -XV | G ¹ -VIII | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-IV | R ⁶ -VII | G ¹ -VIII | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-IV | R ⁶ -VIII | G ¹ -VIII | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-IV | R ⁶ -XIV | G ¹ -VIII | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-IV | R ⁶ -XV | G ¹ -VIII | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -I | G ¹ -VIII | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -II | G ¹ -VIII | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -III | G ¹ -VIII | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -IV | G ¹ -VIII | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -V | G ¹ -VIII | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -VI | G ¹ -VIII | R-V | R ⁶ -III |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -VII | G ¹ -VIII | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -VIII | G ¹ -VIII | R-V | R ⁶ -V |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -IX | G ¹ -VIII | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -X | G ¹ -VIII | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -XI | G ¹ -VIII | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -XII | G ¹ -VIII | R-V | R ⁶ -X |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -XIII | G ¹ -VIII | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -XIV | G ¹ -VIII | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-V | R ⁶ -XV | G ¹ -VIII | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-VI | R ⁶ -VII | G ¹ -VIII | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-VI | R ⁶ -VIII | G ¹ -VIII | R-VIII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-VI | R ⁶ -XIV | G ¹ -VIII | R-VIII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-VI | R ⁶ -XV | G ¹ -VIII | R-XI | R ⁶ -VII |

[0140] [表1-3]

| | | | | | |
|---------------------|--------|----------------------|----------------------|--------|----------------------|
| G ¹ -II | R-VII | R ⁶ -VII | G ¹ -VIII | R-XI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-VII | R ⁶ -VIII | G ¹ -IX | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-VII | R ⁶ -XIV | G ¹ -IX | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-VII | R ⁶ -XV | G ¹ -IX | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-VIII | R ⁶ -VII | G ¹ -IX | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-VIII | R ⁶ -VIII | G ¹ -IX | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-IX | R ⁶ -VII | G ¹ -IX | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-IX | R ⁶ -VIII | G ¹ -IX | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-X | R ⁶ -VII | G ¹ -IX | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-X | R ⁶ -VIII | G ¹ -IX | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -II | R-XI | R ⁶ -VII | G ¹ -IX | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -II | R-XI | R ⁶ -VIII | G ¹ -IX | R-V | R ⁶ -III |
| G ¹ -II | R-XII | R ⁶ -VII | G ¹ -IX | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -II | R-XII | R ⁶ -VIII | G ¹ -IX | R-V | R ⁶ -V |
| G ¹ -II | R-XIII | R ⁶ -VII | G ¹ -IX | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -II | R-XIII | R ⁶ -VIII | G ¹ -IX | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-XIV | R ⁶ -I | G ¹ -IX | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-XIV | R ⁶ -II | G ¹ -IX | R-V | R ⁶ -X |
| G ¹ -II | R-XIV | R ⁶ -IV | G ¹ -IX | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-XIV | R ⁶ -VI | G ¹ -IX | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -II | R-XIV | R ⁶ -VII | G ¹ -IX | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -II | R-XIV | R ⁶ -VIII | G ¹ -IX | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-I | R ⁶ -VII | G ¹ -X | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-I | R ⁶ -VIII | G ¹ -X | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-I | R ⁶ -XIV | G ¹ -X | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-I | R ⁶ -XV | G ¹ -X | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-IX | R ⁶ -VII | G ¹ -X | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-IX | R ⁶ -VIII | G ¹ -X | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-II | R ⁶ -VII | G ¹ -X | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-II | R ⁶ -VIII | G ¹ -X | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-II | R ⁶ -XIV | G ¹ -X | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -III | R-II | R ⁶ -XV | G ¹ -X | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -III | R-III | R ⁶ -VII | G ¹ -X | R-V | R ⁶ -III |
| G ¹ -III | R-III | R ⁶ -VIII | G ¹ -X | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -III | R-III | R ⁶ -XIV | G ¹ -X | R-V | R ⁶ -V |
| G ¹ -III | R-III | R ⁶ -XV | G ¹ -X | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -III | R-IV | R ⁶ -VII | G ¹ -X | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-IV | R ⁶ -VIII | G ¹ -X | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-IV | R ⁶ -XIV | G ¹ -X | R-V | R ⁶ -X |
| G ¹ -III | R-IV | R ⁶ -XV | G ¹ -X | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -I | G ¹ -X | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -II | G ¹ -X | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -III | G ¹ -X | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -IV | G ¹ -X | R-VIII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -V | G ¹ -X | R-VIII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -VI | G ¹ -X | R-XI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -VII | G ¹ -X | R-XI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -VIII | G ¹ -XI | R-I | R ⁶ -VII |

[0141] [表1-4]

| | | | | | |
|---------------------|--------|----------------------|---------------------|--------|----------------------|
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -IX | G ¹ -XI | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -X | G ¹ -XI | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -XI | G ¹ -XI | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -XII | G ¹ -XI | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -XIII | G ¹ -XI | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -XIV | G ¹ -XI | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-V | R ⁶ -XV | G ¹ -XI | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-VI | R ⁶ -VII | G ¹ -XI | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -III | R-VI | R ⁶ -VIII | G ¹ -XI | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -III | R-VI | R ⁶ -XIV | G ¹ -XI | R-V | R ⁶ -III |
| G ¹ -III | R-VI | R ⁶ -XV | G ¹ -XI | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -III | R-VII | R ⁶ -VII | G ¹ -XI | R-V | R ⁶ -V |
| G ¹ -III | R-VII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XI | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -III | R-VII | R ⁶ -XIV | G ¹ -XI | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-VII | R ⁶ -XV | G ¹ -XI | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-VIII | R ⁶ -VII | G ¹ -XI | R-V | R ⁶ -X |
| G ¹ -III | R-VIII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XI | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-X | R ⁶ -VII | G ¹ -XI | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-X | R ⁶ -VIII | G ¹ -XI | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-XI | R ⁶ -VII | G ¹ -XI | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-XI | R ⁶ -VIII | G ¹ -XI | R-VIII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-XII | R ⁶ -VII | G ¹ -XI | R-VIII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-XII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XI | R-XI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-XIII | R ⁶ -VII | G ¹ -XI | R-XI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-XIII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XII | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-XIV | R ⁶ -I | G ¹ -XII | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-XIV | R ⁶ -II | G ¹ -XII | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-XIV | R ⁶ -IV | G ¹ -XII | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-XIV | R ⁶ -VI | G ¹ -XII | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -III | R-XIV | R ⁶ -VII | G ¹ -XII | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -III | R-XIV | R ⁶ -VIII | G ¹ -XII | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-I | R ⁶ -VII | G ¹ -XII | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-I | R ⁶ -VIII | G ¹ -XII | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -IV | R-I | R ⁶ -XIV | G ¹ -XII | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -IV | R-I | R ⁶ -XV | G ¹ -XII | R-V | R ⁶ -III |
| G ¹ -IV | R-II | R ⁶ -VII | G ¹ -XII | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -IV | R-II | R ⁶ -VIII | G ¹ -XII | R-V | R ⁶ -V |
| G ¹ -IV | R-II | R ⁶ -XIV | G ¹ -XII | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -IV | R-II | R ⁶ -XV | G ¹ -XII | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-III | R ⁶ -VII | G ¹ -XII | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-III | R ⁶ -VIII | G ¹ -XII | R-V | R ⁶ -X |
| G ¹ -IV | R-III | R ⁶ -XIV | G ¹ -XII | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-III | R ⁶ -XV | G ¹ -XII | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-IV | R ⁶ -VII | G ¹ -XII | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-IV | R ⁶ -VIII | G ¹ -XII | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-IV | R ⁶ -XIV | G ¹ -XII | R-VIII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-IV | R ⁶ -XV | G ¹ -XII | R-VIII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -I | G ¹ -XII | R-XI | R ⁶ -VII |

[0142] [表1-5]

| | | | | | |
|--------------------|--------|----------------------|----------------------|-------|----------------------|
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -II | G ¹ -XII | R-XI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -III | G ¹ -XIII | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -IV | G ¹ -XIII | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -V | G ¹ -XIII | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -VI | G ¹ -XIII | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -VII | G ¹ -XIII | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -VIII | G ¹ -XIII | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -IX | G ¹ -XIII | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -X | G ¹ -XIII | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -XI | G ¹ -XIII | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -XII | G ¹ -XIII | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -XIII | G ¹ -XIII | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -XIV | G ¹ -XIII | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -IV | R-V | R ⁶ -XV | G ¹ -XIII | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-VI | R ⁶ -VII | G ¹ -XIII | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-VI | R ⁶ -VIII | G ¹ -XIII | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-VI | R ⁶ -XIV | G ¹ -XIII | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-VI | R ⁶ -XV | G ¹ -XIII | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-VII | R ⁶ -VII | G ¹ -XIII | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-VII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XIV | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-VII | R ⁶ -XIV | G ¹ -XIV | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-VII | R ⁶ -XV | G ¹ -XIV | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-VIII | R ⁶ -VII | G ¹ -XIV | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-VIII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XIV | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-IX | R ⁶ -VII | G ¹ -XIV | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-IX | R ⁶ -VIII | G ¹ -XIV | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-X | R ⁶ -VII | G ¹ -XIV | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-X | R ⁶ -VIII | G ¹ -XIV | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -IV | R-XI | R ⁶ -VII | G ¹ -XIV | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -IV | R-XI | R ⁶ -VIII | G ¹ -XIV | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -IV | R-XII | R ⁶ -VII | G ¹ -XIV | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -IV | R-XII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XIV | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-XIII | R ⁶ -VII | G ¹ -XIV | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-XIII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XIV | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-XIV | R ⁶ -I | G ¹ -XIV | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-XIV | R ⁶ -II | G ¹ -XIV | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-XIV | R ⁶ -IV | G ¹ -XIV | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-XIV | R ⁶ -VI | G ¹ -XV | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -IV | R-XIV | R ⁶ -VII | G ¹ -XV | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -IV | R-XIV | R ⁶ -VIII | G ¹ -XV | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-I | R ⁶ -VII | G ¹ -XV | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-I | R ⁶ -VIII | G ¹ -XV | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-I | R ⁶ -XIV | G ¹ -XV | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-I | R ⁶ -XV | G ¹ -XV | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-II | R ⁶ -VII | G ¹ -XV | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-II | R ⁶ -VIII | G ¹ -XV | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -V | R-II | R ⁶ -XIV | G ¹ -XV | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -V | R-II | R ⁶ -XV | G ¹ -XV | R-V | R ⁶ -IV |

[0143] [表1-6]

| | | | | | |
|-------------------|--------|----------------------|-----------------------|-------|----------------------|
| G ¹ -V | R-III | R ⁶ -VII | G ¹ -XV | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -V | R-III | R ⁶ -VIII | G ¹ -XV | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-III | R ⁶ -XIV | G ¹ -XV | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-III | R ⁶ -XV | G ¹ -XV | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-IV | R ⁶ -VII | G ¹ -XV | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-IV | R ⁶ -VIII | G ¹ -XV | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-IV | R ⁶ -XIV | G ¹ -XV | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-IV | R ⁶ -XV | G ¹ -XVI | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -I | G ¹ -XVI | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -II | G ¹ -XVI | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -III | G ¹ -XVI | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -IV | G ¹ -XVI | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -V | G ¹ -XVI | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -VI | G ¹ -XVI | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -VII | G ¹ -XVI | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVI | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -IX | G ¹ -XVI | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -X | G ¹ -XVI | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -XI | G ¹ -XVI | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -XII | G ¹ -XVI | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -XIII | G ¹ -XVI | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -XIV | G ¹ -XVI | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-V | R ⁶ -XV | G ¹ -XVI | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-VI | R ⁶ -VII | G ¹ -XVI | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-VI | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVI | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-VI | R ⁶ -XIV | G ¹ -XVII | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-VI | R ⁶ -XV | G ¹ -XVII | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-VII | R ⁶ -VII | G ¹ -XVII | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-VII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVII | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-VII | R ⁶ -XIV | G ¹ -XVII | R-III | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-VII | R ⁶ -XV | G ¹ -XVII | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-VIII | R ⁶ -VII | G ¹ -XVII | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-VIII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVII | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-IX | R ⁶ -VII | G ¹ -XVII | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -V | R-IX | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVII | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -V | R-X | R ⁶ -VII | G ¹ -XVII | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -V | R-X | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVII | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -V | R-XI | R ⁶ -VII | G ¹ -XVII | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-XI | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVII | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-XII | R ⁶ -VII | G ¹ -XVII | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-XII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVII | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-XIII | R ⁶ -VII | G ¹ -XVII | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-XIII | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVII | R-VII | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-XIV | R ⁶ -I | G ¹ -XVIII | R-I | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-XIV | R ⁶ -II | G ¹ -XVIII | R-I | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-XIV | R ⁶ -IV | G ¹ -XVIII | R-II | R ⁶ -VII |
| G ¹ -V | R-XIV | R ⁶ -VI | G ¹ -XVIII | R-II | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -V | R-XIV | R ⁶ -VII | G ¹ -XVIII | R-III | R ⁶ -VII |

[0144] [表1-7]

| | | | | | |
|--------------------|-------|----------------------|-----------------------|-------|----------------------|
| G ¹ -V | R-XIV | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVIII | R-III | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-I | R ⁶ -VII | G ¹ -XVIII | R-IV | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-I | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVIII | R-IV | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-II | R ⁶ -VII | G ¹ -XVIII | R-V | R ⁶ -I |
| G ¹ -VI | R-II | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVIII | R-V | R ⁶ -II |
| G ¹ -VI | R-III | R ⁶ -VII | G ¹ -XVIII | R-V | R ⁶ -IV |
| G ¹ -VI | R-III | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVIII | R-V | R ⁶ -VI |
| G ¹ -VI | R-IV | R ⁶ -VII | G ¹ -XVIII | R-V | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-IV | R ⁶ -VIII | G ¹ -XVIII | R-V | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -I | G ¹ -XVIII | R-V | R ⁶ -X |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -II | G ¹ -XVIII | R-VI | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -III | G ¹ -XVIII | R-VI | R ⁶ -VIII |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -IV | G ¹ -XVIII | R-VII | R ⁶ -VII |
| G ¹ -VI | R-V | R ⁶ -V | G ¹ -XVIII | R-VII | R ⁶ -VIII |

[0145] 式 (I) で表される化合物のうちで、酸付加塩としては、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸等のハロゲン化水素酸の塩、硝酸、硫酸、リン酸、塩素酸、過塩素酸等の無機酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸の塩、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、酒石酸、蔞酸、マレイン酸、リンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸等のカルボン酸の塩又はグルタミン酸、アスパラギン酸等のアミノ酸の塩等が挙げられる。

[0146] 式 (I) で表される化合物のうちで、金属塩としては、例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムといったアルカリ金属の塩、カルシウム、バリウム、マグネシウムといったアルカリ土類金属の塩又はアルミニウムの塩等が挙げられる。

本明細書における「有害生物防除剤」とは、植物又は動物に感染・寄生する有害な病原菌及び寄生虫を防除対象とした殺菌剤及び寄生虫防除剤を意味し、より具体的には、農園芸分野における殺菌剤及び殺線虫剤、或いは動物の抗真菌剤及び寄生虫防除剤を意味する。

[0147] 本明細書における「病原菌」とは、植物の病害及び動物の感染症の病原と

なる微生物を意味し、具体的に例えば、以下の微生物が挙げられるが、微生物の具体例はこれらのみ限定されるものではない。

- [0148] *Taphrina* spp. (*Taphrina deformans*, *T. pruni*等)、*Pneumocystis* spp.、*Geotrichum* spp.、*Candida* spp. (*Candida albicans*, *C. sorbosa*等)、*Pichia* spp. (例えば*Pichia kluyveri*等)、*Capnodium* spp.、*Fumago* spp.、*Hypocapnodium* spp.、*Cercospora* spp. (*Cercospora apii*, *C. asparagi*, *C. beticola*, *C. capsici*, *C. carotae*, *C. kaki*, *C. kikuchii*, *C. zonata*等)、*Cercosporidium* spp.、*Cladosporium* spp. (*Cladosporium colocasiae*, *C. cucumerinum*, *C. variabile*等)、*Davidiella* spp.、*Didymosporium* spp.、*Heterosporium* spp. (*Heterosporium allii*等)、*Mycosphaerella* spp. (*Mycosphaerella arachidis*, *M. berkeleyi*, *M. cerasella*, *M. fijiensis*, *M. fragariae*, *M. graminicola*, *M. nawae*, *M. pinodes*, *M. pomi*, *M. zingiberis*等)、*Mycovellosiella* spp. (*Mycovellosiella fulva*, *M. natrassii*等)、*Paracercospora* spp. (*Paracercospora egenula*等)、*Phaeoisariopsis* spp.、*Phaeoramularia* spp.、*Pseudocercospora* spp. (*Pseudocercospora abelmoschi*, *P. fuligena*, *P. vitis*等)、*Pseudocercospora* spp. (*Pseudocercospora capsellae*等)、*Ramichloridium* spp.、*Ramularia* spp.、*Septogloeum* spp.、*Septoria* spp. (*Septoria albopunctata*, *S. apiicola*, *S. chrysanthemella*, *S. helianthi*, *S. obesa*等)、*Sphaerulina* spp.、*Aureobasidium* spp.、*Kabatiella* spp.、*Plowrightia* spp.、*Stigmina* spp.、*Elsinoe* spp. (*Elsinoe ampelina*, *E. araliae*, *E. fawcettii*等)、*Sphaceloma* spp. (*Sphaceloma caricae*等)、*Ascochyta* spp. (*Ascochyta pisi*等)、*Corynespora* spp. (*Corynespora cassiicola*等)、*Leptosphaeria* spp. (*Leptosphaeria coniothyrium*, *L. maculans*等)、*Saccharicola* spp.、*Phaeosphaeria* spp.、*Ophiosphaerella* spp.、*Setophoma* spp.、*Helminthosporium* spp.、*Alternaria* spp. (*Alternaria alternata*, *A. brassicae*, *A. brassicicola*, *A. citri*, *A. dauci*, *A. helianthi*, *A. japonica*, *A. kikuchiana*, *A. mali*, *A. panax*, *A. porri*, *A. radicina*, *A. solani*等)、*Bipolaris* spp. (*Bipolaris* spp.)

olaris sorghicola等)、Cochliobolus spp. (Cochliobolus heterostrophus、C. lunatus、C. miyabeanus等)、Curvularia spp. (Curvularia geniculata、C. verruculosa等)、Drechslera spp.、Pleospora spp. (Pleospora herbarum等)、Pyrenophora spp. (Pyrenophora graminea、P. teres等)、Setosphaeria spp. (Setosphaeria turcica等)、Stemphylium spp. (Stemphylium botryosum、S. lycopersici、S. solani、S. vesicarium等)、Fusicladium spp.、Venturia spp. (Venturia carpophila、V. Inaequalis、V. nashicola、V. pirina等)、Didymella spp. (Didymella bryoniae、D. fabae等)、Hendersonia spp.、Phoma spp. (Phoma erratica var. mikan、P. exigua var. exigua、P. wasabiae等)、Pyrenochaeta spp. (Pyrenochaeta lycopersici等)、Stagonospora spp. (Stagonospora sacchari等)、Botryosphaeria spp. (Botryosphaeria berengeriana f. sp. piricola、B. dothidea等)、Dothiorella spp.、Fusicoccum spp.、Guignardia spp.、Lasiodiplodia spp. (Lasiodiplodia theobromae等)、Macrophoma spp.、Macrophomina spp.、Neofusicoccum spp.、Phyllosticta spp. (Phyllosticta zingiberis等)、Schizothyrium spp. (Schizothyrium pomi等)、Acrospermum spp.、Leptosphaerulina spp.、Aspergillus spp.、Penicillium spp. (Penicillium digitatum、P. italicum、P. sclerotigenum等)、Microsporum spp.、Trichophyton spp. (Trichophyton mentagrophytes、T. rubrum等)、Histoplasma spp.、Blumeria spp. (Blumeria graminis f. sp. hordei、B. g. f. sp. tritici等)、Erysiphe spp. (Erysiphe betae、E. cichoracearum、E. c. var. cichoracearum、E. heraclei、E. pisi等)、Golovinomyces spp. (Golovinomyces cichoracearum var. latisporus等)、Leveillula spp. (Leveillula taurica等)、Microsphaera spp.、Oidium spp. (Oidium neolycopersici等)、Phyllactinia spp. (Phyllactinia kakicola、P. mali、P. moricola等)、Podosphaera spp. (Podosphaera fusca、P. leucotricha、P. pannosa、P. tridactyla var. tridactyla、P. xanthii等)、Sphaerotheca spp. (Sphaerotheca aphanis var. aphanis、S. fuliginea等)、Uncinula spp. (Unci

nula necator、U. n. var. necator等)、Uncinuliella spp. (Uncinuliella simulans var. simulans、U. s. var. tandae等)、Blumeriella spp. (Blumeriella jaapii等)、Cylindrosporium spp.、Diplocarpon spp. (Diplocarpon mali、D. mespili、D. rosae等)、Gloeosporium spp. (Gloeosporium minus等)、Marssonina spp.、Tapesia spp. (Tapesia acuformis、T. yallundae等)、Lachnum spp.、Scleromitruia spp.、Botryotinia spp. (Botryotinia fuckeliana等)、Botrytis spp. (Botrytis allii、B. byssoidea、B. cinerea、B. elliptica、B. fabae、B. squamosa等)、Ciborinia spp.、Grovesinia spp.、Monilia mumeicola、Monilinia spp. (Monilinia fructicola、M. fructigena、M. laxa、M. mali、M. vaccinii-corymbosi等)、Sclerotinia spp. (Sclerotinia borealis、S. homoeocarpa、S. minor、S. sclerotiorum等)、Valdensia spp. (Valdensia heterodoxa等)、Claviceps spp. (Claviceps sorghi、C. sorghicola等)、Epichloe spp.、Ephelis japonica、Villosiclava virens、Hypomyces spp. (Hypomyces solani f. sp. mori、H. s. f. sp. pisi等)、Trichoderma spp. (Trichoderma viride等)、Calonectria spp. (Calonectria ilicicola等)、Candelospora spp.、Cylindrocarp on spp.、Cylindrocladium spp.、Fusarium spp. (Fusarium arthrosporioides、F. crookwellense、F. culmorum、F. cuneirostrum、F. oxysporum、F. o. f. sp. adzukicola、F. o. f. sp. allii、F. o. f. sp. asparagi、F. o. f. sp. batatas、F. o. f. sp. cepae、F. o. f. sp. colocasiae、F. o. f. sp. conglutinans、F. o. f. sp. cubense、F. o. f. sp. cucumerinum、F. o. f. sp. fabae、F. o. f. sp. fragariae、F. o. f. sp. lactucae、F. o. f. sp. lagenariae、F. o. f. sp. lycopersici、F. o. f. sp. melongenae、F. o. f. sp. melonis、F. o. f. sp. nelumbinicola、F. o. f. sp. niveum、F. o. f. sp. radicis-lycopersici、F. o. f. sp. raphani、F. o. f. sp. spinaciae、F. sporotrichioides、F. solani、F. s. f. sp. cucurbitae、F. s. f. sp. eumartii、F. s. f. sp. pisi、F. s. f. sp. radicola等)、Gibberella spp. (Gibberella avenacea、G. baccata、G. fujiku

roi、*G. zeae*等)、*Haematonectria* spp.、*Nectria* spp.、*Ophionectria* spp.、*Caldariomyces* spp.、*Myrothecium* spp.、*Trichothecium* spp.、*Verticillium* spp. (*Verticillium albo-atrum*、*V. dahliae*、*V. longisporum*等)、*Ceratocystis* spp. (*Ceratocystis ficicola*、*C. fimbriata*等)、*Thielaviopsis* spp. (*Thielaviopsis basicola*等)、*Adisciso* spp.、*Monochaetia* spp.、*Pestalotia* spp. (*Pestalotia eriobotrifolia*等)、*Pestalotiopsis* spp. (*Pestalotiopsis funerea*、*P. longiseta*、*P. neglecta*、*P. theae*等)、*Phyalospora* spp.、*Nemania* spp.、*Nodulisporium* spp.、*Rosellinia* spp. (*Rosellinia necatrix*等)、*Monographella* spp. (*Monographella nivalis*等)、*Ophiostoma* spp.、*Cryphonectria* spp. (*Cryphonectria parasitica*等)、*Diaporthe* spp. (*Diaporthe citri*、*D. kyushuensis*、*D. nomurai*、*D. tanakae*等)、*Diaporthopsis* spp.、*Phomopsis* spp. (*Phomopsis asparagi*、*P. fukushii*、*P. obscurans*、*P. vexans*等)、*Cryptosporella* spp.、*Discula* spp. (*Discula theae-sinensis*等)、*Gnomonia* spp.、*Coniella* spp.、*Coryneum* spp.、*Greeneria* spp.、*Melanconis* spp.、*Cytospora* spp.、*Leucostoma* spp.、*Valsa* spp. (*Valsa ceratosperma*等)、*Tubakia* spp.、*Monosporascus* spp.、*Clasterosporium* spp.、*Gaeumannomyces* spp. (*Gaeumannomyces graminis*等)、*Magnaporthe* spp. (*Magnaporthe grisea*等)、*Pyricularia* spp. (*Pyricularia zingiberis*等)、*Monilochaetes infuscans*、*Colletotrichum* spp. (*Colletotrichum acutatum*、*C. capsici*、*C. cereale*、*C. destructivum*、*C. fragariae*、*C. lindemuthianum*、*C. nigrum*、*C. orbiculare*、*C. spiniaciae*等)、*Glomerella* spp. (*Glomerella cingulata*等)、*Khuskia oryzae*、*Phyllachora* spp. (*Phyllachora pomigena*等)、*Ellisemia* spp.、*Briosia* spp.、*Cephalosporium* spp. (*Cephalosporium gramineum*等)、*Epicoccum* spp.、*Gloeocercospora sorghi*、*Mycocentrospora* spp.、*Peltaster* spp. (*Peltaster fructicola*等)、*Phaeocystostroma* spp.、*Phialophora* spp. (*Phialophora gregata*等)、*Pseudophloeospora dioscoreae*、*Pseudoseptoria* spp.、*Rhynchosporium* spp. (*Rhynchosporium secalis*等)、*Sarocladium* spp.

、*Coleophoma* spp.、*Helicoceras oryzae*等の子囊菌門 (Ascomycota) 菌類。

[0149] *Septobasidium* spp. (*Septobasidium bogoriense*、*S. tanakae*等)、*Helicobasidium* spp. (*Helicobasidium longisporum*等)、*Coleosporium* spp. (*Coleosporium plectranthi*等)、*Cronartium* spp.、*Phakopsora* spp. (*Phakopsora artemisiae*、*P. nishidana*、*P. pachyrhizi*等)、*Physopella* spp. (*Physopella ampelopsidis*等)、*Kuehneola* spp. (*Kuehneola japonica*等)、*Phragmidium* spp. (*Phragmidium fusiforme*、*P. mucronatum*、*P. rosae-multiflorae*等)、*Gymnosporangium* spp. (*Gymnosporangium asiaticum*、*G. yamadae*等)、*Puccinia* spp. (*Puccinia allii*、*P. brachypodii* var. *poae-nemoralis*、*P. coronata*、*P. c.* var. *coronata*、*P. cynodontis*、*P. graminis*、*P. g.* subsp. *graminicola*、*P. hordei*、*P. horiana*、*P. kuehnii*、*P. melanocephala*、*P. recondita*、*P. striiformis* var. *striiformis*、*P. tanacetii* var. *tanacetii*、*P. tokyensis*、*P. zoysiae*等)、*Uromyces* spp. (*Uromyces phaseoli* var. *azukicola*、*U. p.* var. *phaseoli*、*Uromyces viciae-fabae* var. *viciae-fabae*等)、*Naohidemyces vaccinii*、*Nyssopsora* spp.、*Leucotelium* spp.、*Tranzschelia* spp. (*Tranzschelia discolor*等)、*Aecidium* spp.、*Blastospora* spp. (*Blastospora smilacis*等)、*Uredo* spp.、*Sphacelotheca* spp.、*Urocystis* spp.、*Sporisorium* spp. (*Sporisorium scitamineum*等)、*Ustilago* spp. (*Ustilago maydis*、*U. nuda*等)、*Entyloma* spp.、*Exobasidium* spp. (*Exobasidium reticulatum*、*E. vexans*等)、*Microstroma* spp.、*Tilletia* spp. (*Tilletia caries*、*T. controversa*、*T. laevis*等)、*Itersonia* spp. (*Itersonia perplexans*等)、*Cryptococcus* spp.、*Bovista* spp. (*Bovista dermoxantha*等)、*Lycoperdon* spp. (*Lycoperdon curtisii*、*L. perlatum*等)、*Conocybe* spp. (*Conocybe apala*等)、*Marasmius* spp. (*Marasmius oreades*等)、*Armillaria* spp.、*Helotium* spp.、*Lepista* spp. (*Lepista subnuda*等)、*Sclerotium* spp. (*Sclerotium cepivorum*等)、*Typhula* spp. (*Typhula incarnata*、*T. ishikariensis* var. *ishikariensis*等)、*Athelia* spp. (*Athelia rolfsii*等)、*Ceratobasidium* spp. (*Ceratobasidium c*

ornigerum等)、*Ceratorhiza* spp.、*Rhizoctonia* spp. (*Rhizoctonia solani* 等)、*Thanatephorus* spp. (*Thanatephorus cucumeris*等)、*Laetisaria* spp.、*Waitea* spp.、*Fomitiporia* spp.、*Ganoderma* spp.、*Chondrostereum purpureum*、*Phanerochaete* spp.等の担子菌門 (Basidiomycota) 菌類。

[0150] *Olpidium* spp.等のツボカビ門 (Chitridiomycota) 菌類。

Physoderma spp.等のコウマクノウキン門 (Blastocladiomycota) 菌類。

Choanephora spp.、*Choanephoroidea cucurbitae*、*Mucor* spp. (*Mucor fragilis*等)、*Rhizopus* spp. (*Rhizopus arrhizus*、*R. chinensis*、*R. oryzae*、*R. stolonifer* var. *stolonifer*等) 等のケカビ亜門 (Mucoromycotina) 菌類。

Plasmodiophora spp. (*Plasmodiophora brassicae*等)、*Spongospora subterranea* f. sp. *subterranea*等のケルコゾア門 (Cercozoa) 原生生物。

Aphanomyces spp. (*Aphanomyces cochlioides*、*A. raphani*等)、*Albugo* spp. (*Albugo macrospora*、*A. wasabiae*等)、*Bremia* spp. (*Bremia lactucae*等)、*Hyaloperonospora* spp.、*Peronosclerospora* spp.、*Peronospora* spp.

(*Peronospora alliariae-wasabi*、*P. chrysanthemi-coronarii*、*P. destructor*、*P. farinosa* f. sp. *spinaciae*、*P. manshurica*、*P. parasitica*、*P. sparsa*等)、*Plasmopara* spp. (*Plasmopara halstedii*、*P. nivea*、*P. viticola*等)、*Pseudoperonospora* spp. (*Pseudoperonospora cubensis*等)、*Sclerophthora* spp.、*Phytophthora* spp. (*Phytophthora cactorum*、*P. capsici*、*P. citricola*、*P. citrophthora*、*P. cryptogea*、*P. fragariae*、*P. infestans*、*P. melonis*、*P. nicotianae*、*P. palmivora*、*P. porri*、*P. sojae*、*P. syringae*、*P. vignae* f. sp. *adzukicola*等)、*Pythium* spp. (*Pythium afertile*、*P. aphanidermatum*、*P. aploveroticum*、*P. aristosporum*、*P. arrhenomanes*、*P. buismaniae*、*P. debaryanum*、*P. graminicola*、*P. horinouchiense*、*P. irregulare*、*P. iwayamai*、*P. myriotylum*、*P. okanoganense*、*P. paddicum*、*P. paroecandrum*、*P. periplocum*、*P. spinosum*、*P. sulcatum*、*P. sylvaticum*、*P. ultimum* var. *ultimum*、*P. vanterpoolii*、*P. vexans*、*P. vol*

utum等)等の不等毛植物門 (Heterokontophyta) 卵菌類 (Oomycetes)。

Clavibacter spp. (*Clavibacter michiganensis* subsp. *michiganensis*等)、*Curtobacterium* spp.、*Leifsonia* spp. (*Leifsonia xyli* subsp. *xyli*等)、*Streptomyces* spp. (*Streptomyces ipomoeae*等)等の放線菌門 (Actinobacteria) グラム陽性菌類。

[0151] *Clostridium* sp.等のフィルミクテス門 (Firmicutes) グラム陽性菌類。

*Phytoplasma*等のテネリクテス門 (Tenericutes) グラム陽性菌類。

Rhizobium spp. (*Rhizobium radiobacter*等)、*Acetobacter* spp.、*Burkholderia* spp. (*Burkholderia andropogonis*、*B. cepacia*、*B. gladioli*、*B. glumae*、*B. plantarii*等)、*Acidovorax* spp. (*Acidovorax avenae* subsp. *avenae*、*A. a.* subsp. *citrulli*、*A. konjaci*等)、*Herbaspirillum* spp.、*Ralstonia* spp. (*Ralstonia solanacearum*等)、*Xanthomonas* spp. (*Xanthomonas albilineans*、*X. arboricola* pv. *pruni*、*X. axonopodis* pv. *vitians*、*X. campestris* pv. *campestris*、*X. c.* pv. *cucurbitae*、*X. c.* pv. *glycines*、*X. c.* pv. *mangiferaeindicae*、*X. c.* pv. *nigromaculans*、*X. c.* pv. *vesicatoria*、*X. citri* subsp. *citri*、*X. oryzae* pv. *oryzae*等)、*Pseudomonas* spp. (*Pseudomonas cichorii*、*P. fluorescens*、*P. marginalis*、*P. m.* pv. *marginalis*、*P. savastanoi* pv. *glycinea*、*P. syringae*、*P. s.* pv. *actinidiae*、*P. s.* pv. *eriobotryae*、*P. s.* pv. *helianthi*、*P. s.* pv. *lachrymans*、*P. s.* pv. *maculicola*、*P. s.* pv. *mori*、*P. s.* pv. *morsprunorum*、*P. s.* pv. *spinaciae*、*P. s.* pv. *syringae*、*P. s.* pv. *theae*、*P. viridiflava*等)、*Rhizobacter* spp.、*Brenneria* spp. (*Brenneria nigrifluens*等)、*Dickeya* spp. (*Dickeya dianthicola*、*D. zeae*等)、*Erwinia* spp. (*Erwinia amylovora*、*E. rhapontici*等)、*Pantoea* spp.、*Pectobacterium* spp. (*Pectobacterium atrosepticum*、*P. carotovorum*、*P. wasabiae*等)等のプロテオバクテリア門 (Proteobacteria) グラム陰性菌類。

[0152] これら病原菌の感染・増殖によって引き起こされる植物病害、動物感染症の具体例としては、以下の植物病害、動物感染症が挙げられるが、これらの

みに限定されるものではない。

[0153] 植物病害：

モモ縮葉病Leaf curl (*Taphrina deformans*)、スモモふくろ実病Plum pockets (*Taphrina pruni*)、アスパラガス褐斑病Leaf spot (*Cercospora asparagi*)、テンサイ褐斑病Cercospora leaf spot (*Cercospora beticola*)、ピーマン斑点病Frogeye leaf spot (*Cercospora capsici*)、カキ角斑落葉病Angular leaf spot (*Cercospora kaki*)、ダイズ紫斑病Purple stain (*Cercospora kikuchii*)、ラッカセイ褐斑病Brown Leaf spot (*Mycosphaerella arachidis*)、オウトウ褐色せん孔病Cylindrosporium leaf spot (*Mycosphaerella cerasella*、*Blumeriella jaapii*)、コムギ葉枯病Speckled leaf blotch (*Mycosphaerella graminicola*)、カキ円星落葉病Circular leaf spot (*Mycosphaerella nawae*)、エンドウ褐紋病Mycosphaerella blight (*Mycosphaerella pinodes*)、ミヨウガ葉枯病Leaf spot (*Mycosphaerella zingiberis*)、トマト葉かび病Leaf mold (*Mycovellosiella fulva*)、ナスすすかび病Leaf mold (*Mycovellosiella natrassii*)、トマトすすかび病Cercospora leaf mold (*Pseudocercospora fuligena*)、ブドウ褐斑病Isariopsis leaf spot (*Pseudocercospora vitis*)、ハクサイ白斑病Leaf spot (*Pseudocercospora capsellae*)、キク黒斑病Leaf spot (*Septoria chrysanthemella*)、キク褐斑病Leaf blight (*Septoria obesa*)、ブドウ黒とう病Anthracnose (*Elsinoe ampelina*)、タラノキそうか病Spot anthracnose (*Elsinoe araliae*)、カンキツそうか病Scab (*Elsinoe fawcettii*)、エンドウ褐斑病Leaf spot (*Ascochyta pisi*)、キュウリ褐斑病Corynespora leaf spot (*Corynespora cassicola*)、バラ枝枯病Stem canker (*Leptosphaeria coniothyrium*)、バラ黒斑病Leaf spot (*Alternaria alternata*)、ニンジン黒葉枯病Leaf blight (*Alternaria dauci*)、ナシ黒斑病Black spot (*Alternaria kikuchiana*)、リンゴ斑点落葉病Alternaria blotch (*Alternaria mali*)、ネギ黒斑病Alternaria leaf spot (*Alternaria porri*)、ソルガム紫斑点病Target spot (*Bipolaris sorghicola*)、トウモロコシごま葉枯病Southern leaf blight (*Cochliob*

olus heterostrophus)、イネごま葉枯病Brown spot (*Cochliobolus miyabeanus*)、ニンニク葉枯病Tip blight (*Pleospora herbarum*)、オオムギ斑葉病Stripe (*Pyrenophora graminea*)、オオムギ網斑病Net blotch (*Pyrenophora teres*)、ソルガムすす紋病Leaf blight (*Setosphaeria turcica*)、トウモロコシすす紋病Northern leaf blight (*Setosphaeria turcica*)、アスパラガス斑点病Leaf spot (*Stemphylium botryosum*)、バラ科サクラ亜科の黒星病Scab (*Venturia carpophila*)、リンゴ黒星病Scab (*Venturia Inaequalis*)、ナシ黒星病Scab (*Venturia nashicola*)、ウリ科のつる枯病Gummy stem blight (*Didymella bryoniae*)、ゴボウ黒斑病Leaf spot (*Phoma exigua* var. *exigua*)、ワサビ墨入病Streak (*Phoma wasabiae*)、バラ科ナシ亜科の輪紋病Ring rot (*Botryosphaeria berengeriana* f. sp. *piricola*)、キウイフルーツ果実軟腐病Soft rot (*Botryosphaeria dothidea*, *Lasiodiplodia theobromae*, *Diaporthe* sp.)、カンキツ緑かび病Common green mold (*Penicillium digitatum*)、カンキツ青かび病Blue mold (*Penicillium italicum*)、オオムギうどんこ病Powdery mildew (*Blumeria graminis* f. sp. *hordei*)、コムギうどんこ病Powdery mildew (*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*)、キュウリうどんこ病Powdery mildew (*Erysiphe betae*, *Leveillula taurica*, *Oidium* sp., *Podosphaera xanthii*)、ナスうどんこ病Powdery mildew (*Erysiphe cichoracearum*, *Leveillula taurica*, *Sphaerotheca fuliginea*)、ニンジン、パセリのうどんこ病Powdery mildew (*Erysiphe heraclei*)、エンドウうどんこ病Powdery mildew (*Erysiphe pisi*)、トマトうどんこ病Powdery mildew (*Leveillula taurica*, *Oidium neolycopersici*, *Oidium* sp.)、ピーマンうどんこ病Powdery mildew (*Leveillula taurica*)、カボチャうどんこ病Powdery mildew (*Oidium* sp., *Podosphaera xanthii*)、ニガウリうどんこ病Powdery mildew (*Oidium* sp.)、カキうどんこ病Powdery mildew (*Phyllactinia kakicola*)、ゴボウうどんこ病Powdery mildew (*Podosphaera fusca*)、リンゴうどんこ病Powdery mildew (*Podosphaera leucotricha*)、バラうどんこ病Powdery mildew (*Podosphaera pannosa*, *Uncinuliella simulans* var. *s*

imulans, U. s. var. tandae)、ズッキーニ、マクワウリのうどんこ病Powdery mildew (*Podosphaera xanthii*)、イチゴうどんこ病Powdery mildew (*Sphaerotheca aphanis* var. *aphanis*)、スイカ、メロンのうどんこ病Powdery mildew (*Sphaerotheca fuliginea*)、ブドウうどんこ病Powdery mildew (*Uncinula necator*, U. n. var. *necator*)、リンゴ褐斑病Blotch (*Diplocarpon mali*)、バラ黒星病Black spot (*Diplocarpon rosae*)、タマネギ灰色腐敗病Gray mold neck rot (*Botrytis allii*)、灰色かび病Gray mold、*Botrytis blight* (*Botrytis cinerea*)、ニラ白斑葉枯病Leaf blight (*Botrytis cinerea*, *B. byssoidea*, *B. squamosa*)、ソラマメ赤色斑点病Chocolate spot (*Botrytis cinerea*, *B. elliptica*, *B. fabae*)、バラ科の灰星病Brown rot (*Monilinia fructicola*, *M. fructigena*, *M. laxa*)、リンゴモニリア病Blossom blight (*Monilinia mali*)、シバダラースポット病Dollar spot (*Sclerotinia homoeocarpa*)、菌核病Cottony rot、*Sclerotinia rot*、Stem rot (*Sclerotinia sclerotiorum*)、稲こうじ病False smut (*Villosiclava virens*)、ダイズ黒根腐病Root necrosis (*Calonectria ilicicola*)、コムギ赤かび病Fusarium blight (*Fusarium crookwellense*, *F. culmorum*, *Gibberella avenacea*, *G. zaeae*, *Monographella nivalis*)、オオムギ赤かび病Fusarium blight (*Fusarium culmorum*, *Gibberella avenacea*, *G. zaeae*)、コンニャク乾腐病Dry rot (*Fusarium oxysporum*, *F. solani* f. sp. *radicicola*)、ヤマノイモ褐色腐敗病Brown rot (*Fusarium oxysporum*, *F. solani* f. sp. *pisi*, *F. s. f. sp. radicicola*)、アズキ萎凋病Fusarium wilt (*Fusarium oxysporum* f. sp. *adzukicola*)、ラッキョウ乾腐病Fusarium basal rot (*Fusarium oxysporum* f. sp. *allii*, *F. solani* f. sp. *radicicola*)、サツマイモつる割病Stem rot (*Fusarium oxysporum* f. sp. *batatas*, *F. solani*)、サトイモ乾腐病Dry rot (*Fusarium oxysporum* f. sp. *colocasiae*)、キャベツ、コマツナの萎黄病Yellows (*Fusarium oxysporum* f. sp. *conglutinans*)、バナナパナマ病Panama disease (*Fusarium oxysporum* f. sp. *cubense*)、イチゴ萎黄病Fusarium wilt (*Fusarium oxysporum* f. sp. *fragariae*)、レタス根腐

病Root rot (*Fusarium oxysporum* f. sp. *lactucae*)、スイカつる割病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *lagenariae*, *F. o.* f. sp. *niveum*)、トマト萎凋病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *lycopersici*)、メロンつる割病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *melonis*)、ダイコン萎黄病Yellows (*Fusarium oxysporum* f. sp. *raphani*)、ホウレンソウ萎凋病*Fusarium wilt* (*Fusarium oxysporum* f. sp. *spinaciae*)、イネばか苗病 “Bakanae” disease (*Gibberella fujikuroi*)、ダイコンバーティシリウム黒点病*Verticillium black spot* (*Verticillium albo-atrum*, *V. dahliae*)、トマト、ナス、フキの半身萎凋病*Verticillium wilt* (*Verticillium dahliae*)、イチジク株枯病*Ceratocystis canker* (*Ceratocystis ficicola*)、サツマイモ黒斑病Black rot (*Ceratocystis fimbriata*)、チャ輪斑病*Gray blight* (*Pestalotiopsis longiseta*, *P. theae*)、クリ胴枯病*Endothia canker* (*Cryphonectria parasitica*)、カンキツ黒点病Melanose (*Diaporthe citri*)、アスパラガス茎枯病Stem blight (*Phomopsis asparagi*)、ナシ胴枯病*Phomopsis canker* (*Phomopsis fukushii*)、ナス褐紋病Brown spot (*Phomopsis vexans*)、チャ炭疽病Anthraxnose (*Discula theae-sinensis*)、リンゴ腐らん病*Valsa canker* (*Valsa ceratosperma*)、イネいもち病Blast (*Magnaporthe grisea*)、イチゴ炭疽病Crown rot (*Colletotrichum acutatum*, *C. fragariae*, *Glomerella cingulata*)、リンゴ炭疽病Bitter rot (*Colletotrichum acutatum*, *Glomerella cingulata*)、オウトウ炭疽病Anthraxnose (*Colletotrichum acutatum*, *Glomerella cingulata*)、スモモ炭疽病Anthraxnose (*Colletotrichum acutatum*)、ブドウ晩腐病Ripe rot (*Colletotrichum acutatum*, *Glomerella cingulata*)、シュンギク炭疽病Anthraxnose (*Colletotrichum acutatum*)、インゲンマメ炭疽病Anthraxnose (*Colletotrichum lindemuthianum*)、ウリ科の炭疽病Anthraxnose (*Colletotrichum orbiculare*)、ヤマノイモ炭疽病Anthraxnose (*Glomerella cingulata*)、クリ炭疽病Anthraxnose (*Glomerella cingulata*)、カキ炭疽病Anthraxnose (*Glomerella cingulata*)、アズキ落葉病Brown stem rot (*Phialophora gregata*)、ナガイ

モ葉渋病Leaf spot (*Pseudophloeospora dioscoreae*)、オオムギ雲形病Scald (*Rhynchosporium secalis*)。

[0154] イチジクさび病Rust (*Phakopsora nishidana*)、ダイズさび病Rust (*Phakopsora pachyrhizi*)、バラさび病Rust (*Kuehneola japonica*, *Phragmidium fusiforme*, *P. mucronatum*, *P. rosae-multiflorae*)、ナシ赤星病Rust (*Gymnosporangium asiaticum*)、リンゴ赤星病Rust (*Gymnosporangium yamadae*)、ネギ科のさび病Rust (*Puccinia allii*)、キク白さび病Rust (*Puccinia horiana*)、コムギ赤さび病Brown rust (*Puccinia recondita*)、キク黒さび病Rust (*Puccinia tanacetii* var. *tanacetii*)、ソラマメさび病Rust (*Uromyces viciae-fabae* var. *viciae-fabae*)、サトウキビ黒穂病Smut (*Sporisorium scitamineum*)、トウモロコシ黒穂病Smut (*Ustilago maydis*)、オオムギ裸黒穂病Loose smut (*Ustilago nuda*)、チャ網もち病Net blister blight (*Exobasidium reticulatum*)、チャもち病Blister blight (*Exobasidium vexans*)、白絹病Stem rot、Southern blight (*Athelia rolfsii*)、キク立枯病Root and stem rot (*Ceratobasidium cornigerum*, *Rhizoctonia solani*)、ショウガ紋枯病 (*Rhizoctonia solani*)、キャベツ苗立枯病Damping-off (*Rhizoctonia solani*)、ミツバ立枯病Damping-off (*Rhizoctonia solani*)、レタすそ枯病Bottom rot (*Rhizoctonia solani*)、シバ葉腐病Brown patch、Large patch (*Rhizoctonia solani*)、イネ紋枯病Sheath blight (*Thanatephorus cucumeris*)、テンサイ根腐病Root rot・葉腐病Leaf blight (*Thanatephorus cucumeris*)。

[0155] イチジク黒かび病Rhizopus rot (*Rhizopus stolonifer* var. *stolonifer*)、
アブラナ科根こぶ病Clubroot (*Plasmodiophora brassicae*)、
テンサイ黒根病Aphanomyces root rot (*Aphanomyces cochlioides*)、アブラナ科の白さび病White rust (*Albugo macrospora*)、レタすべと病Downy mildew (*Bremia lactucae*)、シュンギクべと病Downy mildew (*Peronospora chrysanthemi-coronarii*)、タマネギ、ネギのべと病Downy mildew (*Peronospora*

ra destructor)、ホウレンソウべと病Downy mildew (*Peronospora farinosa* f. sp. *spinaciae*)、ダイズべと病Downy mildew (*Peronospora manshurica*)、アブラナ科のべと病Downy mildew (*Peronospora parasitica*)、バラべと病Downy mildew (*Peronospora sparsa*)、ヒマワリべと病Downy mildew (*Plasmopara halstedii*)、ミツバべと病Downy mildew (*Plasmopara nivea*)、ブドウべと病Downy mildew (*Plasmopara viticola*)、ウリ科のべと病Downy mildew (*Pseudoperonospora cubensis*)、タラノキ立枯疫病*Phytophthora rot rot* (*Phytophthora cactorum*)、スイカ褐色腐敗病Brown rot (*Phytophthora capsici*)、カボチャ疫病*Phytophthora rot* (*Phytophthora capsici*)、ピーマン疫病*Phytophthora blight* (*Phytophthora capsici*)、スイカ疫病*Phytophthora rot* (*Phytophthora cryptogea*)、トマト、ジャガイモの疫病Late blight (*Phytophthora infestans*)、イチジク疫病White powdery rot (*Phytophthora palmivora*)、ネギ科の白色疫病Leaf blight (*Phytophthora porri*)、ダイズ茎疫病*Phytophthora root and stem rot* (*Phytophthora sojae*)、アズキ茎疫病*Phytophthora stem rot* (*Phytophthora vignae* f. sp. *adzukiicola*)、ホウレンソウ立枯病Damping-off (*Pythium aphanidermatum*, *P. myriotylum*, *P. paroecandrum*, *P. ultimum* var. *ultimum*)、コンニャク根腐病Root rot (*Pythium aristosporum*)、トウモロコシ根腐病Browning root rot (*Pythium arrhenomanes*, *P. graminicola*)、キャベツ苗立枯病Damping-off (*Pythium buismaniae*, *P. myriotylum*)、ミョウガ根茎腐敗病Root rot (*Pythium myriotylum*)、シヨウガ根茎腐敗病Root rot (*Pythium myriotylum*, *P. ultimum* var. *ultimum*)、ニンジンしみ腐病Brown blotted root rot (*Pythium sulcatum*)。

[0156] トマトかいよう病Bacterial canker (*Clavibacter michiganensis* subsp. *michiganensis*)、ジャガイモそうか病Scab (*Streptomyces* spp.)、

バラ根頭がんしゅ病Crown gall (*Rhizobium radiobacter*)、ソルガム条斑細菌病Bacterial stripe (*Burkholderia andropogonis*)、タマネギ腐敗病Soft rot (*Burkholderia cepacia*, *Pseudomonas marginalis* pv. *marginalis*,

Erwinia rhapontici)、イネもみ枯細菌病Bacterial grain rot (*Burkholderia gladioli*, *B. glumae*)、スイカ果実汚斑細菌病Bacterial fruit blotch (*Acidovorax avenae* subsp. *citrulli*)、コンニャク葉枯病Bacterial leaf blight (*Acidovorax konjaci*)、青枯病Bacterial wilt (*Ralstonia solanacearum*)、モモせん孔細菌病Bacterial shot hole (*Xanthomonas arboricola* pv. *pruni*, *Pseudomonas syringae* pv. *syringae*, *Brenneria nigrifluens*)、スモモ黒斑病Bacterial leaf spot (*Xanthomonas arboricola* pv. *pruni*)、レタス斑点細菌病Bacterial spot (*Xanthomonas axonopodis* pv. *vitians*)、アブラナ科の黒腐病Black rot (*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*)、ダイズ葉焼病Bacterial pustule (*Xanthomonas campestris* pv. *glycines*)、ゴボウ黒斑細菌病Bacterial spot (*Xanthomonas campestris* pv. *nigromaculans*)、ピーマン斑点細菌病Bacterial spot (*Xanthomonas campestris* pv. *vesicatoria*)、カンキツかいよう病Citrus canker (*Xanthomonas citri* subsp. *citri*)、ニンニク春腐病 (*Pseudomonas cichorii*, *P. marginalis* pv. *marginalis*, *Erwinia* sp.)、レタス腐敗病Bacterial rot (*Pseudomonas cichorii*, *P. marginalis* pv. *marginalis*, *P. viridiflava*)、キウイフルーツ花腐細菌病Bacterial blossom blight (*Pseudomonas marginalis* pv. *marginalis*, *P. syringae* pv. *syringae*, *P. viridiflava*)、キウイフルーツかいよう病Bacterial canker (*Pseudomonas syringae* pv. *actinidiae*)、ビワがんしゅ病Canker (*Pseudomonas syringae* pv. *eriobotryae*)、ウリ科の斑点細菌病Bacterial spot (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)、アブラナ科の黒斑細菌病Bacterial black spot (*Pseudomonas syringae* pv. *maculicola*)、ウメかいよう病Bacterial canker (*Pseudomonas syringae* pv. *morsprunorum*, *Erwinia* sp.)、チャ赤焼病Bacterial shoot blight (*Pseudomonas syringae* pv. *theae*)、ネギ軟腐病Bacterial soft rot (*Dickeya* sp., *Pectobacterium carotovorum*)、バラ科ナシ亜科の火傷病Fire blight (*Erwinia amylovora*)、コンニャク腐敗病Soft rot (*Pectobacterium carotovorum*)、軟腐病Bacterial soft rot (*Pectobacterium carotovorum*)。

[0157] 動物感染症：

ニューモシスチス肺炎Pneumocystis pneumonia (Pneumocystis jirovecii)、カンジダ症Candidiasis (Candida albicans)、アスペルギルス症Aspergilliosis (Aspergillus fumigatus)、白癬菌症Trichophytosis (Microsporum canis、M. gypseum、Trichophyton mentagrophytes、T. rubrum、T. tonsurans、T. verrucosum)、ヒストプラズマ症Histoplasmosis (Histoplasma capsulatum)、クリプトコッカス症Cryptococcosis (Cryptococcus neoformans)。

[0158] 本明細書における「寄生虫」とは、植物に寄生する植物寄生性の線形動物、動物に寄生する動物寄生性の線形動物、鉤頭動物、扁形動物及び原生動物等を意味し、具体例としては、以下の寄生虫が挙げられるが、これらのみに限定されるものではない。

[0159] 腎虫Giant kidney worm (Dioctophyma renale)、有環毛細線虫Thread worms (Capillaria annulata)、捻転毛細線虫Cropworm (Capillaria contorta)、肝毛細線虫Capillary liver worm (Capillaria hepatica)、穿通毛細線虫 (Capillaria perforans)、フィリピン毛細線虫 (Capillaria philippinensis)、豚毛細線虫 (Capillaria suis)、牛鞭虫Whipworm (Trichuris discolor)、羊鞭虫Whipworm (Trichuris ovis)、豚鞭虫Pig whipworm (Trichuris suis)、ヒト鞭虫Human whipworm (Trichuris trichiura)、犬鞭虫Dog whipworm (Trichuris vulpis)、旋毛虫Pork worm (Trichinella spiralis) 等のエノプルス目 (Enoplida) 線虫。

乳頭糞線虫Intestinal threadworm (Strongyloides papillosus)、猫糞線虫 (Strongyloides planiceps)、豚糞線虫Pig threadworm (Strongyloides ransomi)、ヒト糞線虫Threadworm (Strongyloides stercoralis)、ミクロネマ属 (Micronema spp.) 等の桿線虫目 (Rhabditida) 線虫。

[0160] ブラジル鉤虫Hookworm (Ancylostoma braziliense)、犬鉤虫Dog hookworm (Ancylostoma caninum)、ズビニ鉤虫Old World hookworm (Ancylostoma duodenale)、猫鉤虫Cat hookworm (Ancylostoma tubaeforme)、狭頭鉤虫The

Northern hookworm of dogs (*Uncinaria stenocephala*)、牛鉤虫Cattle hookworm (*Bunostomum phlebotomum*)、羊鉤虫Small ruminant hookworm (*Bunostomum trigonocephalum*)、アメリカ鉤虫New World hookworm (*Necator americanus*)、シアトストームム属 (*Cyathostomum* spp.)、シリコシクラス属 (*Cylicocyclus* spp.)、シリコドントフォラス属 (*Cylicodontophorus* spp.)、シリコステファナス属 (*Cylicostephanus* spp.)、ロバ円虫 (*Strongylus asini*)、無歯円虫 (*Strongylus edentatus*)、馬円虫Blood worm (*Strongylus equinus*)、普通円虫Blood worm (*Strongylus vulgaris*)、羊縮小線虫Large-mouthed bowel worm (*Chabertia ovina*)、インド腸結節虫Nodular worm (*Oesophagostomum brevicaudatum*)、コロンビア腸結節虫Nodule worm (*Oesophagostomum columbianum*)、豚腸結節虫Nodule worm (*Oesophagostomum dentatum*)、アメリカ腸結節虫Nodular worm (*Oesophagostomum georgianum*)、腸結節虫Nodular worm (*Oesophagostomum maplestoni*)、豚盲結虫Nodular worm (*Oesophagostomum quadrispinulatum*)、牛腸結節虫Nodular worm (*Oesophagostomum radiatum*)、山羊腸結節虫Nodular worm (*Oesophagostomum venulosum*)、スクリジャピン開嘴虫 (*Syngamus skrjabinomorpha*)、鶏開嘴虫Gapeworm (*Syngamus trachea*)、豚腎虫Swine kidney worm (*Stephanurus dentatus*)、クーペリアCattle bankrupt worm (*Cooperia oncophora*)、紅色毛様線虫Red stomach worm (*Hyostromylus rubidus*)、皺胃毛様線虫Stomach hair worm (*Trichostrongylus axei*)、蛇状毛様線虫 (*Trichostrongylus colubriformis*)、東洋毛様線虫Oriental trichostrongylus (*Trichostrongylus orientalis*)、捻転胃虫Red stomach worm (*Haemonchus contortus*)、牛捻転胃虫Cattle stomach worm (*Mecistocirrus digitatus*)、オステルターグ胃虫Brown stomach worm (*Ostertagia ostertagi*)、糸状肺虫Common lungworm (*Dictyocaulus filaria*)、牛肺虫Bovine lungworm (*Dictyocaulus viviparus*)、細頸毛円虫Thin-necked intestinal worm (*Nematodirus filicollis*)、豚肺虫Swine lungworm (*Metastrongylus elongatus*)、犬肺虫Lungworm (*Filaroides hirthi*)、肺毛細線虫Lungworm (*Crenosoma aerophila*)

、キツネ肺虫Fox lungworm (*Crenosoma vulpis*)、広東住血線虫Rat lung worm (*Angiostrongylus cantonensis*)、住血線虫French heartworm (*Angiostrongylus vasorum*)、プロトストロンギラス属 (*Protostrongylus* spp.) 等の円虫目 (*Strongylida*) 線虫。

[0161] イネシンガレセンチュウRice white tip nematode (*Aphelenchoides besseyi*)、イチゴセンチュウStrawberry foliar nematode (*Aphelenchoides fragariae*)、ハガレセンチュウChrysanthemum foliar nematode (*Aphelenchoides ritzemabosi*)、マツノザイセンチュウPine wood nematode (*Bursaphelenchus xylophilus*) 等の葉線虫目 (*Aphelenchida*) 線虫。

ジャガイモシロシストセンチュウWhite potato cyst nematode (*Globodera pallida*)、ジャガイモシストセンチュウPotato cyst nematode (*Globodera rostochiensis*)、ムギシストセンチュウCereal cyst nematode (*Heterodera avenae*)、ダイズシストセンチュウSoybean cyst nematode (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウSugarbeet cyst nematode (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウClover cyst nematode (*Heterodera trifolii*)、アレナリアネコブセンチュウPeanut root-knot nematode (*Meloidogyne arenaria*)、キタネコブセンチュウNorthern root-knot nematode (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウSouthern root-knot nematode (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウJavanese root-knot nematode (*Meloidogyne javanica*)、リンゴネコブセンチュウApple root-knot nematode (*Meloidogyne mali*)、ミナミネグサレセンチュウCoffee root-lesion nematode (*Pratylenchus coffeae*)、ノコギリネグサレセンチュウ (*Pratylenchus drenatus*)、チャネグサレセンチュウTea root-lesion nematode (*Pratylenchus loosi*)、ムギネグサレセンチュウCalifornia root-lesion nematode (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウCobb's root-lesion nematode (*Pratylenchus penetrans*)、クルミネグサレセンチュウWalnut root-lesion nematode (*Pratylenchus vulnus*)、カンキツネモグリセンチュウCitrus burrowing nematode (*Radopholus citrophilus*)

)、バナナネモグリセンチュウBanana burrowing nematode (*Radopholus similis*) 等のハリセンチュウ目 (Tylenchida) 線虫。

[0162] ヒト蟯虫Pinworm (*Enterobius vermicularis*)、馬蟯虫Equine pinworm (*Oxyuris equi*)、ウサギ蟯虫Rabbit pinworm (*Passalurus ambiguus*) 等の蟯虫目 (Oxyurida) 線虫、

豚回虫Pig roundworm (*Ascaris suum*)、馬回虫Horse roundworm (*Parascaris equorum*)、犬小回虫Dog roundworm (*Toxascaris leonina*)、犬回虫Dog intestinal roundworm (*Toxocara canis*)、猫回虫Feline roundworm (*Toxocara cati*)、牛回虫Large cattle roundworm (*Toxocara vitulorum*)、アニサキス属 (*Anisakis* spp.)、シュードテラノーバ属 (*Pseudoterranova* spp.)、鶏盲腸虫Caecal worm (*Heterakis gallinarum*)、鶏回虫Chicken roundworm (*Ascaridia galli*) 等の回虫目 (Ascaridida) 線虫。

[0163] メジナ虫Guinea worm (*Dracunculus medinensis*)、ドロレス顎口虫 (*Gnathostoma doloresi*)、剛棘顎口虫 (*Gnathostoma hispidum*)、日本顎口虫 (*Gnathostoma nipponicum*)、有棘顎口虫Reddish-coloured worm (*Gnathostoma spinigerum*)、犬胃虫Dog stomach worm (*Physaloptera canis*)、猫胃虫Cat stomach worm (*Physaloptera felidis*, *P. praeputialis*)、ラーラ胃虫Feline/canine stomach worm (*Physaloptera rara*)、東洋眼虫Eye worm (*Thelazia callipaeda*)、ロデシア眼虫Bovine eyeworm (*Thelazia rhodesi*)、大口馬胃虫Large mouth stomach worm (*Draschia megastoma*)、小口胃虫Equine stomach worm (*Habronema microstoma*)、ハエ胃虫Stomach worm (*Habronema muscae*)、美麗食道虫Gullet worm (*Gongylonema pulchrum*)、類円豚胃虫Thick stomach worm (*Ascarops strongylina*)、牛パラフィラリアParafilaria (*Parafilaria bovicola*)、多乳頭糸状虫 (*Parafilaria multipapillosa*)、沖縄糸状虫 (*Stephanofilaria okinawaensis*)、バンクロフト糸状虫Bancroft filaria (*Wuchereria bancrofti*)、マレー糸状虫 (*Brugia malayi*)、頸部糸状虫Neck threadworm (*Onchocerca cervicalis*)、ギブソン糸状虫 (*Onchocerca gibsoni*)、咽頭糸状虫Cattle filarial worm (*Onchocerca*

gutturosa)、回旋糸状虫 (*Onchocerca volvulus*)、指状糸状虫Bovine filarial worm (*Setaria digitata*)、馬糸状虫Peritoneal worm (*Setaria equina*)、唇乳頭糸状虫 (*Setaria labiatopapillosa*)、マーシャル糸状虫 (*Setaria marshalli*)、犬糸状虫Dog heartworm (*Dirofilaria immitis*)、ロア糸状虫African eye worm (*Loa loa*) 等の旋尾線虫目 (*Spirurida*) 線虫。

[0164] 鎖状鉤頭虫 (*Moniliformis moniliformis*)、大鉤頭虫Giant thorny-headed worm (*Macracanthorhynchus hirudinaceus*) 等の鉤頭虫類。

広節裂頭条虫Fish tapeworm (*Diphyllobothrium latum*)、日本海裂頭条虫 (*Diphyllobothrium nihonkaiense*)、マンソン裂頭条虫Manson tapeworm (*Spirometra erinaceieuropaei*)、大複殖門条虫 (*Diplogonoporus grandis*) 等の擬葉目 (*Pseudophyllidea*) 条虫。

[0165] 有線条虫 (*Mesocestoides lineatus*)、有輪条虫Chicken tapeworm (*Raillietina cesticillus*)、棘溝条虫Fowl tapeworm (*Raillietina echinobothrida*)、方形条虫Chicken tapeworm (*Raillietina tetragona*)、胞状条虫Canine tapeworm (*Taenia hydatigena*)、多頭条虫Canine tapeworm (*Taenia multiceps*)、羊条虫Sheep measles (*Taenia ovis*)、豆状条虫Dog tapeworm (*Taenia pisiformis*)、無鉤条虫Beef tapeworm (*Taenia saginata*)、連節条虫Tapeworm (*Taenia serialis*)、有鉤条虫Pork tapeworm (*Taenia solium*)、猫条虫Feline tapeworm (*Taenia taeniaeformis*)、単包条虫Hydatid tapeworm (*Echinococcus granulosus*)、多包条虫Small fox tapeworm (*Echinococcus multilocularis*)、ヤマネコ包条虫 (*Echinococcus oligarthrus*)、フォーゲル包条虫 (*Echinococcus vogeli*)、縮小条虫Rat tapeworm (*Hymenolepis diminuta*)、小型条虫Dwarf tapeworm (*Hymenolepis nana*)、瓜実条虫Double-pored dog tapeworm (*Dipylidium caninum*)、楔状条虫 (*Amoebotaenia sphenoides*)、漏斗状条虫 (*Choanotaenia infundibulum*)、ウズラ条虫 (*Metroliasthes coturnix*)、大条虫Equine tapeworm (*Anoplocephala magna*)、葉状条虫Cecal tapeworm (*Anoplocephala perfoliata*)、乳頭条虫Dwarf equine tapeworm (*Paranoplocephala mamillana*)、ベネデン条虫Common ta

peworm (*Moniezia benedeni*)、拡張条虫 Sheep tapeworm (*Moniezia expansa*)、ステイレシア属 (*Stilesia* spp.) 等の円葉目 (Cyclophyllidea) 条虫。

壺型吸虫 (*Pharyngostomum cordatum*)、ビルハルツ住血吸虫 Blood fluke (*Schistosoma haematobium*)、日本住血吸虫 Blood fluke (*Schistosoma japonicum*)、マンソン住血吸虫 Blood fluke (*Schistosoma mansoni*) 等の有壁吸虫目 (Strigeidida) 吸虫。

[0166] 移峯棘口吸虫 (*Echinostoma cinetorchis*)、浅田棘口吸虫 (*Echinostoma hortense*)、巨大肝蛭 Giant liver fluke (*Fasciola gigantica*)、肝蛭 Common liver fluke (*Fasciola hepatica*)、肥大吸虫 (*Fasciolopsis buski*)、平腹双口吸虫 (*Homalogaster paloniae*) 等の棘口吸虫目 (Echinostomida) 吸虫。

大陸槍型吸虫 (*Dicrocoelium chinensis*)、槍型吸虫 Lancet liver fluke (*Dicrocoelium dendriticum*)、アフリカ槍型吸虫 African lancet fluke (*Dicrocoelium hospes*)、小型膀胱蛭 (*Eurytrema coelomaticum*)、膀胱蛭 Pancreatic fluke (*Eurytrema pancreaticum*)、宮崎肺吸虫 (*Paragonimus miyazaki*)、大平肺吸虫 (*Paragonimus ohirai*)、ウエステルマン肺吸虫 Lung fluke (*Paragonimus westermani*) 等の斜峯吸虫目 (Plagiorchiida) 吸虫。

[0167] アンフィメルス属 (*Amphimerus* spp.)、肝吸虫 Chinese liver fluke (*Closporidium sinensis*)、猫肝吸虫 Cat liver fluke (*Opisthorchis felinus*)、タイ肝吸虫 Southeast Asian liver fluke (*Opisthorchis viverrini*)、シュードアンフィストームム属 (*Pseudamphistomum* spp.)、メトロキス属 (*Metorchis* spp.)、パラメトロキス属 (*Parametorchis* spp.)、異形吸虫 Intestinal fluke (*Heterophyes heterophyes*)、横川吸虫 (*Metagonimus yokokawai*)、前腸異形吸虫 (*Pygidiopsis summa*) 等の後峯吸虫目 (Opisthorchiida) 吸虫。

[0168] 赤痢アメーバ (*Entamoeba histolytica*, *E. invadens*) 等のアメーバ類。

フタゴバベシア (*Babesia bigemina*)、牛バベシア (*Babesia bovis*)、大形馬バベシア (*Babesia caballi*)、犬バベシア (*Babesia canis*)、猫バベ

シア (*Babesia felis*)、ギブソン犬バベシア (*Babesia gibsoni*)、大型ピロプラズマ (*Babesia ovata*)、サイタウクスゾーン・フェリス (*Cytauxzoon felis*)、熱帯ピロプラズマ病タイレリア (*Theileria annulata*)、仮性沿岸熱タイレリア (*Theileria mutans*)、小型ピロプラズマ (*Theileria orientalis*)、東沿岸熱タイレリア (*Theileria parva*) 等のピロプラズマ目 (*Piroplasmida*) 孢子虫類。

[0169] ヘモプロテウス・マンソニ (*Haemoproteus mansonii*)、鶏ロイコチトゾーン (*Leucocytozoon caulleryi*)、熱帯熱マラリア原虫 (*Plasmodium falciparum*)、四日熱マラリア原虫 (*Plasmodium malariae*)、卵形マラリア原虫 (*Plasmodium ovale*)、三日熱マラリア原虫 (*Plasmodium vivax*) 等の住血孢子虫目 (*Haemosporida*) 孢子虫類。

カリオスポラ属 (*Caryospora* spp.)、エイメリア・アセルブリナ (*Eimeria acervulina*)、エイメリア・ボビス (*Eimeria bovis*)、エイメリア・ブルネッチ (*Eimeria brunetti*)、エイメリア・マクシマ (*Eimeria maxima*)、エイメリア・ネカトリクス (*Eimeria necatrix*)、エイメリア・オビノイダリス (*Eimeria ovinoidalis*)、ウサギ肝コクシジウム (*Eimeria stiedae*)、鶏盲腸コクシジウム (*Eimeria tenella*)、犬イソスポーラ (*Isospora canis*)、猫イソスポーラ (*Isospora felis*)、豚イソスポーラ (*Isospora suis*)、ティゼリア・アレニ (*Tyzzeria alleni*)、ティゼリア・アンセリス (*Tyzzeria anseris*)、ティゼリア・パーニシオサ (*Tyzzeria perniciosa*)、ウエニヨネラ・アナティス (*Wenyonella anatis*)、ウエニヨネラ・ガガリ (*Wenyonella gagari*)、犬クリプトスポリジウム (*Cryptosporidium canis*)、猫クリプトスポリジウム (*Cryptosporidium felis*)、ヒトクリプトスポリジウム (*Cryptosporidium hominis*)、シチメンチヨウクリプトスポリジウム (*Cryptosporidium meleagridis*)、ネズミクリプトスポリジウム (*Cryptosporidium muris*)、小形クリプトスポリジウム (*Cryptosporidium parvum*)、サルコシスチス・カニス (*Sarcocystis canis*)、クルーズ肉孢子虫 (*Sarcocystis cruzi*)、サルコシスチス・フェリス (*Sarcocystis felis*)、ヒト肉胞

子虫 (*Sarcocystis hominis*)、サルコシスチス・ミーシェリアナ (*Sarcocystis miescheriana*)、サルコシスチス・ニューロナ (*Sarcocystis neurona*)、サルコシスチス・テネラ (*Sarcocystis tenella*)、サルコシスチス・オバリス (*Sarcocystis ovalis*)、トキソプラズマ (*Toxoplasma gondii*)、犬ヘパトゾーン (*Hepatozoon canis*)、猫ヘパトゾーン (*Hepatozoon felis*) 等の真コクシジウム目 (*Eucoccidiorida*) 孢子虫類。

[0170] 大腸バランチジウム (*Balantidium coli*) 等の前庭目 (*Vestibuliferida*) 繊毛虫類。

ヒストモナス (*Histomonas meleagridis*)、腸トリコモナス (*Pentatrichomonas hominis*)、口腔トリコモナス (*Trichomonas tenax*) 等のトリコモナス目 (*Trichomonadida*) 鞭毛虫類。

ランブル鞭毛虫 (*Giardia intestinalis*)、ジアルディア・ムリス (*Giardia muris*)、シチメンチヨウヘキサミタ (*Hexamita meleagridis*)、ヘキサミタ・パルバ (*Hexamita parva*) 等のディプロモナス目 (*Diplomonadida*) 鞭毛虫類。

ドノバンリーシュマニア (*Leishmania donovani*)、幼児リーシュマニア (*Leishmania infantum*)、大形リーシュマニア (*Leishmania major*)、熱帯リーシュマニア (*Leishmania tropica*)、ガンビアトリパノソーマ (*Trypanosoma brucei gambiense*)、ローデシアトリパノソーマ (*Trypanosoma brucei rhodesiense*)、クルーズトリパノソーマ (*Trypanosoma cruzi*)、媾疫トリパノソーマ (*Trypanosoma equiperdum*)、エバンストリパノソーマ (*Trypanosoma evansi*) 等のキネトプラスト目 (*Kinetoplastida*) 鞭毛虫類。

[0171] 本明細書における「植物」とは、ヒトの食料として栽培される穀類や果樹・野菜、家畜・家禽等の飼料作物、その姿や形を愛でる鑑賞植物、或いは公園・街路等の植栽等の維管束植物 (*Tracheophyta*) を意味し、具体例としては、以下の植物が挙げられるが、これらのみに限定されるものではない。

[0172] アカマツ Japanese Red Pine (*Pinus densiflora*)、ヨーロッパアカマツ Scots Pine (*Pinus sylvestris*)、クロマツ Japanese Black Pine (*Pinus thun*

bergii) 等のマツ科 (Pinaceae) 等に属するマツ目 (Pinales) 植物。

[0173] コショウ Pepper (*Piper nigrum*) 等のコショウ科 (Piperaceae)、アボカド Avocado (*Persea americana*) 等のクスノキ科 (Lauraceae) 等に属するモクレン類 (magnoliids)、

コンニャク Konjac (*Amorphophallus konjac*)、サトイモ Eddoe (*Colocasia esculenta*) 等のサトイモ科 (Araceae)、ナガイモ Chinese yam (*Dioscorea batatas*)、ヤマノイモ Japanese yam (*Dioscorea japonica*) 等のヤマノイモ科 (Dioscoreaceae)、リーキ Leek (*Allium ampeloprasum* var. *porrum*)、タマネギ Onion (*Allium cepa*)、ラッキョウ Rakkyo (*Allium chinense*)、ネギ Welsh onion (*Allium fistulosum*)、ニンニク Garlic (*Allium sativum*)、チャイブ Chives (*Allium schoenoprasum*)、アサツキ Chive (*Allium schoenoprasum* var. *foliosum*)、ニラ Oriental garlic (*Allium tuberosum*)、ワケギ Scallion (*Allium x wakegi*) 等のネギ科 (Alliaceae)、アスパラガス Asparagus (*Asparagus officinalis*) 等のクサスギカズラ科 (Asparagaceae)、ココヤシ Coconut palm (*Cocos nucifera*)、ギニアアブラヤシ Oil palm (*Elaeis guineensis*) 等のヤシ科 (Arecaceae) アレカヤシ 亜科 (Arecoideae)、ナツメヤシ Date palm (*Phoenix dactylifera*) 等のヤシ科 (Arecaceae) タリポットヤシ 亜科 (Coryphoideae)、パイナップル Pineapple (*Ananas comosus*) 等のパイナップル科 (Bromeliaceae)、イネ Rice (*Oryza sativa*) 等のイネ科 (Poaceae) エールハルタ 亜科 (Ehrhartoideae)、ベントグラス Bent grass (*Agrostis* spp.)、ブルーグラス Blue grass (*Poa* spp.)、オオムギ Barley (*Hordeum vulgare*)、コムギ Wheat (*Triticum aestivum*, *T. durum*)、ライムギ Rye (*Secale cereale*) 等のイネ科 (Poaceae) イチゴツナギ 亜科 (Pooideae)、ギョウギシバ Bermuda grass (*Cynodon dactylon*)、シバ Grass (*Zoysia* spp.) 等のイネ科 (Poaceae) ヒゲシバ 亜科 (Chloridoideae)、サトウキビ Sugarcane (*Saccharum officinarum*)、ソルガム Sorghum (*Sorghum bicolor*)、トウモロコシ Corn (*Zea mays*) 等のイネ科 (Poaceae) キビ 亜科 (Panicoideae)、バナナ Banana (*Musa* spp.) 等のバショウ科 (Musaceae)

e)、ミョウガMyoga (*Zingiber mioga*)、ショウガGinger (*Zingiber officinale*) 等のショウガ科 (*Zingiberaceae*) 等に属する単子葉類 (monocots)。

[0174] レンコンLotus root (*Nelumbo nucifera*) 等のハス科 (*Nelumbonaceae*)、ラッカセイPeanut (*Arachis hypogaea*)、ヒヨコマメChickpea (*Cicer arietinum*)、ヒラマメLentil (*Lens culinaris*)、エンドウPea (*Pisum sativum*)、ソラマメBroad bean (*Vicia faba*)、ダイズSoybean (*Glycine max*)、インゲンマメCommon bean (*Phaseolus vulgaris*)、アズキAdzuki bean (*Vigna angularis*)、ササゲCowpea (*Vigna unguiculata*) 等のマメ科 (*Fabaceae*)、ホップHop (*Humulus lupulus*) 等のアサ科 (*Cannabaceae*)、イチジクFig Tree (*Ficus carica*)、クワMulberry (*Morus spp.*) 等のクワ科 (*Moraceae*)、ナツメCommon jujube (*Ziziphus jujuba*) 等のクロウメモドキ科 (*Rhamnaceae*)、イチゴStrawberry (*Fragaria*)、バラRose (*Rosa spp.*) 等のバラ科 (*Rosaceae*) バラ亜科 (*Rosoideae*)、ビワJapanese loquat (*Eriobotrya japonica*)、リンゴApple (*Malus pumila*)、セイヨウナシEuropean Pear (*Pyrus communis*)、ナシNashi Pear (*Pyrus pyrifolia var. culta*) 等のバラ科 (*Rosaceae*) ナシ亜科 (*Maloideae*)、モモPeach (*Amygdalus persica*)、アンズApricot (*Prunus armeniaca*)、オウトウCherry (*Prunus avium*)、プルーンPrune (*Prunus domestica*)、アーモンドAlmond (*Prunus dulcis*)、ウメJapanese Apricot (*Prunus mume*)、スモモJapanese Plum (*Prunus salicina*)、オオシマザクラ (*Cerasus speciosa*)、ソメイヨシノ (*Cerasus x yedoensis 'Somei-yoshino'*) 等のバラ科 (*Rosaceae*) サクラ亜科 (*Prunoideae*)、トウガンWinter melon (*Benincasa hispida*)、スイカWatermelon (*Citrullus lanatus*)、ユウガオBottle gourd (*Lagenaria siceraria var. hispida*)、ヘチマLuffa (*Luffa cylindrica*)、カボチャPumpkin (*Cucurbita spp.*)、ズッキーニZucchini (*Cucurbita pepo*)、ニガウリBitter melon (*Momordica charantia var. pavel*)、メロンMuskmelon (*Cucumis melo*)、シロウリOriental pickling melon (*Cucumis melo var. conomon*)、マクワウリOriental melon (*Cucumis melo var. makuwa*)、キュウリCucumber (*Cucumis*

sativus) 等のウリ科 (Cucurbitaceae)、クリ Japanese Chestnut (*Castanea crenata*) 等のブナ科 (Fagaceae)、クルミ Walnut (*Juglans* spp.) 等のクルミ科 (Juglandaceae)、カシューナッツ Cashew (*Anacardium occidentale*)、マンゴー Mango (*Mangifera indica*)、ピスタチオ Pistachio (*Pistacia vera*) 等のウルシ科 (Anacardiaceae)、サンショウ Japanese pepper (*Zanthoxylum piperitum*) 等のミカン科 (Rutaceae) ヘンルーダ 亜科 (Rutoideae)、ダイダイ Bitter orange (*Citrus aurantium*)、ライム Lime (*Citrus auratifolia*)、ハッサク Hassaku orange (*Citrus hassaku*)、ユズ Yuzu (*Citrus junos*)、レモン Lemon (*Citrus limon*)、ナツミカン Natsumikan (*Citrus natsudaidai*)、グレープフルーツ Grapefruit (*Citrus x paradisi*)、オレンジ Orange (*Citrus sinensis*)、カボス Kabosu (*Citrus sphaerocarpa*)、スダチ Sudachi (*Citrus sudachi*)、ポンカン Mandarin Orange (*Citrus tangerina*)、ウンシュウミカン Satsuma (*Citrus unshiu*)、キンカン Kumquat (*Fortunella* spp.) 等のミカン科 (Rutaceae) ミカン 亜科 (Aurantioideae)、セイヨウワサビ Horseradish (*Armoracia rusticana*)、カラシナ Mustard (*Brassica juncea*)、タカナ Takana (*Brassica juncea* var. *integrifolia*)、セイヨウアブラナ Rapeseed (*Brassica napus*)、カリフラワー Cauliflower (*Brassica oleracea* var. *botrytis*)、キャベツ Cabbage (*Brassica oleracea* var. *capitata*)、メキャベツ Brussels sprout (*Brassica oleracea* var. *gemmifera*)、ブロッコリー Broccoli (*Brassica oleracea* var. *italica*)、チンゲンサイ Green pak choi (*Brassica rapa* var. *chinensis*)、ノザワナ Nozawana (*Brassica rapa* var. *hakabura*)、アブラナ Napa cabbage (*Brassica rapa* var. *nippo-oleifera*)、ミズナ Potherb Mustard (*Brassica rapa* var. *nipposinica*)、ハクサイ Napa cabbage (*Brassica rapa* var. *pekinensis*)、コマツナ Turnip leaf (*Brassica rapa* var. *perviridis*)、カブ Turnip (*Brassica rapa* var. *rapa*)、ルッコラ Garden rocket (*Eruca vesicaria*)、ダイコン Daikon (*Raphanus sativus* var. *longipinnatus*)、ワサビ Wasabi (*Wasabia japonica*) 等のアブラナ科 (Brassicaceae)、パパイヤ Papaya (*Car*

ica papaya) 等のパパイヤ科 (Caricaceae)、オクラOkra (*Abelmoschus esculentus*)、ワタCotton plant (*Gossypium* spp.)、カカオCacao (*Theobroma cacao*) 等のアオイ科 (Malvaceae)、ブドウGrape (*Vitis* spp.) 等のブドウ科 (Vitaceae)、テンサイSugar beet (*Beta vulgaris* ssp. *vulgaris* var. *altissima*)、テーブルビートTable beet (*Beta vulgaris* ssp. *vulgaris* var. *vulgaris*)、ホウレンソウSpinach (*Spinacia oleracea*) 等のヒユ科 (Amaranthaceae)、ソバBuckweat (*Fagopyrum esculentum*) 等のタデ科 (Polygonaceae)、カキKaki Persimmon (*Diospyros kaki*) 等のカキノキ科 (Ebenaceae)、チャTea plant (*Camellia sinensis*) 等のツバキ科 (Theaceae)、キウイフルーツKiwifruit (*Actinidia deliciosa*, *A. chinensis*) 等のマタタビ科 (Actinidiaceae)、ブルーベリーBlueberry (*Vaccinium* spp.)、クランベリーCranberry (*Vaccinium* spp.) 等のツツジ科 (Ericaceae)、コーヒーノキCoffee plants (*Coffea* spp.) 等のアカネ科 (Rubiaceae)、レモンバームLemon balm (*Melissa officinalis*)、ミントMint (*Mentha* spp.)、バジルBasil (*Ocimum basilicum*)、シソShiso (*Perilla frutescens* var. *crispa*)、エゴマ (*Perilla frutescens* var. *frutescens*)、セージCommon Sage (*Salvia officinalis*)、タイムThyme (*Thymus* spp.) 等のシソ科 (Lamiaceae)、ゴマSesame (*Sesamum indicum*) 等のゴマ科 (Pedaliaceae)、オリーブOlive (*Olea europaea*) 等のモクセイ科 (Oleaceae)、サツマイモSweet potato (*Ipomoea batatas*) 等のヒルガオ科 (Convolvulaceae)、トマトTomato (*Solanum lycopersicum*)、ナスEggplant (*Solanum melongena*)、ジャガイモPotato (*Solanum tuberosum*)、トウガラシChili pepper (*Capsicum annuum*)、ピーマンBell pepper (*Capsicum annuum* var. '*grossum*')、タバコTobacco (*Nicotiana tabacum*) 等のナス科 (Solanaceae)、セロリCelery (*Apium graveolens* var. *dulce*)、コリアンダーCoriander (*Coriandrum sativum*)、ミツバJapanese honeywort (*Cryptotaenia Canadensis* subsp. *japonica*)、ニンジンCarrot (*Daucus carota* subsp. *sativus*)、パセリParsley (*Petroselinum crispum*)、イタリアンパセリItalian parsley (*Petroselinum*

um neapolitanum) 等のセリ科 (Apiaceae)、ウドUdo (*Aralia cordata*)、タラノキ (*Aralia elata*) 等のウコギ科 (Araliaceae)、アーティチョークArtichoke (*Cynara scolymus*) 等のキク科 (Asteraceae) アザミ亜科 (Carduoideae)、キクニガナChicory (*Cichorium intybus*)、レタスLettuce (*Lactuca sativa*) 等のキク科 (Asteraceae) タンポポ亜科 (Asteraceae)、キクFlorists' daisy (*Dendranthema grandiflorum*)、シュンギクCrown daisy (*Glebionis coronaria*)、ヒマワリSunflower (*Helianthus annuus*)、フキFuki (*Petasites japonicus*)、ゴボウBurdock (*Arctium lappa*) 等のキク科 (Asteraceae) キク亜科 (Asteraceae) 等に属する真正双子葉類 (eudicots)。

[0175] 本明細書における「動物」とは、ヒト又は伴侶動物・愛玩動物や家畜・家禽、さらには研究・実験動物等の脊椎動物 (Vertebrata) を意味し、具体例としては、以下の動物が挙げられるが、これらのみに限定されるものではない。

[0176] フサオマキザルTufted capuchin (*Cebus apella*) 等のオマキザル科 (Cebidae)、カニクイザルCrab-eating macaque (*Macaca fascicularis*)、アカゲザルRhesus macaque (*Macaca mulatta*) 等のオナガザル科 (Cercopithecidae)、チンパンジーChimpanzee (*Pan troglodytes*)、ヒトHuman (*Homo sapiens*) 等のヒト科 (Hominidae)、アナウサギEuropean rabbit (*Oryctolagus cuniculus*) 等のウサギ科 (Leporidae)、チンチラLong-tailed chinchilla (*Chinchilla lanigera*) 等のチンチラ科 (Chinchillidae)、モルモットGuinea pig (*Cavia porcellus*) 等のテンジクネズミ科 (Caviidae)、ゴールデンハムスターGolden hamster (*Mesocricetus auratus*)、ヒメキヌゲネズミDjungarian hamster (*Phodopus sungorus*)、モンゴルキヌゲネズミChinese hamster (*Cricetulus griseus*) 等のキヌゲネズミ科 (Cricetidae)、スナネズミMongolian gerbil (*Meriones unguiculatus*)、ハツカネズミHouse mouse (*Mus musculus*)、クマネズミBlack rat (*Rattus rattus*) 等のネズミ科 (Muridae)、シマリスChipmunk (*Tamias sibiricus*) 等のリス科 (Sciuridae)、ヒトコブラクダDromedary (*Camelus dromedarius*)、フタコブラクダBactrian

camel (*Camelus bactrianus*)、アルパカAlpaca (*Vicugna pacos*)、リヤマLama (*Lama glama*) 等のラクダ科 (*Camelidae*)、ブタPig (*Sus scrofa domestica*) 等のイノシシ科 (*Suidae*)、トナカイReindeer (*Rangifer tarandus*)、アカシカRed deer (*Cervus elaphus*) 等のシカ科 (*Cervidae*)、ヤクYak (*Bos grunniens*)、ウシCattle (*Bos taurus*)、アジアスイギュウWater buffalo (*Bubalus arnee*)、ヤギGoat (*Capra hircus*)、ヒツジSheep (*Ovis aries*) 等のウシ科 (*Bovidae*)、イエネコCat (*Felis silvestris catus*) 等のネコ科 (*Felidae*)、イエイヌDog (*Canis lupus familiaris*)、アカギツネRed fox (*Vulpes vulpes*) 等のイヌ科 (*Canidae*)、ヨーロッパミンクEuropean mink (*Mustela lutreola*)、アメリカミンクAmerican mink (*Mustela vison*)、フェレットFerret (*Mustela putorius furo*) 等のイタチ科 (*Mustelidae*)、ロバDonkey (*Equus asinus*)、ウマHorse (*Equus caballus*) 等のウマ科 (*Equidae*)、アカカンガルーRed kangaroo (*Macropus rufus*) 等のカンガルー科 (*Macropodidae*) 等に属する哺乳類 (*Mammalia*)。

[0177] ダチョウOstrich (*Struthio camelus*) 等のダチョウ科 (*Struthionidae*)、アメリカレアAmerican rhea (*Rhea americana*) 等のレア科 (*Rheidae*)、エミューEmu (*Dromaius novaehollandiae*) 等のエミュー科 (*Dromaiidae*)、ライチョウPtarmigan (*Lagopus muta*)、シチメンチョウWild turkey (*Meleagris gallopavo*)、ウズラJapanese quail (*Coturnix japonica*)、ニワトリChicken (*Gallus gallus domesticus*)、コウライキジCommon pheasant (*Phasianus colchicus*)、キンケイGolden pheasant (*Chrysolophus pictus*)、インドクジャクIndian peafowl (*Pavo cristatus*) 等のキジ科 (*Phasianidae*)、ホロホロチョウHelmeted guineafowl (*Numida meleagris*) 等のホロホロチョウ科 (*Numididae*)、マガモMallard (*Anas platyrhynchos*)、アヒルDomesticated duck (*Anas platyrhynchos var. domestica*)、カルガモSpot-billed duck (*Anas poecilorhyncha*)、ハイイロガンGreylag goose (*Anser anser*)、サカツラガンSwan goose (*Anser cygnoides*)、オオハクチョウWhooper swan (*Cygnus cygnus*)、コブハクチョウMute swan (*Cygnus olor*) 等のカ

モ科 (Anatidae)、カワラバトRock dove (*Columba livia*)、キジバトOriental turtle dove (*Streptopelia orientalis*)、コキジバトEuropean turtle dove (*Streptopelia turtur*) 等のハト科 (Columbidae)、キバタンSulphur-crested cockatoo (*Cacatua galerita*)、モモイロインコGalah (*Eolophus roseicapilla*)、オカメインコCockatiel (*Nymphicus hollandicus*) 等のオウム科 (Cacatuidae)、コザクラインコRosy-faced lovebird (*Agapornis roseicollis*)、ルリコンゴウインコBlue-and-yellow macaw (*Ara ararauna*)、コンゴウインコScarlet Macaw (*Ara macao*)、セキセイインコBudgerigar (*Melopsittacus undulatus*)、ヨウムAfrican grey parrot (*Psittacus erithacus*) 等のインコ科 (Psittacidae)、キュウカンチョウCommon hill myna (*Gracula religiosa*) 等のムクドリ科 (Sturnidae)、ベニスズメRed avadavat (*Amandava amandava*)、キンカチョウZebra finch (*Taeniopygia guttata*)、ジュウシマツBengalese finch (*Lonchura striata* var. *domestica*)、ブンチョウJava sparrow (*Padda oryzivora*) 等のカエデチョウ科 (Estrildidae)、カナリアDomestic canary (*Serinus canaria domestica*)、ゴシキヒワEuropean goldfinch (*Carduelis carduelis*) 等のアトリ科 (Fringillidae) 等に属する鳥類 (Aves)。

[0178] エボシカメレオンVeiled chameleon (*Chamaeleo calypttratus*) 等のカメレオン科 (Chamaeleonidae)、グリーンイグアナGreen iguana (*Iguana iguana*)、グリーンアノールCarolina anole (*Anolis carolinensis*) 等のイグアナ科 (Iguanidae)、ナイルオオトカゲNile monitor (*Varanus niloticus*)、ミズオオトカゲWater monitor (*Varanus salvator*) 等のオオトカゲ科 (Varanidae)、オマキトカゲSolomon islands skink (*Corucia zebrata*) 等のトカゲ科 (Scincidae)、スジオナメラBeauty rat snake (*Elaphe taeniura*) 等のナミヘビ科 (Colubridae)、アカオボアBoa constrictor (*Boa constrictor*) 等のボア科 (Boidae)、インドニシキヘビIndian python (*Python molurus*)、アミメニシキヘビReticulated python (*Python reticulatus*) 等のニシキヘビ科 (Pythonidae)、カミツキガメCommon snapping turtle (*Chelydra*

serpentina) 等のカミツキガメ科 (Chelydridae)、キスイガメDiamondback terrapin (*Malaclemys terrapin*)、アカミミガメPond slider (*Trachemys scripta*) 等のヌマガメ科 (Emydidae)、ニホンイシガメJapanese pond turtle (*Mauremys japonica*) 等のイシガメ科 (Geoemydidae)、ヨツユビリクガメCentral Asian tortoise (*Agrionemys horsfieldii*) 等のリクガメ科 (Testudinidae)、スッポンSoft-shelled turtle (*Pelodiscus sinensis*) 等のスッポン科 (Trionychidae)、アメリカアリゲーターAmerican alligator (*Alligator mississippiensis*)、クロカイマンBlack caiman (*Melanosuchus niger*) 等のアリゲータ科 (Alligatoridae)、シャムワニSiamese crocodile (*Crocodylus siamensis*) 等のクロコダイル科 (Crocodylidae) 等に属する爬虫類 (Reptilia)。

[0179] コイCarp (*Cyprinus carpio*)、キンギョGoldfish (*Carassius auratus auratus*)、ゼブラフィッシュZebrafish (*Danio rerio*) 等のコイ科 (Cyprinidae)、クーリーローチKuhli loach (*Pangio kuhlii*) 等のドジョウ科 (Cobitidae)、ピラニア・ナッテリーRed piranha (*Pygocentrus nattereri*)、ネオンテトラNeon tetra (*Paracheirodon innesi*) 等のカラシン科 (Characidae)、シナノユキマスMaraena whitefish (*Coregonus lavaretus maraena*)、ギンザケCoho salmon (*Oncorhynchus kisutch*)、ニジマスRainbow trout (*Oncorhynchus mykiss*)、マスノスケChinook salmon (*Oncorhynchus tshawytscha*)、タイセイヨウサケAtlantic salmon (*Salmo salar*)、ブラウントラウトBrown trout (*Salmo trutta*) 等のサケ科 (Salmonidae)、タイリクスズキSpotted sea bass (*Lateolabrax maculatus*) 等のスズキ科 (Percichthyidae)、キンギョハナダイSea goldie (*Pseudanthias squamipinnis*)、クエLong tooth grouper (*Epinephelus bruneus*)、マハタConvict grouper (*Epinephelus septemfasciatus*) 等のハタ科 (Serranidae)、ブルーギルBluegill (*Lepomis macrochirus*) 等のサンフィッシュ科 (Centrarchidae)、シマアジWhite trevally (*Pseudocaranx dentex*)、カンパチGreater amberjack (*Seriola dumerili*)、ブリJapanese amberjack (*Seriola quinqueradiata*) 等のア

ジ科 (Carangidae)、マダイRed sea bream (*Pagrus major*) 等のタイ科 (Sparidae)、ナイルティラピアNile tilapia (*Oreochromis niloticus*)、スカラレ・エンゼルAngelfish (*Pterophyllum scalare*) 等のシクリッド科 (Cichlidae)、クロマグロPacific bluefin tuna (*Thunnus orientalis*) 等のサバ科 (Scombridae)、トラフグJapanese pufferfish (*Takifugu rubripes*) 等のフグ科 (Tetraodontidae) 等に属する真骨魚類 (Actinopterygii)。

[0180] 本明細書における「有用昆虫」とは、その生産物を利用することで人間の生活に役立てたり、果樹・野菜の受粉に用いる等の農作業の効率化等に役立つ昆虫を意味し、具体例としては、ニホンミツバチJapanese honeybee (*Apis cerana japonica*)、セイヨウミツバチWestern honey bee (*Apis mellifera*)、マルハナバチBumblebee (*Bombus consobrinus wittenburgi*, *B. diversus diversus*, *B. hypocrita hypocrita*, *B. ignitus*, *B. terrestris*)、マメコバチHornfaced bee (*Osmia cornifrons*)、カイコSilkworm (*Bombyx mori*) 等が挙げられるが、これらに限定されるものではない。

[0181] 本明細書における「天敵」とは、捕食や寄生によって特定の種の生物、特に農作物を加害する特定の種の生物を死に至らしめる又はその繁殖を抑制する生物を意味し、具体例としては、以下の生物が挙げられるが、これらのみ限定されるものではない。

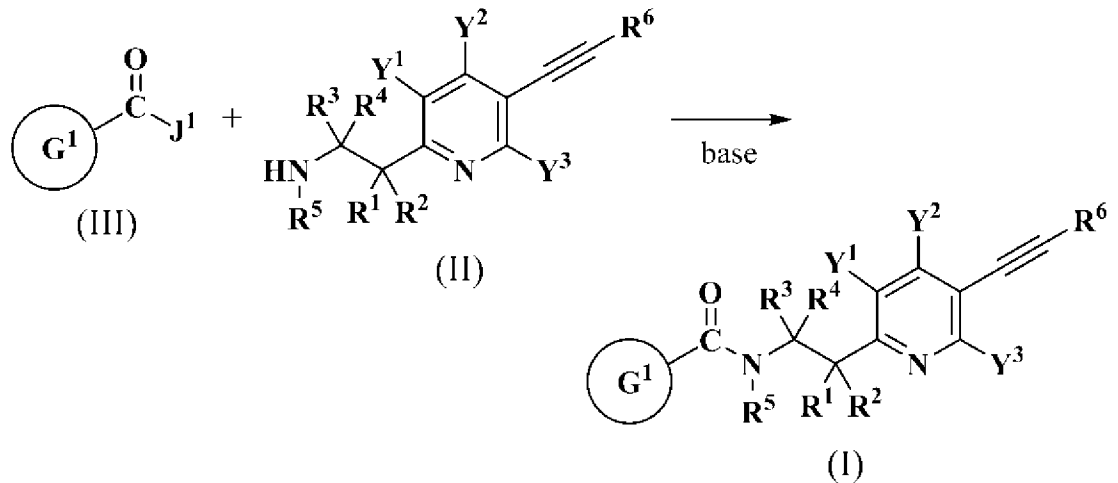
[0182] ササカワハモグリコマユバチ (*Dacnusa sasakawai*)、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*)、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*)、アオムシコマユバチ (*Apanteles glomeratus*) 等のコマユバチ科 (Braconidae)、キアシアブラコバチ (*Aphelinus albipodus*)、チャバラアブラコバチ (*Aphelinus asychis*)、ワタアブラコバチ (*Aphelinus gossypii*)、クロスジアブラコバチ (*Aphelinus maculatus*)、アブラコバチ (*Aphelinus varipes*)、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*)、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*)、チチュウカイツヤコバチ (*Eretmocerus mundus*) 等のツヤコバチ科 (Aphelinidae) 及びハモグリヤドリヒメコバチ (*Chrysocharis pentheus*)、ハモグリミドリヒメコバチ (*Neochrysocharis formosa*)、イサエアヒ

メコバチ (*Diglyphus isaea*)、カンムリヒメコバチ (*Hemiptarsenus varicornis*) 等のヒメコバチ科 (*Eulophidae*) 等に属する寄生蜂 *Parasitic wasp*; ショクガタマバエ *Aphidophagous gall midge* (*Aphidoletes aphidimyza*); ナナホシテントウ *Seven-spot ladybird* (*Coccinella septempunctata*); ナミテントウ *Asian lady beetle* (*Harmonia axyridis*); ヒメカメノコテントウ *Predatory beetle* (*Propylea japonica*); コヒメハナカメムシ (*Orius minutus*)、ツヤヒメハナカメムシ (*Orius nagaii*)、ナミヒメハナカメムシ (*Orius sauteri*)、タイリクヒメハナカメムシ *Minute pirate bug* (*Orius strigicollis*) 等のハナカメムシ科 (*Anthocoridae*) に属する捕食性カメムシ *Anthocorid predatory bug*; クロヒョウタンカスミカメ (*Pilophorus typicus*)、タバコカスミカメ (*Nesidiocoris tenuis*) 等のカスミカメムシ科 (*Miridae*) に属する捕食性カメムシ *Predatory mirid*; アリガタシマアザミウマ (*Franklinothrips vespiformis*) 等のシマアザミウマ科 (*Aeolothripidae*) に属する捕食性アザミウマ *Predatory thrips*; フタモンクサカゲロウ (*Dichochrysa formosanus*)、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla nipponensis*) 等のクサカゲロウ科 (*Chrysopidae*) に属するクサカゲロウ *Green lacewing*; ミヤコカブリダニ (*Neoseiulus californicus*)、ククメリスカブリダニ (*Amblyseius cucumeris*)、デジェネランスカブリダニ (*Amblyseius degenerans*)、スワルスキーカブリダニ (*Amblyseius swirskii*)、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) 等のカブリダニ科 (*Phytoseiidae*) に属するカブリダニ *Predatory mite*; キクヅキコモリグモ *Wolf spider* (*Pardosa pseudoannulata*); ハナグモ *Crab spider* (*Misumenops tricuspidatus*)。

[0183] 式 (I) で表される本発明化合物は、例えば以下の方法により製造することが出来る。

製造法A

[化7]



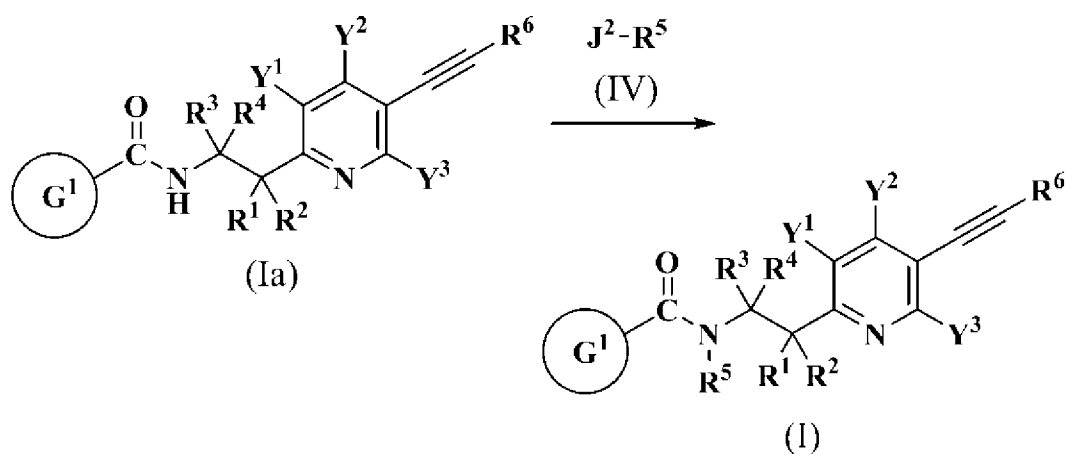
(式(I)及び式(II)中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は前記と同じ意味を表す。式(I)及び式(III)中、 G^1 は前記と同じ意味を表す。式(III)中、 J^1 は塩素原子、臭素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ(例えば、ピバロイルオキシ)、 $C_1\sim C_4$ アルコキシカルボニルオキシ(例えば、イソブチルオキシカルボニルオキシ)又はアゾリル(例えば、イミダゾール-1-イル)等を表す。)

式(II)で表される化合物又はその塩(例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩、*p*-トルエンスルホン酸塩等)と、式(III)で表される化合物とを、必要ならばベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、ジエチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、酢酸エチル、*N,N*-ジメチルホルムアミド、*N,N*-ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、水又はそれらの2種類以上の任意の割合の混合物等を溶媒として用い、必要ならば式(II)で表される化合物1モル当量に対して、1~3モル当量の炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、酢酸ナトリウム、トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、*N*-メチルモルホリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の塩基存在下、 0°C ~反応混合物の還流温度の温度範囲で30分~24時間反応させることにより、式(I)で表される本発明化合物を得ることができる。

[0184] ここで用いられる式(III)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも、文献記載の公知の方法、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1991年、34巻、1630頁等に記載の方法に準じて、対応する公知のカルボン酸を、塩化チオニル、五塩化リン又は塩化オキザリル等のハロゲン化剤と反応させる方法、テトラヘドロンのレターズ [Tetrahedron Lett.] 2003年、44巻、4819頁、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1991年、34巻、222頁等に記載の方法に準じて、対応する公知のカルボン酸と、塩化ピバロイル又はクロルギ酸イソブチル等の有機酸ハロゲン化物とを、必要ならば塩基の存在下、反応させる方法、又は、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1989年、54巻、5620頁等に記載の、対応する公知のカルボン酸と、カルボニルジイミダゾール又はスルホニルジイミダゾール等とを反応させる方法等を用いて合成することができる。

[0185] 製造法B

[化8]



(式(Ia)中、G¹、Y¹、Y²、Y³、R¹、R²、R³、R⁴及びR⁶は前記と同じ意味を表す。式(IV)中、R⁵は水素原子、-OH、C₁~C₄アルコキシ及びC₁~C₄ハロアルコキシ以外の前記と同じ意味を表し、J²は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、C₁~C₄アルキルカルボニルオキシ(例えば、ピバロイルオキシ等)、C₁~C

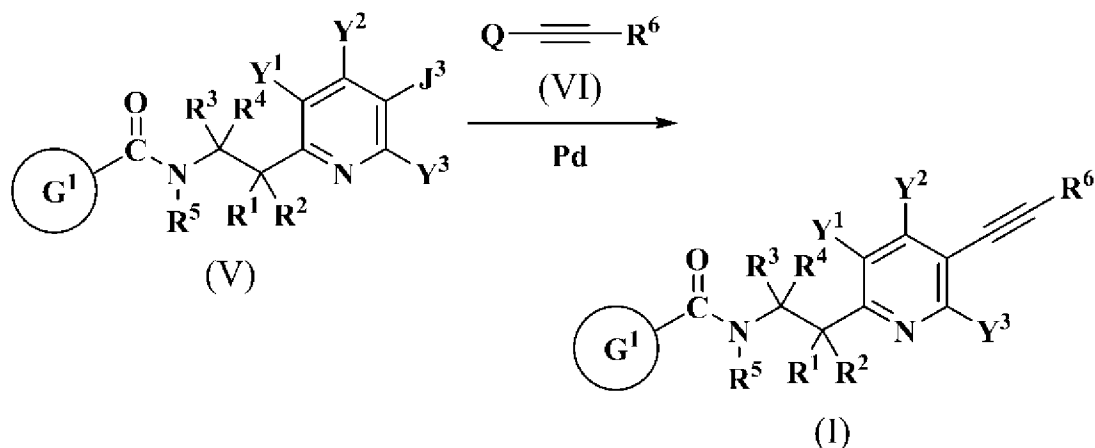
4 アルキルスルホネート（例えば、メタンスルホニルオキシ等）、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホネート（例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ等）、アリールスルホネート（例えば、ベンゼンスルホニルオキシ、*p*-トルエンスルホニルオキシ等）又はアゾリル（例えば、イミダゾール-1-イル等）等の良好な脱離基を表す。式(I)中、 G^1 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 及び R^6 は上記と同じ意味を表す。）

[0186] 式(I)において R^5 が水素原子である式(Ia)で表される本発明化合物1モル当量と、式(Ia)で表される化合物1モル当量に対して、1~10モル当量の式(IV)で表される化合物とを、必要ならばtert-ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、アセトニトリル又はN,N-ジメチルホルムアミド等の極性溶媒を用い、必要ならば式(Ia)で表される化合物1モル当量に対して1~3モル当量の水素化ナトリウム、カリウム tert-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミン又はピリジン等の塩基存在下、0~90℃の温度範囲で10分~24時間反応させることにより、式(I)で表される本発明化合物を得ることができる。

[0187] ここで用いられる式(IV)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも、文献記載の一般的な合成方法、例えばケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン [Chem. Pharm. Bull.] 1986年、34巻、540頁及び2001年、49巻、1102頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J. Am. Chem. Soc.] 1964年、86巻、4383頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1983年、48巻、5280頁、オーガニック・シンセシス [Org. Synth.] 1988年、コレクティブボリューム6巻、101頁、シンレット [Synlett] 2005年、2847頁、シンセシス [Synthesis] 1990年、1159頁、日本公開特許公報 (JP H05-125017号公報)、欧州特許公報 (EP 0,051,273号公報)、英国特許公報 (GB 2,161,802号公報)等に記載の方法に準じて合成することができる。

[0188] 製造法C

[化9]



(式(V)中、G¹、Y¹、Y²、Y³、R¹、R²、R³、R⁴及びR⁵は前記と同じ意味を表し、J³は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はC₁~C₄ハロアルキルスルホネート(例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ等)等の良好な脱離基を表す。)

式(V)で表される化合物を、例えばヨーロピアン・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー[Eur. J. Org. Chem.]2015年、2015巻、4389頁等に記載の一般的な菌頭カップリングの反応条件を用い、式(VI) [式中、R⁶は前記と同じ意味を表し、Qは水素原子を表す。]で表される置換アセチレンと反応させるか、式(V)で表される化合物と式(VI) [式中、R⁶は前記と同じ意味を表し、Qはトリメチルシリル等を表す。]で表される置換アセチレンとを、例えば国際特許出願公報(WO 2005/094822号公報)等に準じて、フッ化テトラブチルアンモニウム共存下、菌頭カップリングの反応条件下反応させるか、或いは、式(V)で表される化合物を、例えばヘテロサイクルズ[Heterocycles]1997年、46巻、209頁等に記載の一般的な根岸カップリングの反応条件下、式(VI) [式中、R⁶は前記と同じ意味を表し、Qは-ZnCl、-ZnBr又は-ZnI等を表す。]で表される置換アセチレンと反応させることにより、式(I)で表される本発明化合物を得ることができる。

[0189] ここで用いられる式(V)で表される化合物の或ものは、例えば国際特許出願

公報 (WO 2005/014545号公報)、国際特許出願公報 (WO 2013/064461号公報)、国際特許出願公報 (WO 2013/064521号公報) 等記載の公知化合物であり、また、それ以外のもも公知化合物と同様にして合成することができる。

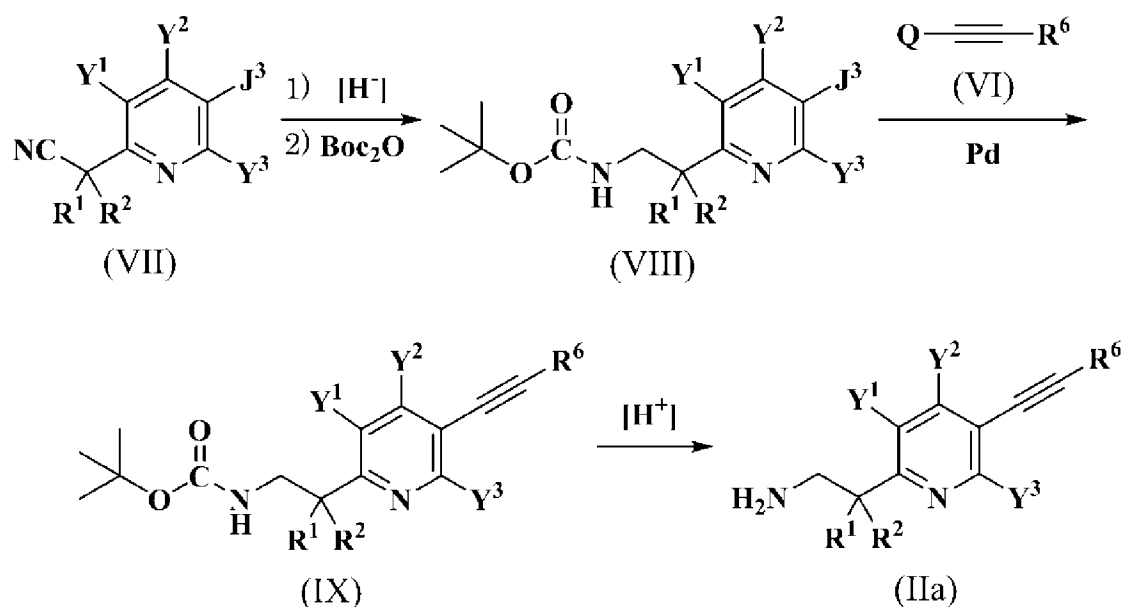
また、式(VI)で表される化合物の或ものは公知化合物であり、一部は市販品としても入手できる。また、それ以外のもも公知化合物に関する文献記載の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

[0190] 製造法A～製造法Cにおいて、反応終了後の反応混合物は、直接濃縮、又は有機溶媒に溶解し、水洗後濃縮、又は氷水に投入、有機溶媒抽出後濃縮といった、通常の後処理を行ない、目的のアルキニルピリジン置換アミド化合物を得ることができる。また、精製の必要が生じたときには、再結晶、カラムクロマトグラフ、薄層クロマトグラフ、液体クロマトグラフ分取等の、任意の精製方法によって不純物を分離し、精製することができる。

製造法Aで用いられる式(II)で表される化合物は、例えば反応式1～反応式10のようにして合成することができる。

[0191] 反応式1

[化10]



(式(VII)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びJ³は前記と同じ意味を表す。式(VI)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びJ³は上記と同じ意味を表す。式(VI)中、R⁶

は前記と同じ意味を表し、Qは水素原子、トリメチルシリル等を表す。式(IX)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びR⁶は上記と同じ意味を表す。式(IIa)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びR⁶は上記と同じ意味を表す。)

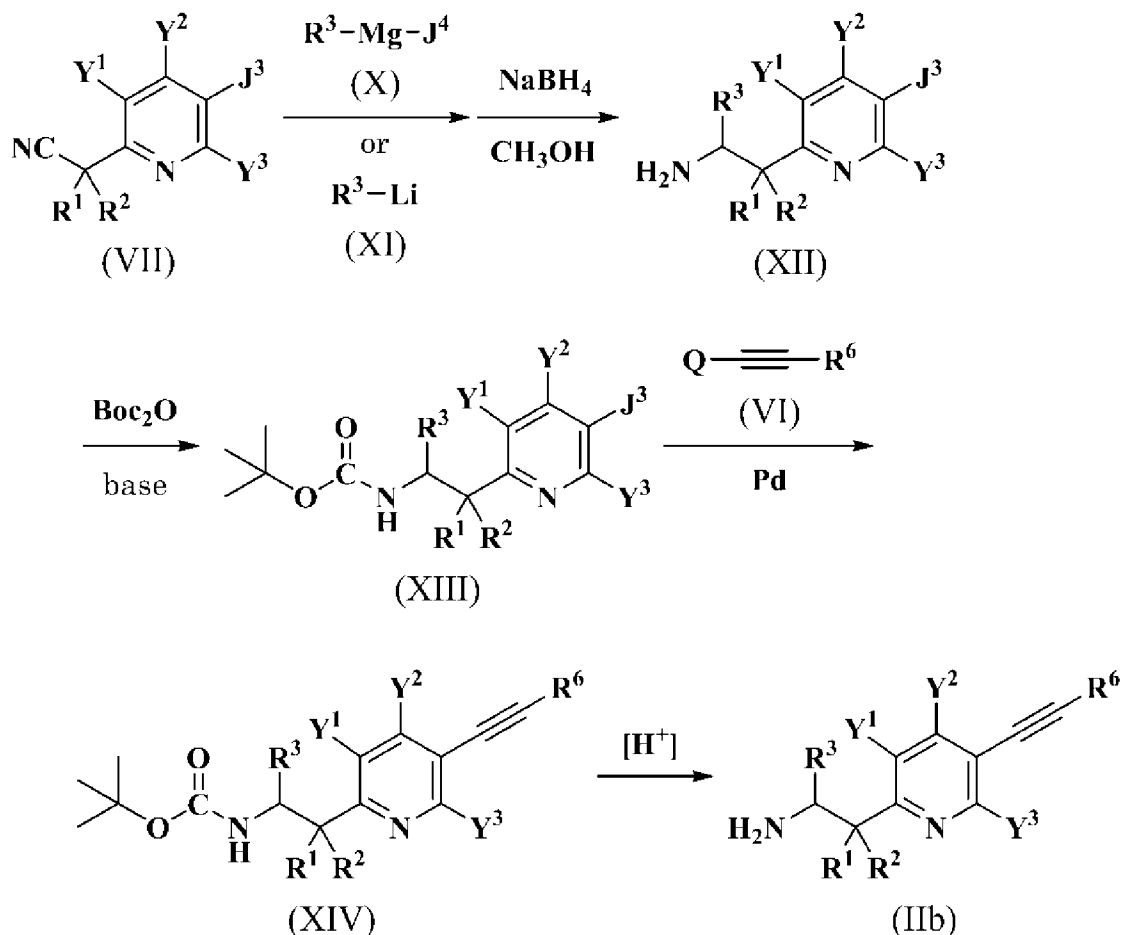
[0192] 式(VII)で表される化合物を、例えばバイオオーガニック・アンド・メディシナル・ケミストリー・レターズ[Bioorganic & Med. Chem. Lett.] 2012年、22巻、6108頁等に記載の方法に準じて、ジイソブチルアルミニウムヒドリド等の還元剤を用いて還元した後、二炭酸ジ-tert-ブチルと反応させることにより式(VIII)で表される化合物を合成することができる。

[0193] 次に、式(VIII)で表される化合物を式(VI)で表される化合物と、例えばオーガニック・アンド・バイオモレキュラー・ケミストリー[Org. Biomol. Chem.] 2002年、12巻、185頁、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 2009年、52巻、3563頁等に記載の菌頭カップリングの反応条件を用いて反応させることにより式(IX)で表される化合物を合成することができる。

[0194] このようにして得られた式(IX)で表される化合物を、例えばヨーロッパ特許公報 (EP 1,574,511号公報)、国際特許出願公報 (WO 2008/021927号公報)、国際特許出願公報 (WO 2010/075200号公報) 等に記載の方法に準じて塩酸、臭化水素酸、トリフルオロ酢酸等と反応させて脱保護することにより、式(II)においてR³, R⁴及びR⁵が水素原子である式(IIa)で表される化合物又はその塩 (例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩等) を得ることができる。

[0195] 反応式2

[化11]



(式(VII)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^2 及び J^3 は前記と同じ意味を表す。式(X)中、 R^3 は $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、 J^4 は塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表す。式(XI)中、 R^3 は $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表す。式(XII)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^2 , R^3 及び J^3 は上記と同じ意味を表す。式(IIb)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^2 , R^3 及び R^6 は上記と同じ意味を表す。)

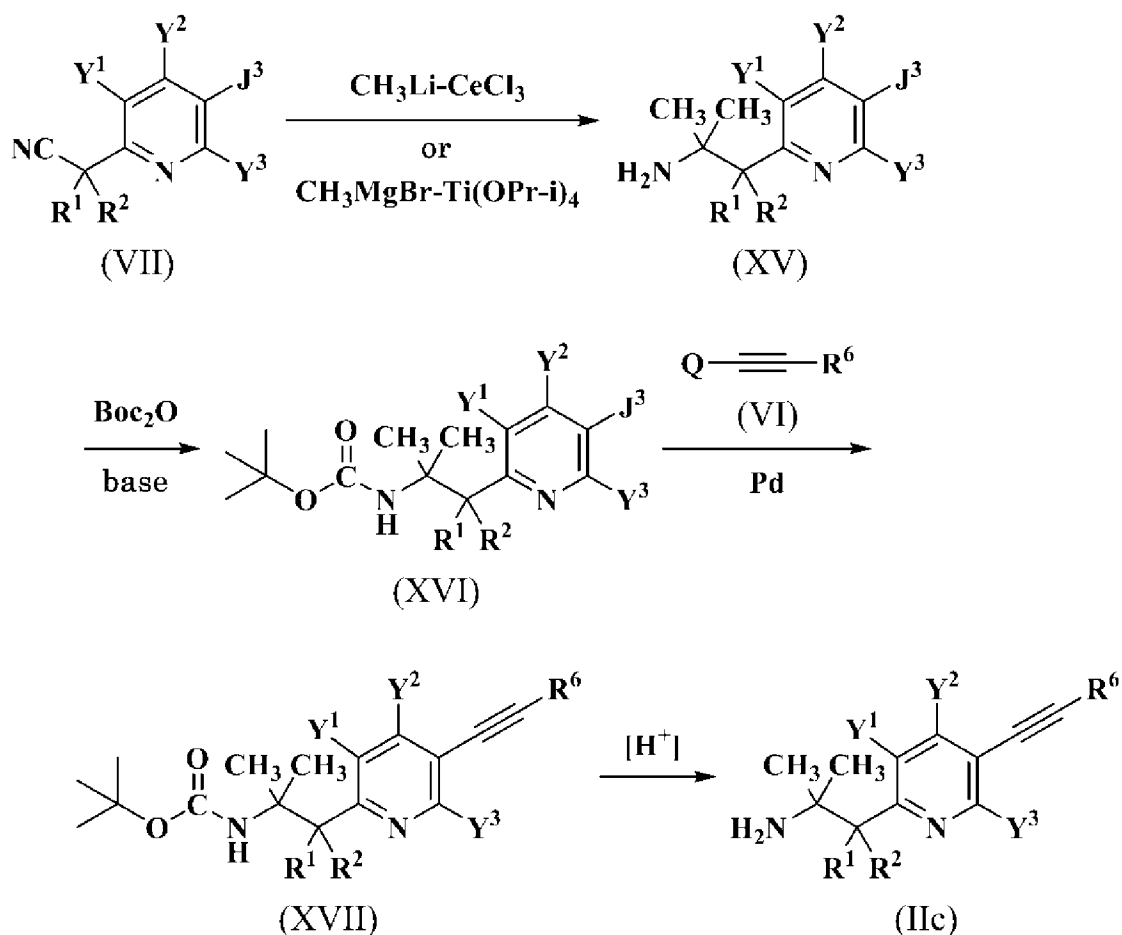
[0196] 式(VII)で表される化合物を、例えばバイオオーガニック・アンド・メディシナル・ケミストリー・レターズ[Bioorganic & Med. Chem. Lett.]2009年、19巻、1488頁及び1492頁、2011年、21巻、1434頁等に記載の方法に準じて、式(X)で表される公知のグリニャール反応剤と反応させるか、又は式(XI)で表される公知のリチウム反応剤と反応させた後、水素化ホウ素ナトリウム等を用いて還元することにより式(XII)で表される化合

物を合成することができる。

[0197] このようにして得られた式(XII)で表される化合物を反応式1と同様にして反応させることにより、式(II)においてR⁴及びR⁵が水素原子である式(IIb)で表される化合物又はその塩（例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩等）を得ることができる。

[0198] 反応式3

[化12]



[0199] (式(VII)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びJ³は前記と同じ意味を表す。式(XV)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びJ³は上記と同じ意味を表す。式(IIc)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びR⁶は上記と同じ意味を表す。)

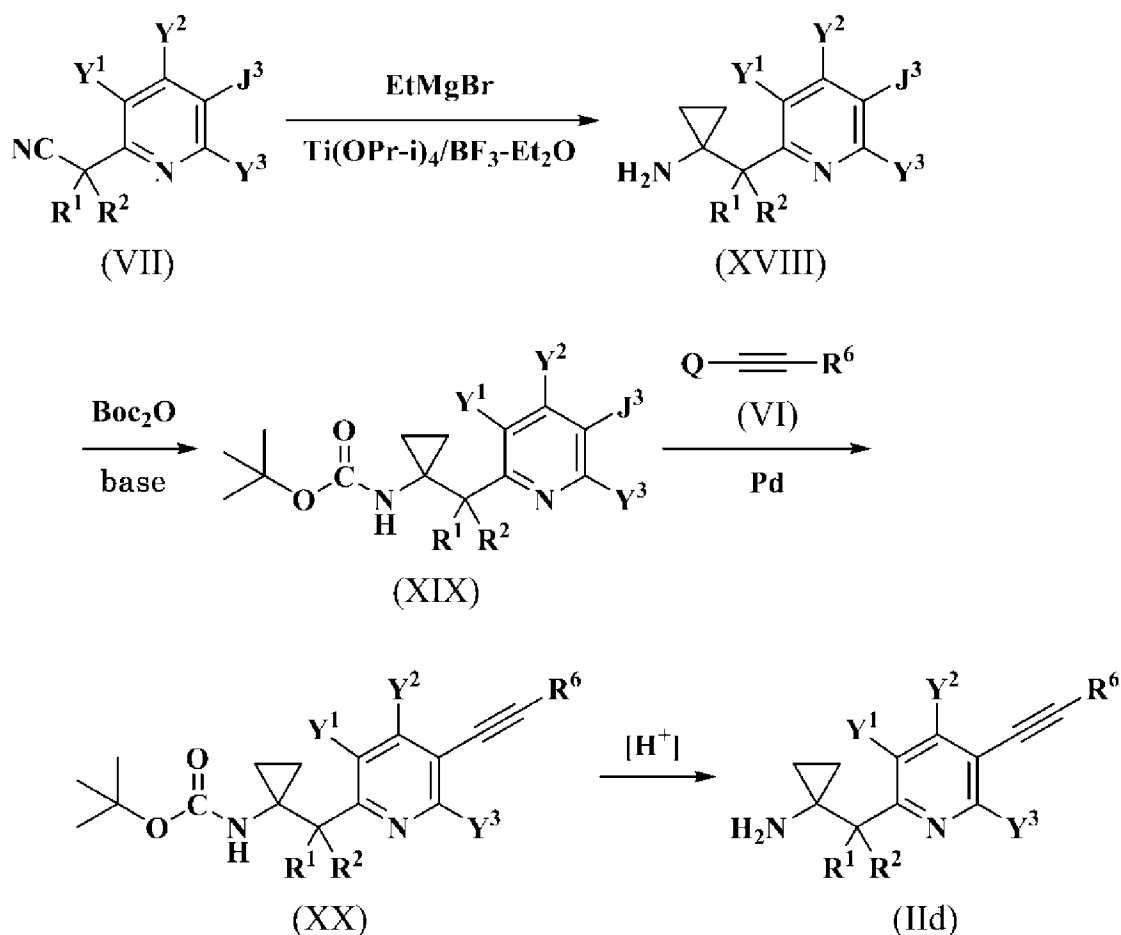
式(VII)で表される化合物を、例えばシンセシス [Synthesis] 2006年、4143頁等に記載の方法に準じて三塩化セリウム存在下メチルリチウム反応剤と反応させるか、又はシンレット [Synlett] 2007年、652頁等

に記載の方法に準じてチタニウム(IV)テトライソプロポキシド存在下メチルグリニャール反応剤と反応させることにより、式(XV)で表される化合物を合成することができる。

[0200] このようにして得られた式(XV)で表される化合物を反応式1と同様にして反応させることにより、式(II)においてR³及びR⁴がメチルであり、R⁵が水素原子である式(IIc)で表される化合物又はその塩（例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩等）を得ることができる。

[0201] 反応式4

[化13]



[0202] (式(VII)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びJ³は前記と同じ意味を表す。式(XVII I)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びJ³は上記と同じ意味を表す。式(IIc)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びR⁶は上記と同じ意味を表す。)

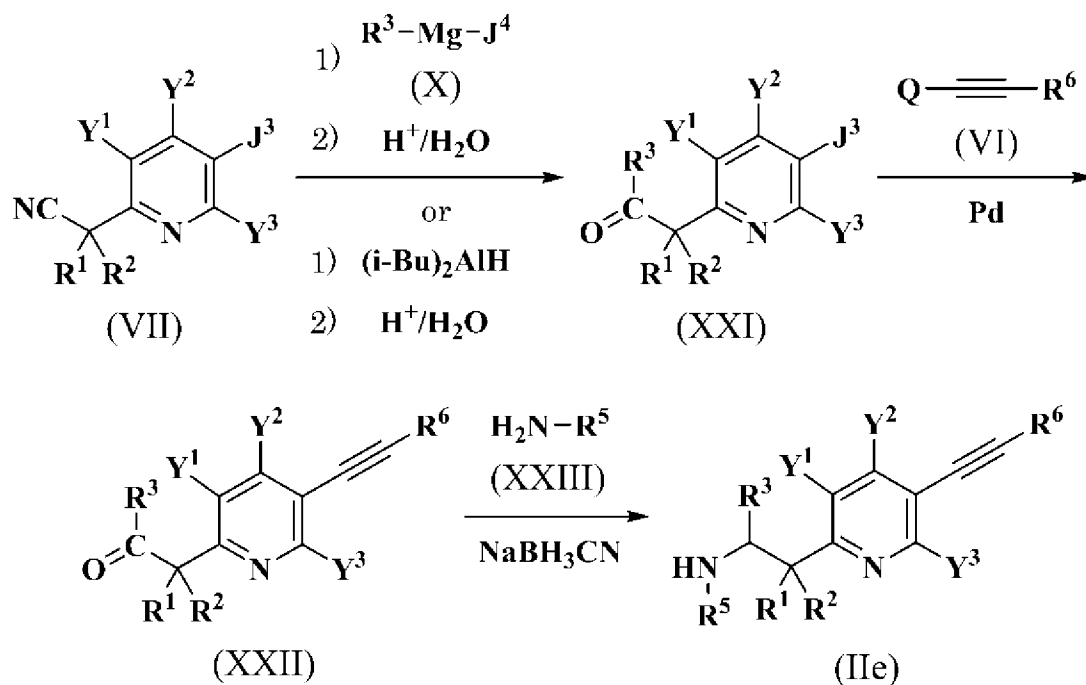
式(VII)で表される化合物を、例えばケミカル・コミュニケーションズ [Ch

em. Commun.] 2001年、1792頁等に記載の方法に準じてチタニウム(I V)テトライソプロポキシド及び三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体存在下エチルグリニャール反応剤と反応させることにより、式(XVIII)で表される化合物を合成することができる。

[0203] このようにして得られた式(XVIII)で表される化合物を反応式1と同様にして反応させることにより、式(II)においてR³及びR⁴が一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R³及びR⁴が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成し、R⁵が水素原子である式(II d)で表される化合物又はその塩(例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩等)を得ることができる。

[0204] 反応式5

[化14]



[0205] (式(VII)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びJ³は前記と同じ意味を表す。式(XXI)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R², R³及びJ³は上記と同じ意味を表す。式(VI)中、R⁶は前記と同じ意味を表し、Qは水素原子、トリメチルシリル等を表す。式(XXI)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R², R³及びR⁶は上記と同じ意味を表す。式(XXIII)中、R⁵はC₁~C₄ハロアルキルチオ、-C(O)R⁹及びC₁~C₄アルコキシカルボニル以外の前記と同じ意味を表す。式(IIe)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R², R³, R⁵

及びR⁶は上記と同じ意味を表す。)

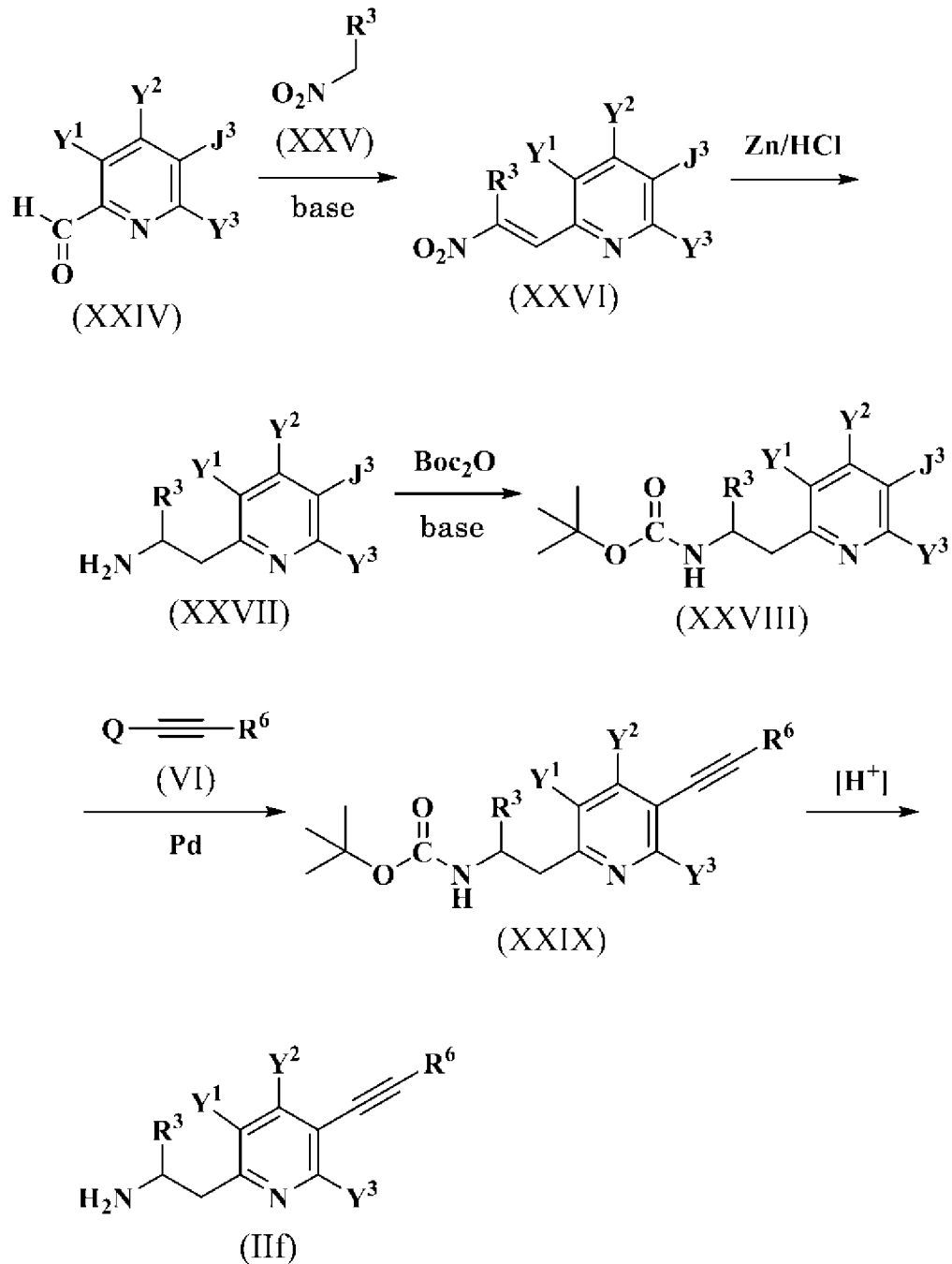
式(VII)で表される化合物を、例えばケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン [Chem. Pharm. Bull.] 1986年、34巻、4653頁等に記載の方法に準じて式(X) [式中、R³及びJ⁴は前記と同じ意味を表す。] で表される公知のグリニャール反応剤と反応させた後加水分解するか、又は、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1981年、46巻、4600頁等に記載の方法に準じてジイソブチルアルミニウムヒドリドと反応させた後加水分解することにより、式(XXI)で表される化合物を合成することができる。

[0206] 次いで、式(XXI)で表される化合物を式(VI)で表される置換アセチレンと、例えばテトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 2012年、53巻、4117頁、テトラヘドロン [Tetrahedron] 2005年、61巻、2697頁等に記載の菌頭カップリングの反応条件を用いて反応させることにより、式(XXII)で表される化合物を合成することができる。

[0207] このようにして得られた式(XXII)で表される化合物を、例えばヨーロッパアン・ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [Eur. J. Med. Chem.] 2009年、44巻、4862頁等に記載の方法に準じてシアノ水素化ホウ素ナトリウム等の還元剤存在下、式(XXIII)で表される公知のアミン又はそれらの塩（例えば塩酸塩、酢酸塩等）と反応させることにより、式(II)においてR⁴が水素原子である式(IIe)で表される化合物を得ることができる。

[0208] 反応式6

[化15]



[0209] (式(XXIV)中、Y¹、Y²、Y³及びJ³は前記と同じ意味を表す。式(XXV)中、R³は前記と同じ意味を表す。式(XXVI)中、Y¹、Y²、Y³、R³及びJ³は上記と同じ意味を表す。式(XXVII)中、Y¹、Y²、Y³、R³及びJ³は上記と同じ意味を表す。式(IIf)中、Y¹、Y²、Y³、R³及びR⁶は上記と同じ意味を表す。)

式(XXIV)で表される化合物を、例えばジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・

ソサイエティー・パーキン・トランスアクションズ、1 [J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1] 1979年、643頁等に記載の方法に準じて式(XXV)で表される公知のニトロアルカン誘導体と反応させることにより式(XXVI)で表される化合物を合成することができる。

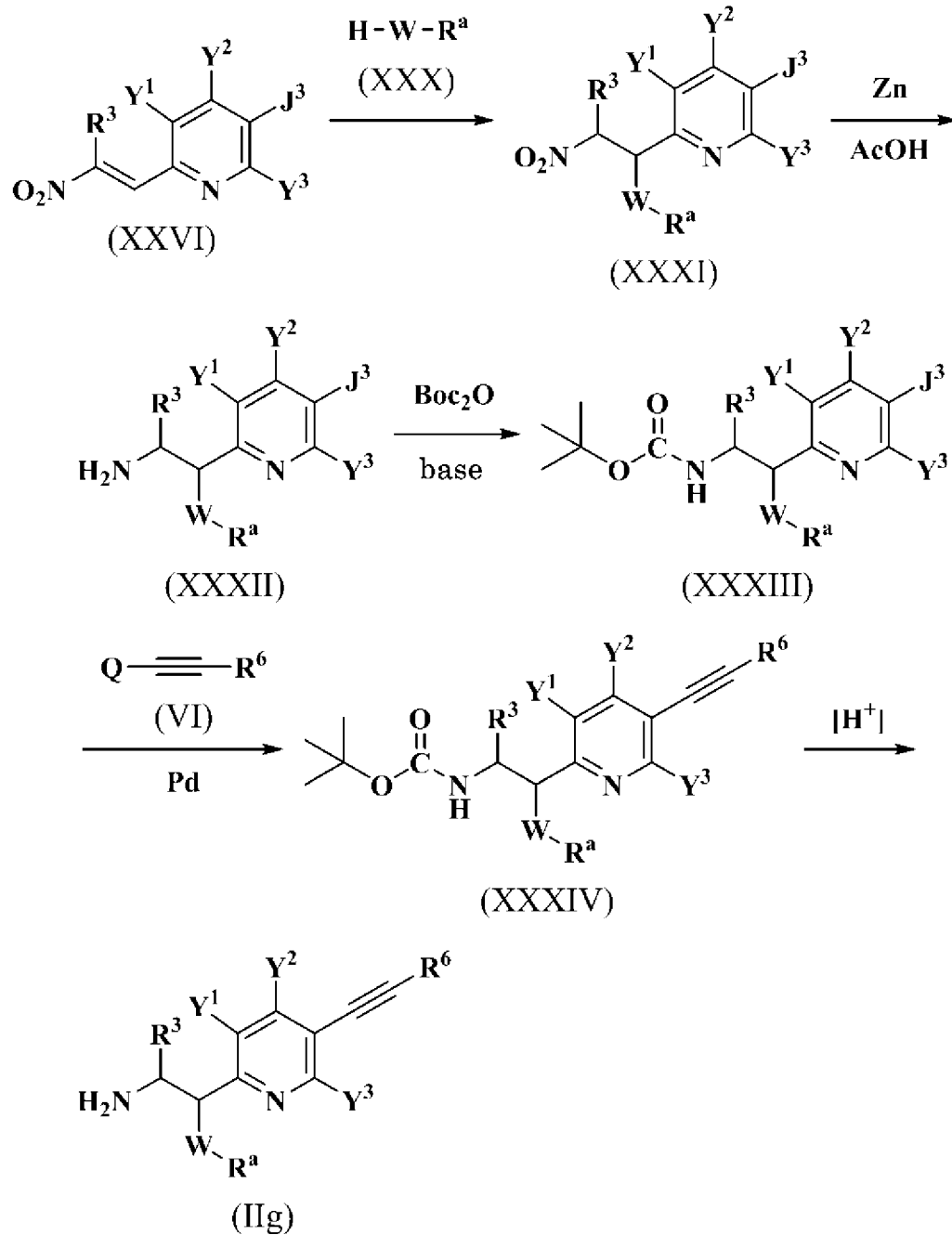
[0210] 次いで、式(XXVI)で表される化合物を、例えばシンレット [Synlett] 2014年、25巻、2891頁等に記載の方法に準じて亜鉛-塩酸等を用いて還元することにより、式(XXVII)で表される化合物を合成することができる。

[0211] このようにして得られた式(XXVII)で表される化合物を反応式1と同様にして反応させることにより、式(II)において R^1 , R^2 , R^4 及び R^5 が水素原子である式(IIf)で表される化合物又はその塩（例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩等）を得ることができる。

ここで用いられる式(XXIV)で表される化合物の或ものは公知化合物であり、一部は市販品としても入手できる。また、それ以外のものも公知化合物に関する文献記載の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

[0212] 反応式7

[化16]



[0213] (式(XXVI)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 及び J^3 は前記と同じ意味を表す。式(XXX)中、 W は酸素原子、硫黄原子又は $-\text{NH}-$ を表し、 R^a は $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ アルキニル、 $(\text{Z})_m$ によって置換されたフェニル($\text{C}_1\sim\text{C}_4$)アルキル等を表す。式(XXXI)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , W , R^a , R^3 及び J^3 は上記と同じ意味を表す。式(XXXII)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , W , R^a , R^3 及び J^3 は上記と同じ意味を表す。式(XXXIII)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , W , R^a , R^3 及び J^3 は上記と同じ意味を表す。式(XXXIV)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , W , R^a , R^3 及び R^6 は

上記と同じ意味を表す。)

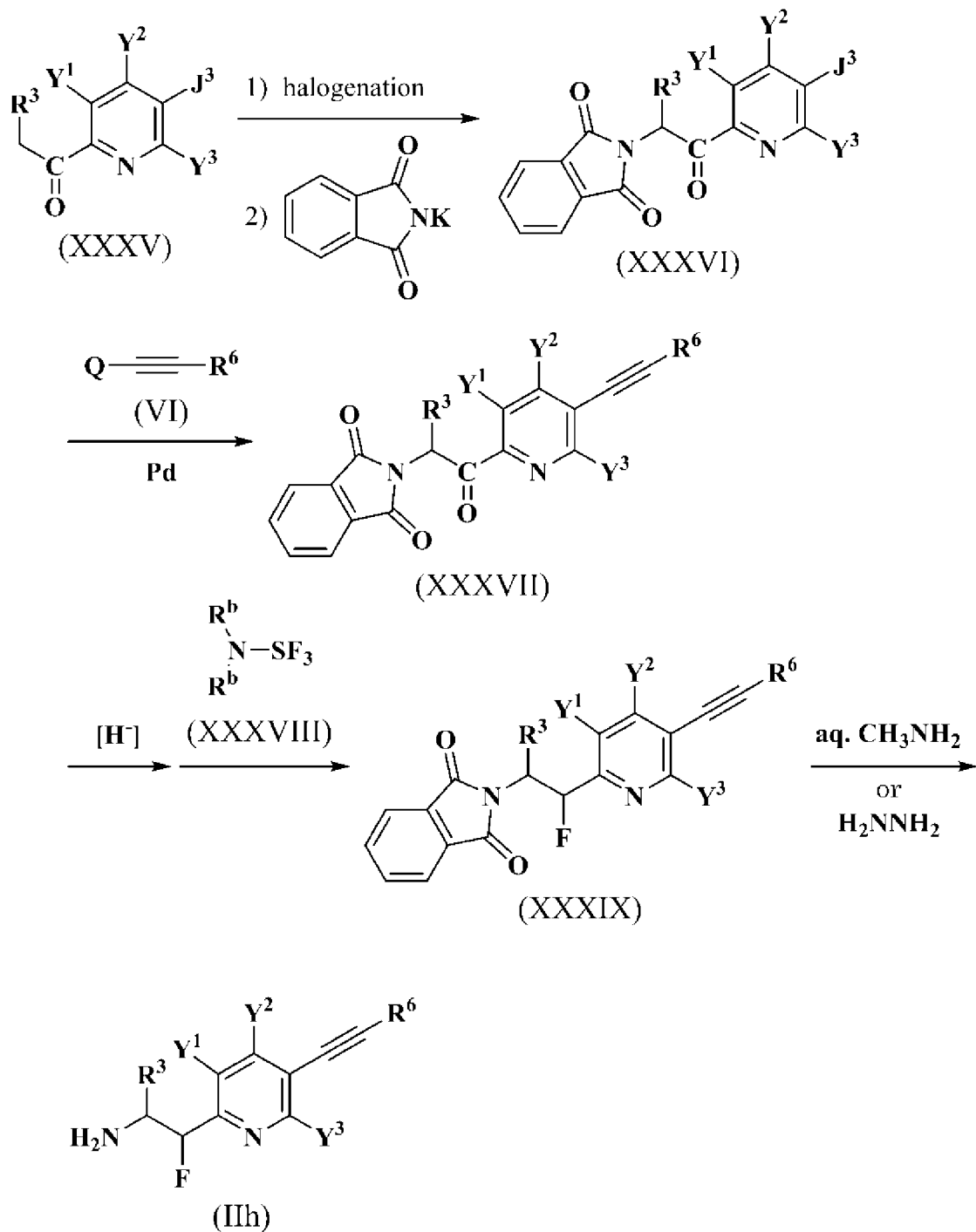
反応式6の合成中間体である式(XXVI)で表される化合物と式(XXX)で表される公知のアルコール類、チオール類又はアルコキシアミン類とを、例えばテトラヘドロン [Tetrahedron] 2012年、68巻、1521頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 2008年、49巻、1244頁、ヨーロッパアン・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [Eur. J. Org. Chem.] 2010年、5482頁等に記載の方法に準じて反応させることにより式(XXXI)で表される化合物を合成することができる。

[0214] 次いで、式(XXXI)で表される化合物を、例えばブレティン・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティー・オブ・ジャパン [Bull. Chem. Soc. Jpn.] 2014年、87巻、127頁等に記載の方法に準じて亜鉛-酢酸等を用いて還元することにより、式(XXXII)で表される化合物を合成することができる。

[0215] このようにして得られた式(XXXII)で表される化合物を反応式1と同様にして反応させることにより、式(II)において R^1 が $-W-R^a$ であり、 R^2 , R^4 及び R^5 が水素原子である式(IIg)で表される化合物又はその塩（例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩等）を得ることができる。

[0216] 反応式8

[化17]



[0217] (式(XXXV)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 及び J^3 は前記と同じ意味を表す。式(XXXVI)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 及び J^3 は上記と同じ意味を表す。式(VI)中、 R^6 は前記と同じ意味を表し、 Q は水素原子、トリメチルシリル、 $-ZnCl$ 、 $-ZnBr$ 又は $-ZnI$ 等を表す。式(XXXVII)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 及び R^6 は上記と同じ意味を表す。式(XX

XVIII)中、R^bはエチル、2-メトキシエチル等を表す。式(XXXIX)中、Y¹, Y², Y³, R³及びR⁶は上記と同じ意味を表す。式(IIh)中、Y¹, Y², Y³, R³及びR⁶は上記と同じ意味を表す。)

式(XXXV)で表される化合物を、例えば国際特許出願公報(WO 2014/010737号公報)等に記載の方法に準じてハロゲン化した後フタルイミドカリウムと反応させることにより、式(XXXVI)で表される化合物を合成することができる。

[0218] このようにして得られた式(XXXVI)で表される化合物を、式(VI)で表される置換アセチレンと製造法Cと同様にして反応させることにより、式(XXXVII)で表される化合物を合成することができる。

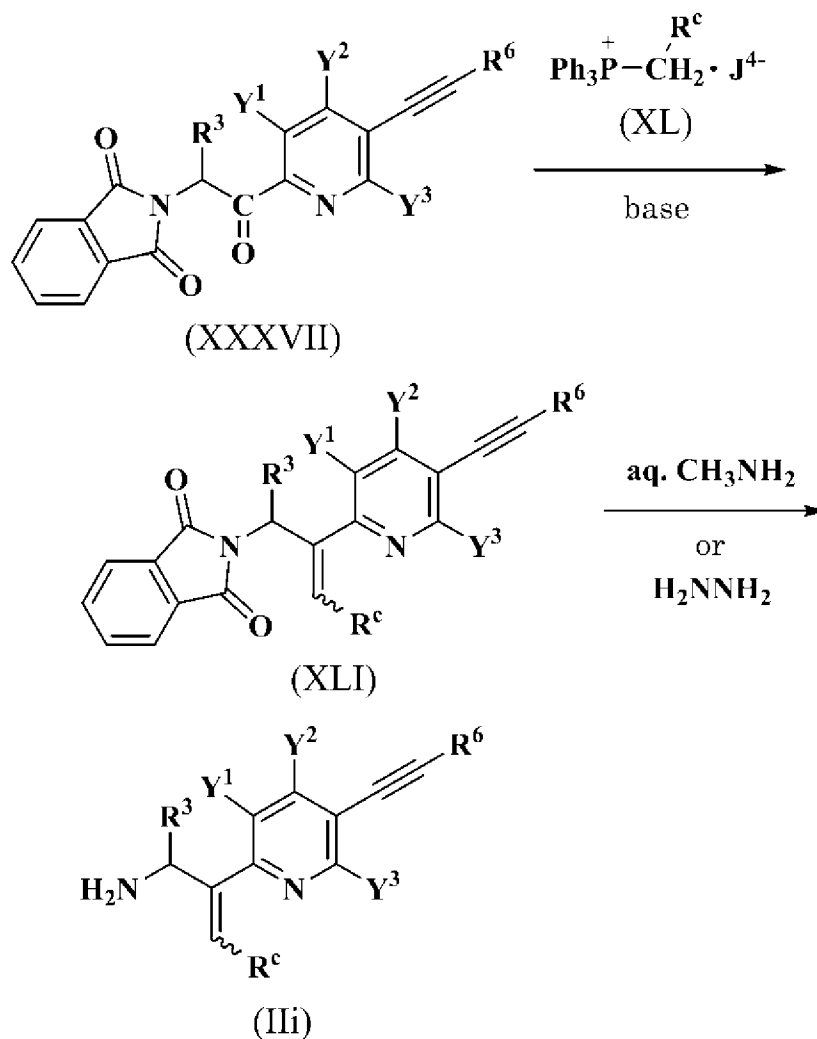
[0219] 次に、式(XXXVII)で表される化合物を、例えば国際特許出願公報(WO 2013/003740号公報)等に記載の方法に準じて水素化ホウ素ナトリウム等の還元剤を用いて還元した後、式(XXXVIII)で表される公知のフッ素化剤と反応させることにより、式(XXXIX)で表される化合物を合成することができる。

[0220] このようにして得られた式(XXXIX)で表される化合物を、必要ならばトルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、水又はそれらの2種類以上の任意の割合の混合物等を溶媒として用い、必要ならば窒素、アルゴン等の不活性ガス雰囲気下、式(XXXIX)で表される化合物1モル当量に対して1~4モル当量のメチルアミン水溶液、ヒドラジン水溶液又はヒドラジン-水和物と室温~反応混合物の還流温度の温度範囲で1~24時間反応させることにより、式(II)においてR¹がフッ素原子を表し、R², R⁴及びR⁵が水素原子である式(IIh)で表される化合物を得ることができる。

[0221] ここで用いられる式(XXXV)で表される化合物の或ものは公知化合物であり、一部は市販品としても入手できる。また、それ以外のものも公知化合物に関する文献記載の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

[0222] 反応式9

[化18]



[0223] (式(XXXVII)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 及び R^6 は前記と同じ意味を表す。式(XL)中、 R^c は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ等を表し、 J^4 は前記と同じ意味を表す。式(XLI)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 , R^6 及び R^c は上記と同じ意味を表す。式(III)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 , R^6 及び R^c は上記と同じ意味を表す。)

反応式8の合成中間体である式(XXXVII)で表される化合物を、例えばアンゲヴァンテ・ヘミー・インターナショナル・エディション[Angew. Chemie, Int. Ed.]2011年、50巻、2593頁、オーガニック・レターズ [Organic Lett.] 2007年、9巻、5219頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1993年、58巻、6509頁、

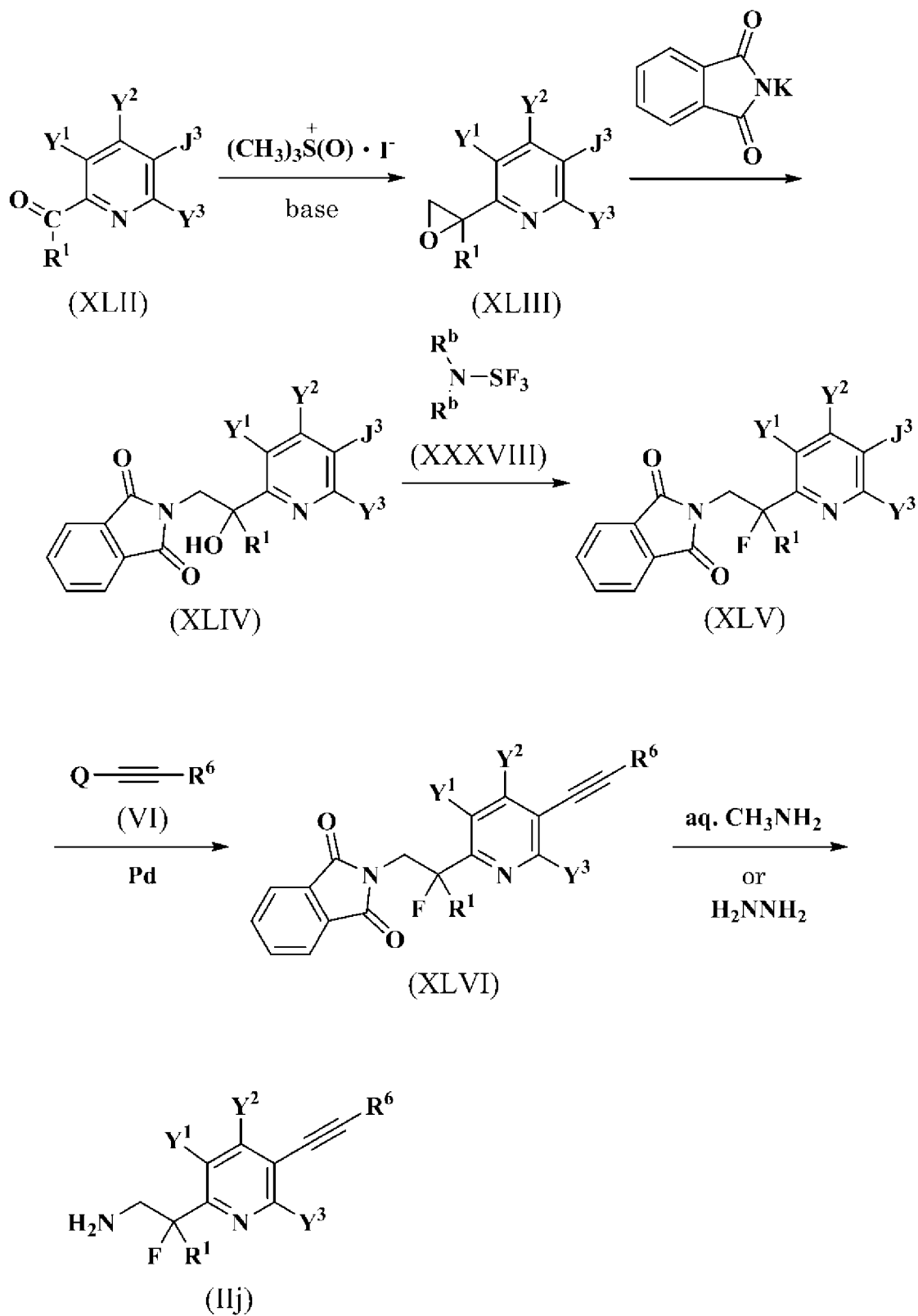
テトラヘドロン [Tetrahedron] 2010年、66巻、3499頁、ヨーロッパ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [Eur. J. Org. Chem.] 2007年、266頁等に記載の方法に準じて、例えばカリウム tert-ブトキシド、ナトリウムヘキサメチルジシラジド、リチウムジイソプロピルアミド、アルキルリチウム等の強塩基存在下、式(XL)で表される化合物と反応させることにより、式(XLI)で表される化合物を合成することができる。

[0224] このようにして得られた式(XLI)で表される化合物を、反応式8と同様にしてメチルアミン水溶液、ヒドラジン水溶液又はヒドラジン-水和物等と反応させることにより、式(II)においてR¹とR²とが一緒になってC₁~C₆アルキリデン、C₁~C₆ハロアルキリデン又はC₁~C₄アルコキシ(C₁~C₂)アルキリデンを形成し、R⁴及びR⁵が水素原子である式(IIi)で表される化合物を得ることができる。

ここで用いられる式(XL)で表される化合物の或ものは公知化合物であり、一部は市販品としても入手できる。また、それ以外のものも公知化合物に関する文献記載の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

[0225] 反応式10

[化19]



[0226] (式(XLII)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 及び J^3 は前記と同じ意味を表し、 R^1 は $C_1\sim C_6$ アル

キル等を表す。式(XLIII)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 及び J^3 は上記と同じ意味を表す。式(XLIV)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 及び J^3 は上記と同じ意味を表す。式(XXXVIII)中、 R^b は前記と同じ意味を表す。式(XLV)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 及び J^3 は上記と同じ意味を表す。式、式(VI)中、 R^6 は前記と同じ意味を表し、 Q は水素原子、トリメチルシリル、 $-ZnCl$ 、 $-ZnBr$ 又は $-ZnI$ 等を表す。式(XLVI)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 及び R^6 は上記と同じ意味を表す。式(IIj)中、 Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 及び R^6 は上記と同じ意味を表す。)

式(XLII)で表される化合物を、例えばシンセティック・コミュニケーションズ [Synth. Commun.] 2003年、33巻、2135頁等に記載の方法に準じてトリメチルスルホキソニウムヨード等と反応させることにより、式(XLIII)で表される化合物を合成することができる。

[0227] 次いで、式(XLIII)で表される化合物を、例えば国際特許出願公報 (WO 2006/136821号公報) 等に記載の方法に準じてフタルイミドカリウムと反応させることにより式(XLIV)で表される化合物とした後、例えば国際特許出願公報 (WO 2009/123855号公報) 等に記載の方法に準じて式(XXXVIII)で表される公知のフッ素化剤と反応させることにより、式(XLV)で表される化合物を合成することができる。

[0228] このようにして得られた式(XLV)で表される化合物を、式(VI)で表される置換アセチレンと製造法Cと同様にして反応させることにより、式(XLVI)で表される化合物を合成することができる。

次いで、式(XLVI)で表される化合物を反応式8と同様にしてメチルアミン水溶液、ヒドラジン水溶液又はヒドラジン-水和物と反応させることにより、式(II)において R^2 がフッ素原子であり、 R^3 , R^4 及び R^5 が水素原子である式(IIj)で表される化合物を得ることができる。

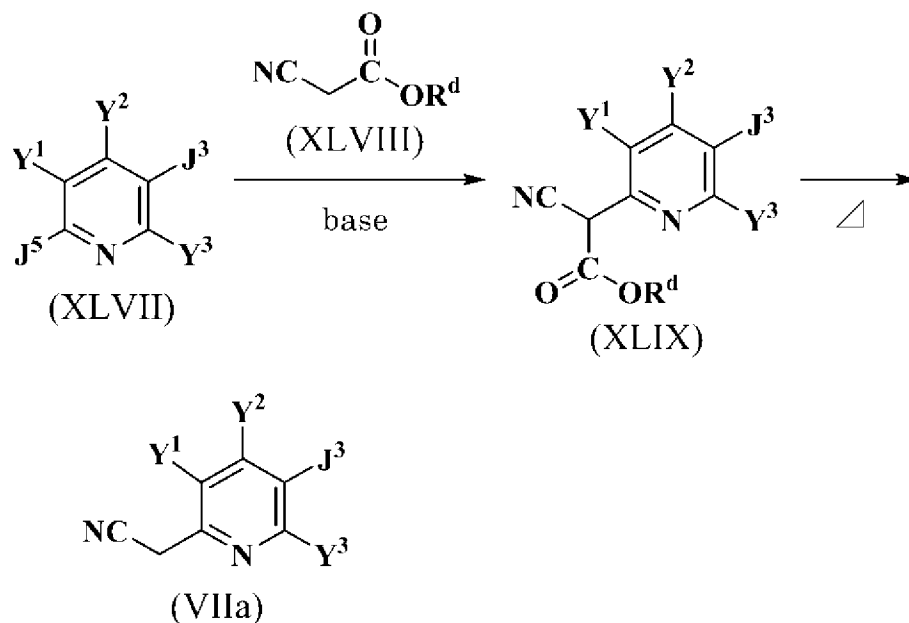
[0229] ここで用いられる式(XLII)で表される化合物の或ものは公知化合物であり、一部は市販品としても入手できる。また、それ以外のものも公知化合物に関する文献記載の一般的な合成方法に準じて容易に合成することができる。

[0230] 反応式1～反応式5で用いられる式(VIII)で表される化合物は、例えば次

の反応式 11～反応式 15 のようにして合成することができる。

反応式 11

[化20]



[0231] (式(XLVII)中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及び J^3 は前記と同じ意味を表し、 J^5 はハロゲン原子を表す。式(XLVIII)中、 R^d は C_1 ～ C_4 アルキルを表す。式(XLIX)中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 J^3 及び R^d は上記と同じ意味を表す。式(VIIa)中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及び J^3 は上記と同じ意味を表す。)

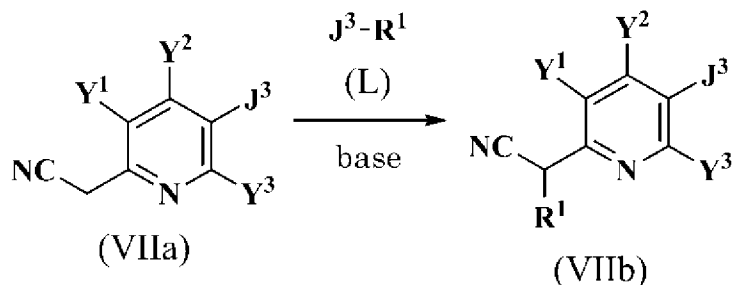
式(XLVII)で表される化合物を、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 2008年、73巻、1643頁、バイオオーガニック・アンド・メディシナル・ケミストリー・レターズ[Bioorganic & Med. Chem. Lett.] 2009年、19巻、4484頁等に記載の方法に準じて公知の式(XLVIII)で表されるシアノ酢酸エステルと反応させることにより、式(XLIX)で表される化合物を合成することができる。

次いで、式(XLIX)で表される化合物を、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 2005年、48巻、2167頁、シンセシス [Synthesis] 2010年、3332頁等に記載の方法に準じて加熱脱炭酸することにより、式(VII)において R^1 及び R^2 が水素原子である式(VIIa)で表される化合物を合成することができる。

ここで用いられる式(XLVII)で表される化合物の或ものは公知化合物であり、一部は市販品としても入手できる。また、それ以外のものも公知化合物に関する文献記載の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

[0232] 反応式 1 2

[化21]

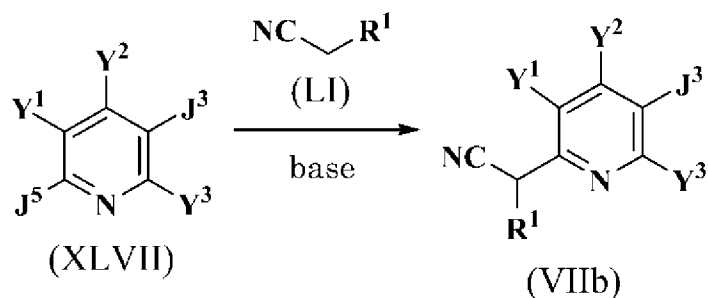


(式(VIIa)中、Y¹, Y², Y³及びJ³は前記と同じ意味を表す。式(L)中、J³は前記と同じ意味を表し、R¹はC₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、(Z)_mによって置換されたフェニル(C₁~C₄)アルキル等を表す。式(VIIb)中、Y¹, Y², Y³, R¹及びJ³は上記と同じ意味を表す。)

[0233] 式(VIIa)で表される化合物を、例えばジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー [J. Heterocyclic Chem.] 1987年、24巻、1061頁等に記載の方法に準じて公知の式(L)で表される化合物と反応させることにより、式(VII)においてR²が水素原子である式(VIIb)で表される化合物を合成することができる。

[0234] 反応式 1 3

[化22]



(式(XLVII)中、Y¹, Y², Y³, J³及びJ⁵は前記と同じ意味を表す。式(LI)中、R¹はハロゲン原子以外の前記と同じ意味を表す。式(VIIb)中、Y¹, Y², Y³, R

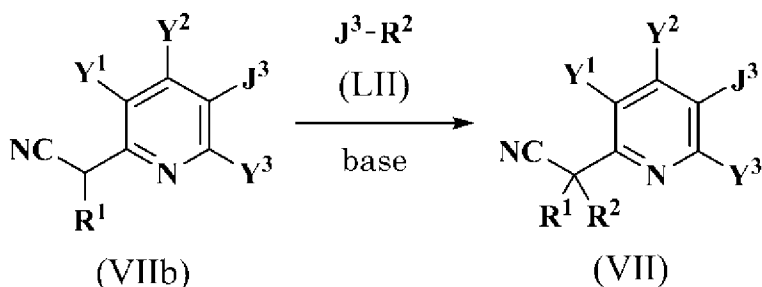
¹及びJ³は上記と同じ意味を表す。)

式(XLVII)で表される化合物を、例えばジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー [J. Heterocyclic Chem.] 1987年、24巻、1061頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 2005年、70巻、10186頁等に記載の方法に準じて式(LI)で表される化合物と反応させることにより、式(VII)においてR²が水素原子である式(VIIb)で表される化合物を合成することもできる。

[0235] ここで用いられる式(LI)で表される化合物の或ものは公知化合物であり、一部は市販品としても入手できる。また、それ以外のものも公知化合物に関する文献記載の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

[0236] 反応式14

[化23]

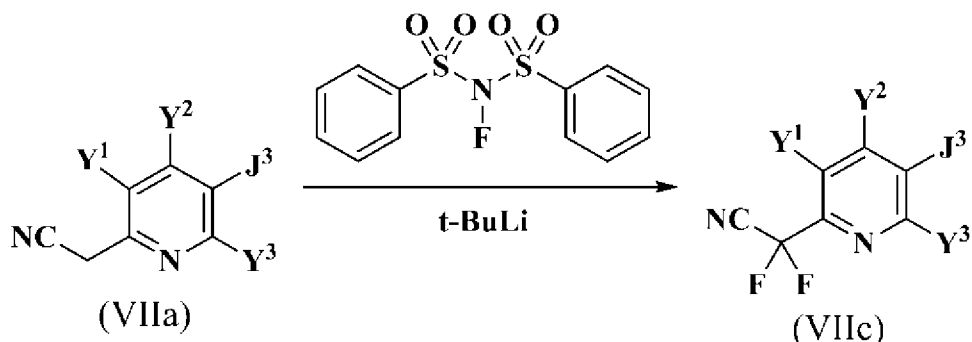


(式(VIIb)中、Y¹, Y², Y³, R¹及びJ³は前記と同じ意味を表す。式(LII)中、J³は前記と同じ意味を表し、R²はC₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル等を表す。式(VII)中、Y¹, Y², Y³, R¹, R²及びJ³は上記と同じ意味を表す。)

式(VIIb)で表される化合物を、例えばヨーロッパアン・ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [Eur. J. Med. Chem.] 2004年、39巻、993頁等に記載の方法に準じて公知の式(LII)で表される化合物と反応させることにより、式(VII)で表される化合物を合成することができる。

[0237] 反応式15

[化24]

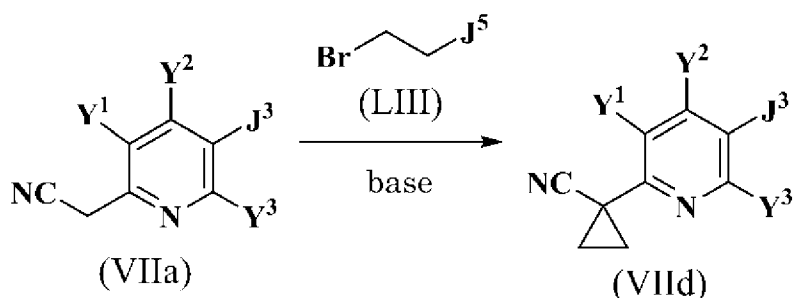


(式(VIIa)中、Y¹, Y², Y³及びJ³は前記と同じ意味を表す。式(VIIc)中、Y¹, Y², Y³及びJ³は上記と同じ意味を表す。)

式(VIIa)で表される化合物を、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1998年、63巻、8052頁等に記載の方法に準じて、tert-ブチルリチウム等の強塩基存在下、N-フルオロベンゼンスルホン酸イミド等のフッ素化剤と反応させることにより、式(VII)においてR¹及びR²がフッ素原子である式(VIIc)で表される化合物を合成することができる。

[0238] 反応式 16

[化25]



(式(VIIa)中、Y¹, Y², Y³及びJ³は前記と同じ意味を表す。式(LIII)中、J⁵は前記と同じ意味を表す。式(VIIId)中、Y¹, Y², Y³及びJ³は上記と同じ意味を表す。)

式(VIIa)で表される化合物を、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 2010年、53巻、6003頁等に記載の方法に準じて公知の式(LIII)で表される化合物と反応させることにより、式(

VII)において R^1 と R^2 とが一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成する式(VIIId)で表される化合物を合成することができる。

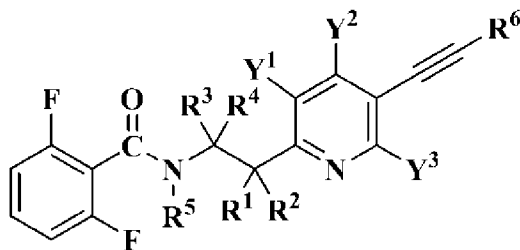
[0239] 上記の各反応においては、反応終了後、通常の後処理を行なうことにより、製造法A～製造法Cの原料化合物となる各々の製造中間体を得ることができる。

また、これらの方法により製造された各々の製造中間体は、単離・精製することなく、それぞれそのまま次工程の反応に用いることもできる。

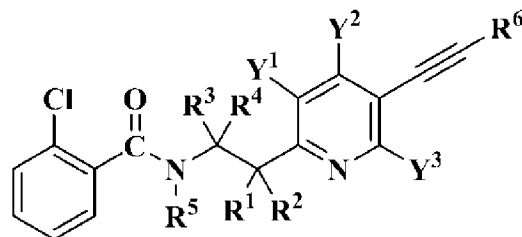
[0240] これらの方法を用いて製造できる本発明に包含される式(I)で表されるアルキニルピリジン置換アミド化合物としては、具体的に例えば下記の[1]-1～[1]-50の構造式で表される化合物が挙げられる。但し、[1]-1～[1]-50の構造式で表される化合物は例示のためのものであって、本発明に包含されるアルキニルピリジン置換アミド化合物はこれらのみ限定されるものではない。

[0241]

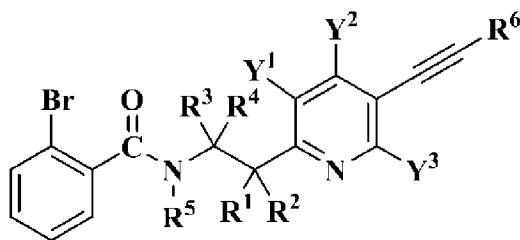
[化26]



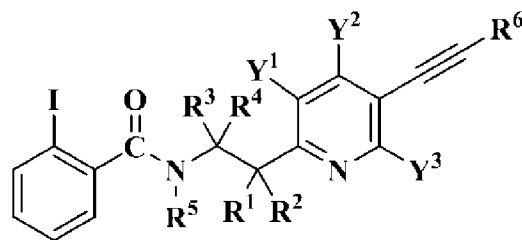
[I] - 1



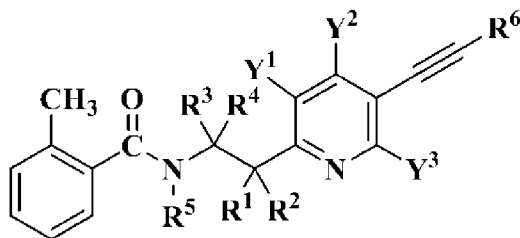
[I] - 2



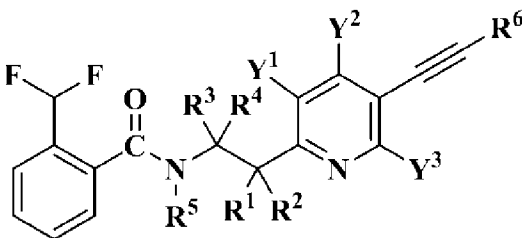
[I] - 3



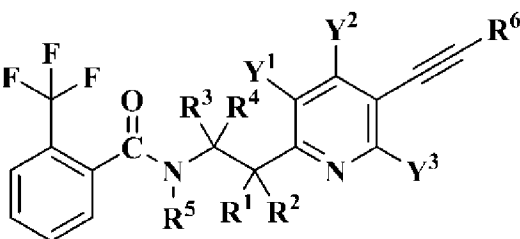
[I] - 4



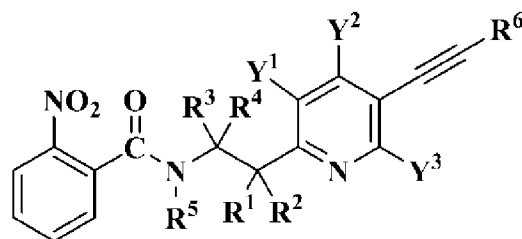
[I] - 5



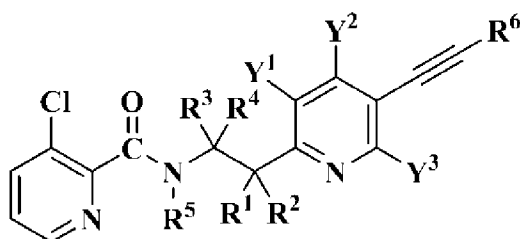
[I] - 6



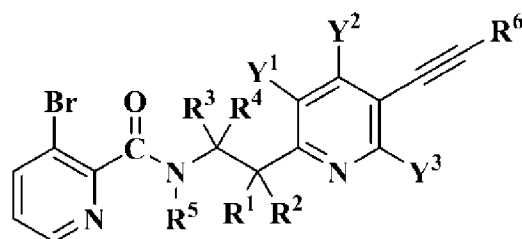
[I] - 7



[I] - 8



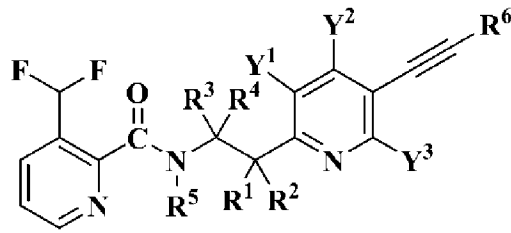
[I] - 9



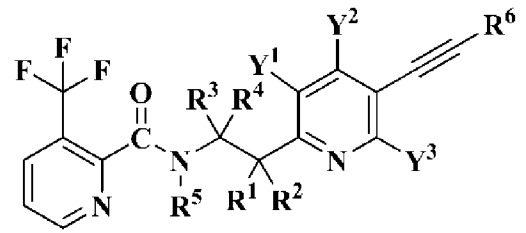
[I] - 10

[0242]

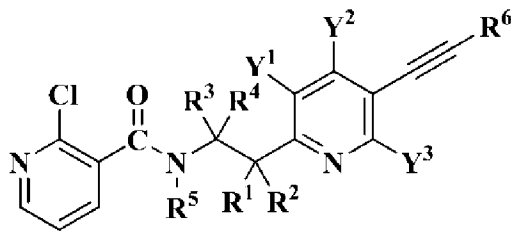
[化27]



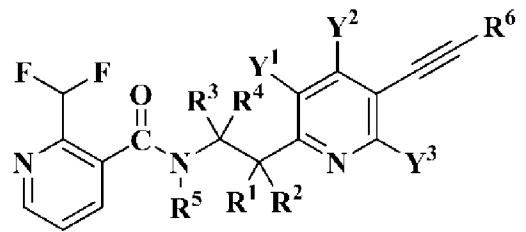
[I] - 11



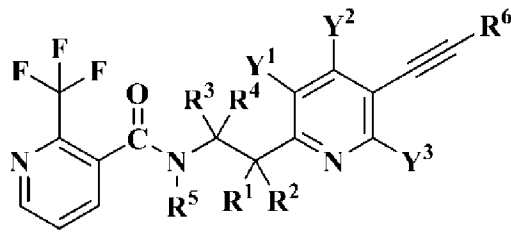
[I] - 12



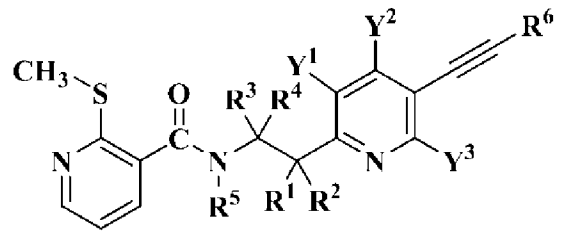
[I] - 13



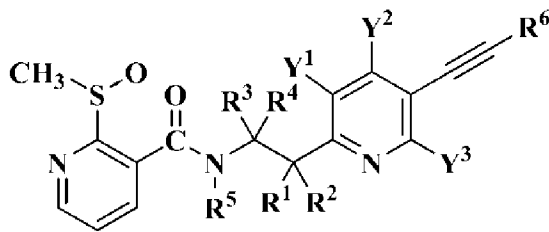
[I] - 14



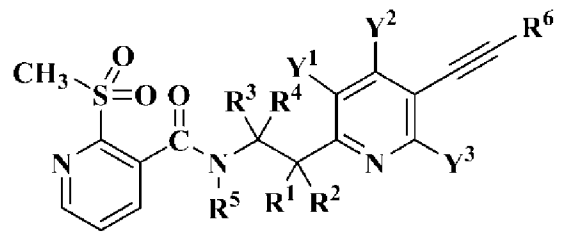
[I] - 15



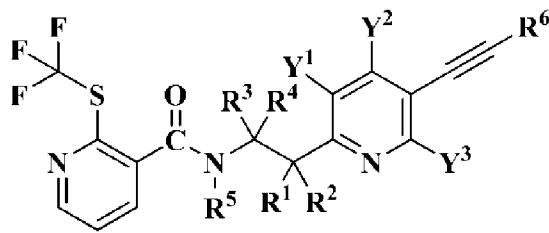
[I] - 16



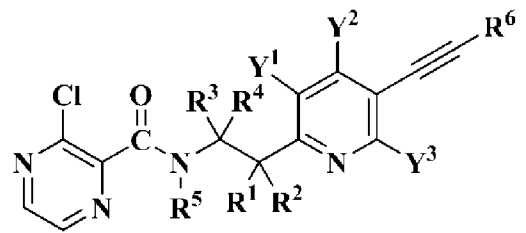
[I] - 17



[I] - 18



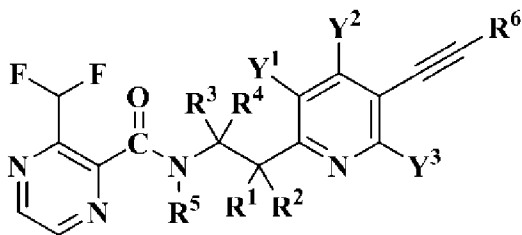
[I] - 19



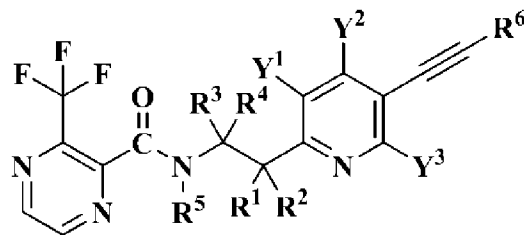
[I] - 20

[0243]

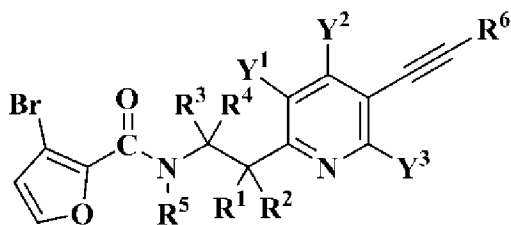
[化28]



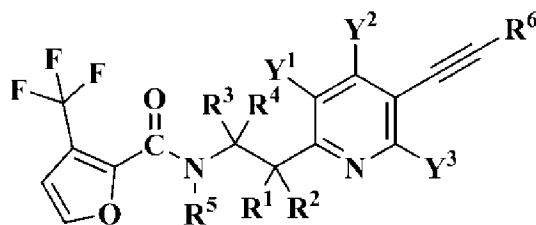
[I] - 21



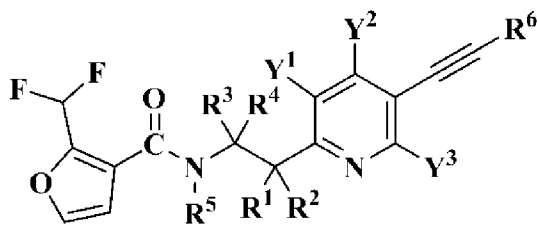
[I] - 22



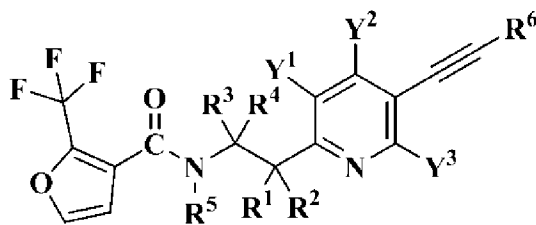
[I] - 23



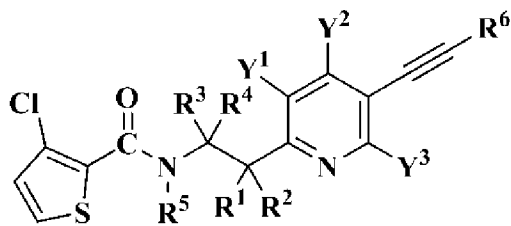
[I] - 24



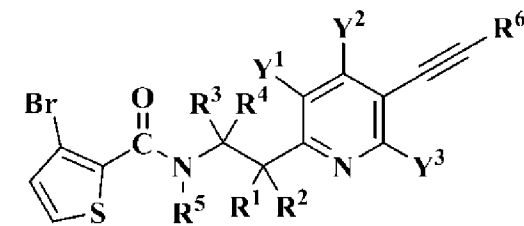
[I] - 25



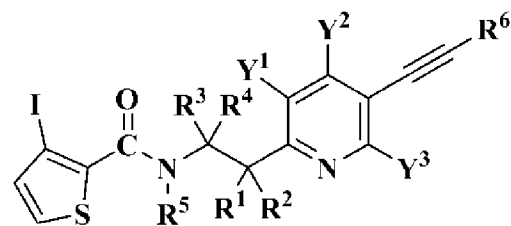
[I] - 26



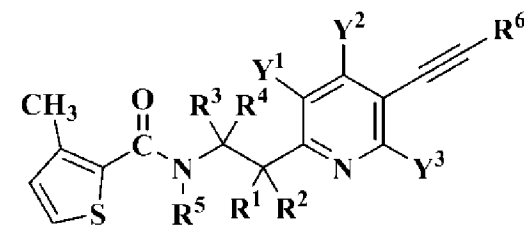
[I] - 27



[I] - 28



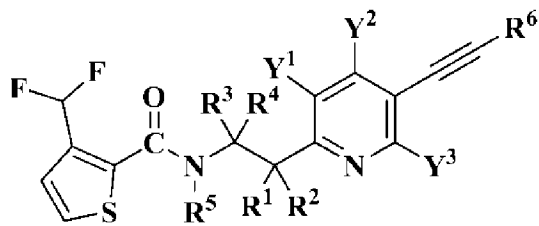
[I] - 29



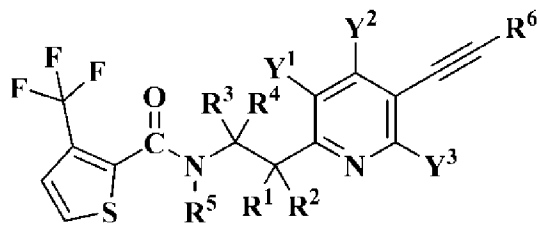
[I] - 30

[0244]

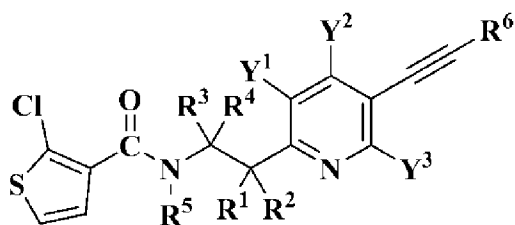
[化29]



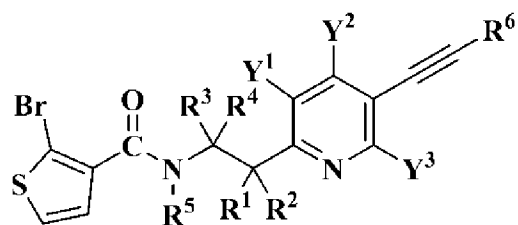
[I] - 31



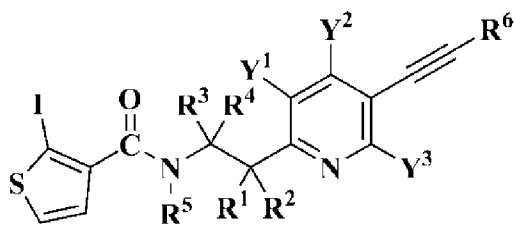
[I] - 32



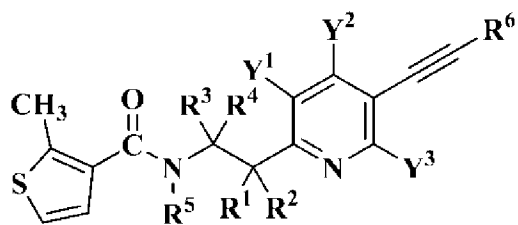
[I] - 33



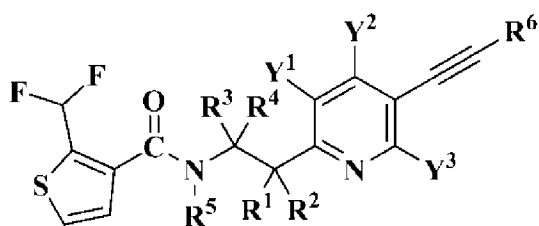
[I] - 34



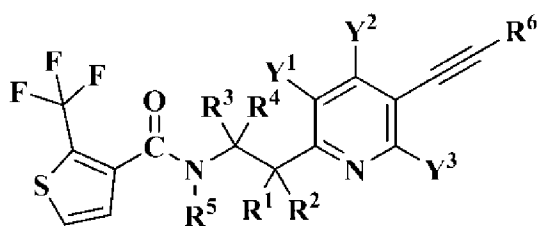
[I] - 35



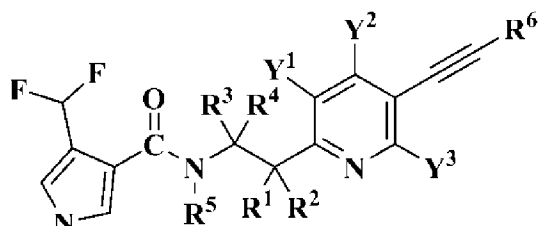
[I] - 36



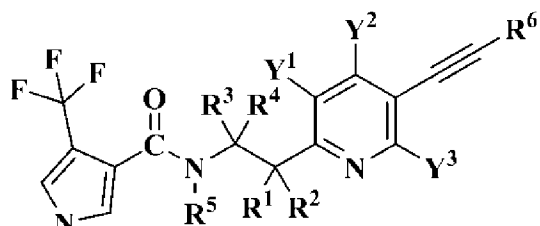
[I] - 37



[I] - 38



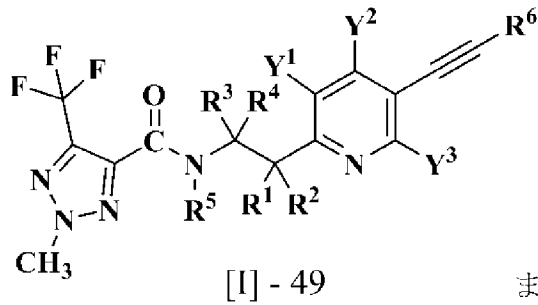
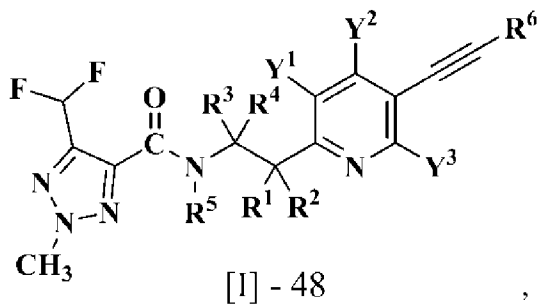
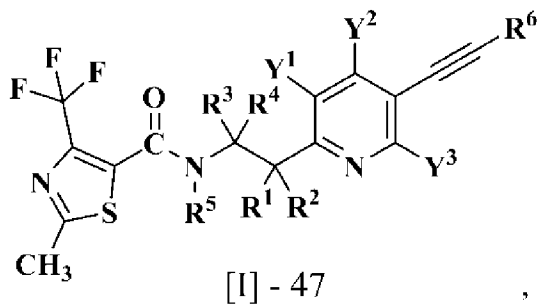
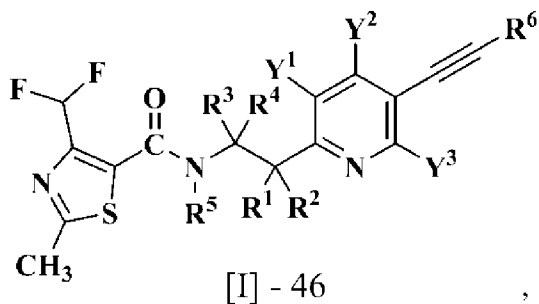
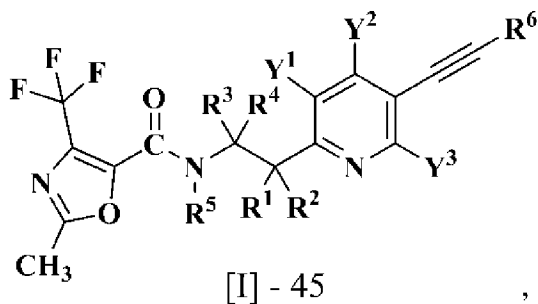
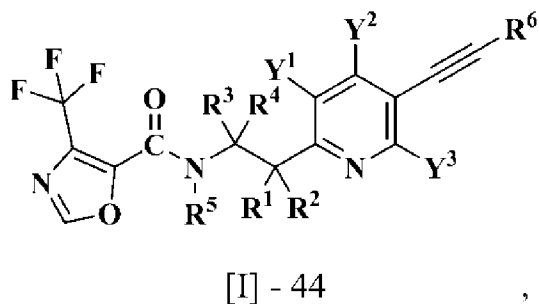
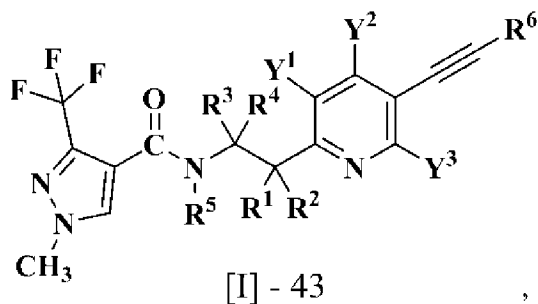
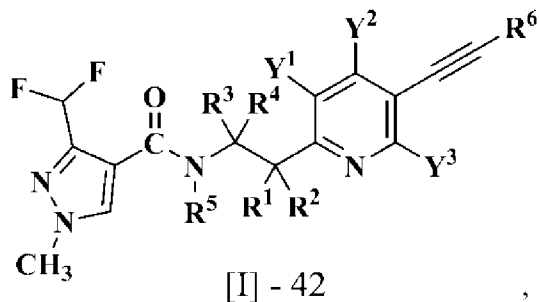
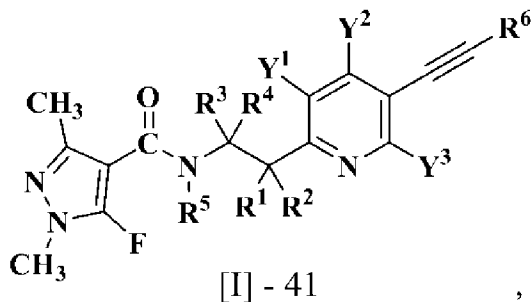
[I] - 39



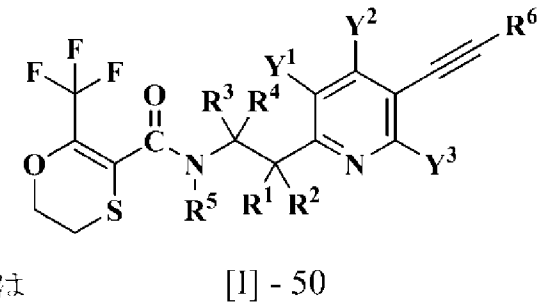
[I] - 40

[0245]

[化30]



または



[0246] ここで、[I]-1～[I]-50の構造式に於いてY¹、Y²、Y³、R¹、R²、R³

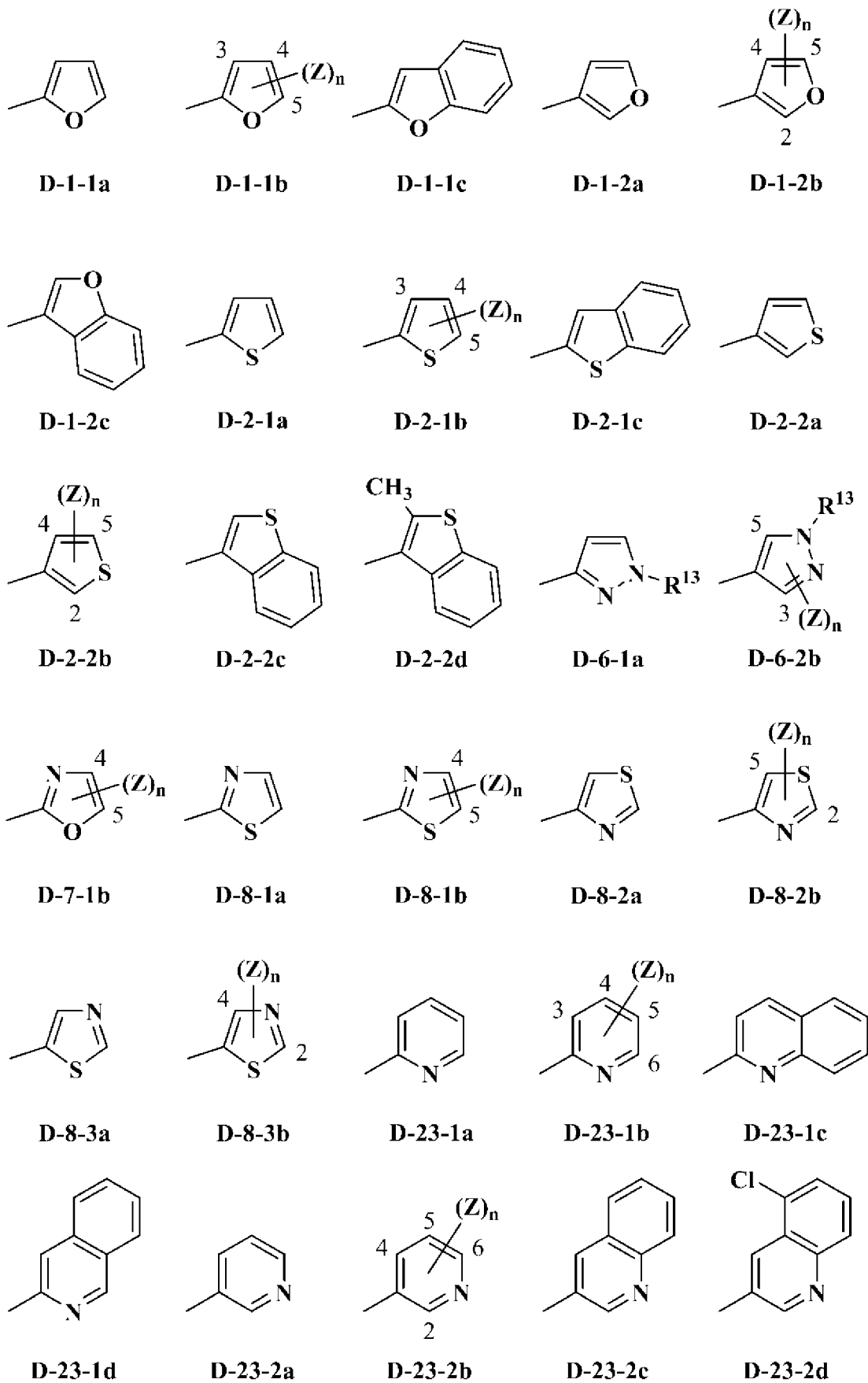
、 R^4 、 R^5 及び R^6 で表される置換基の具体的な組み合わせの例としては、例えば第2表に示す組み合わせが挙げられる。但し、第2表の組み合わせは例示のためのものであって、本発明に包含されるアルキニルピリジン置換アミド化合物の Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 で表される置換基の具体的な組み合わせはこれらのみ限定されるものではない。

[0247] 尚、表中、Etとの記載はエチルを表し、以下同様にn-Prはノルマルプロピルを、i-Pr及びPr-iはイソプロピルを、c-Pr及びPr-cはシクロプロピルを、Bu-sはsec-ブチルを、c-Buはシクロブチルを、t-Bu及びBu-tはtert-ブチルを、Penはペンチルを、c-Penはシクロペンチルを、c-Hexはシクロヘキシルを、Phはフェニルを、1-Naphは1-ナフチルを、2-Naphは2-ナフチルをそれぞれ表し、

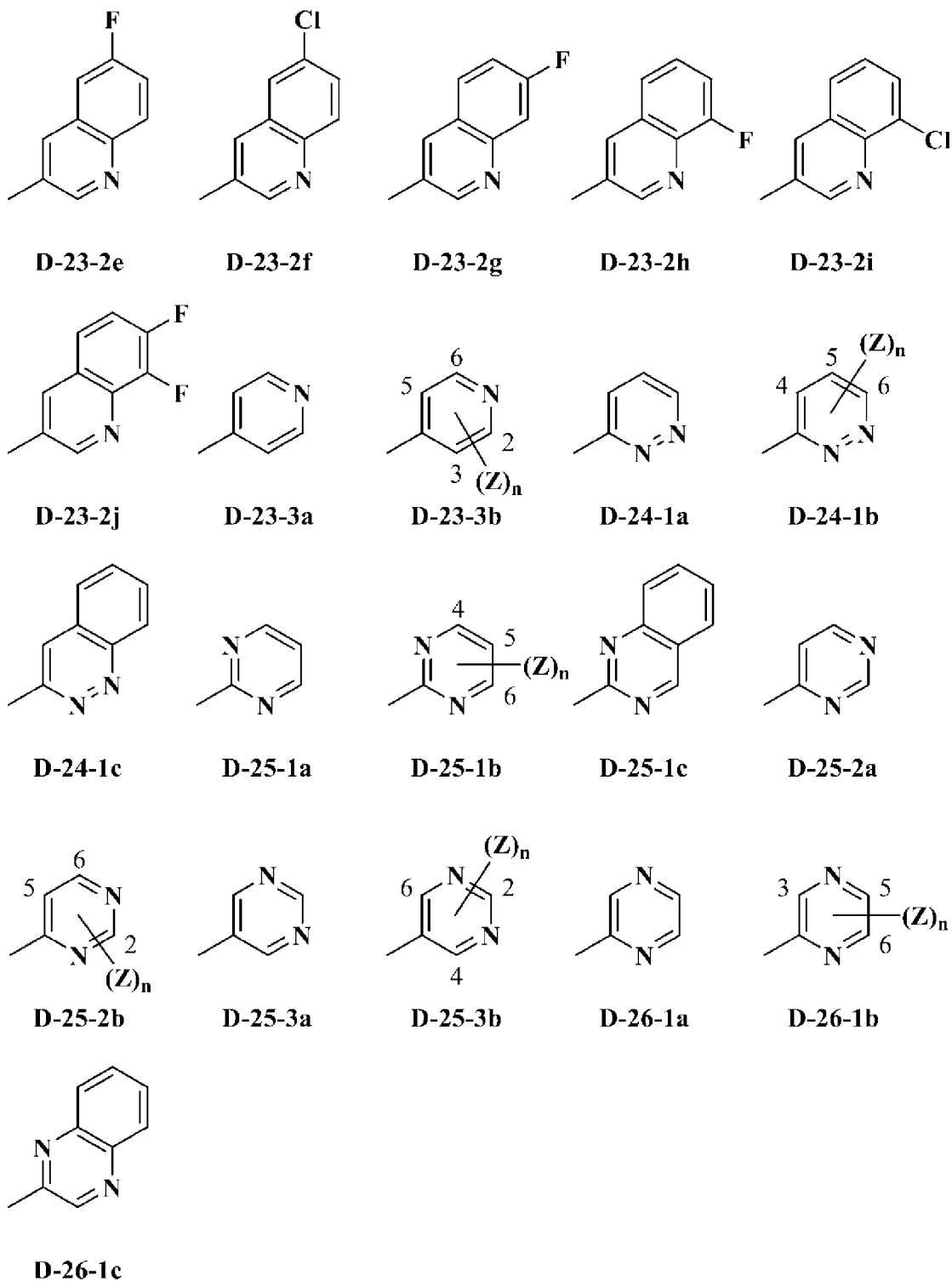
表中、D-1-1a~D-26-1cで表される芳香族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、

[0248]

[化31]



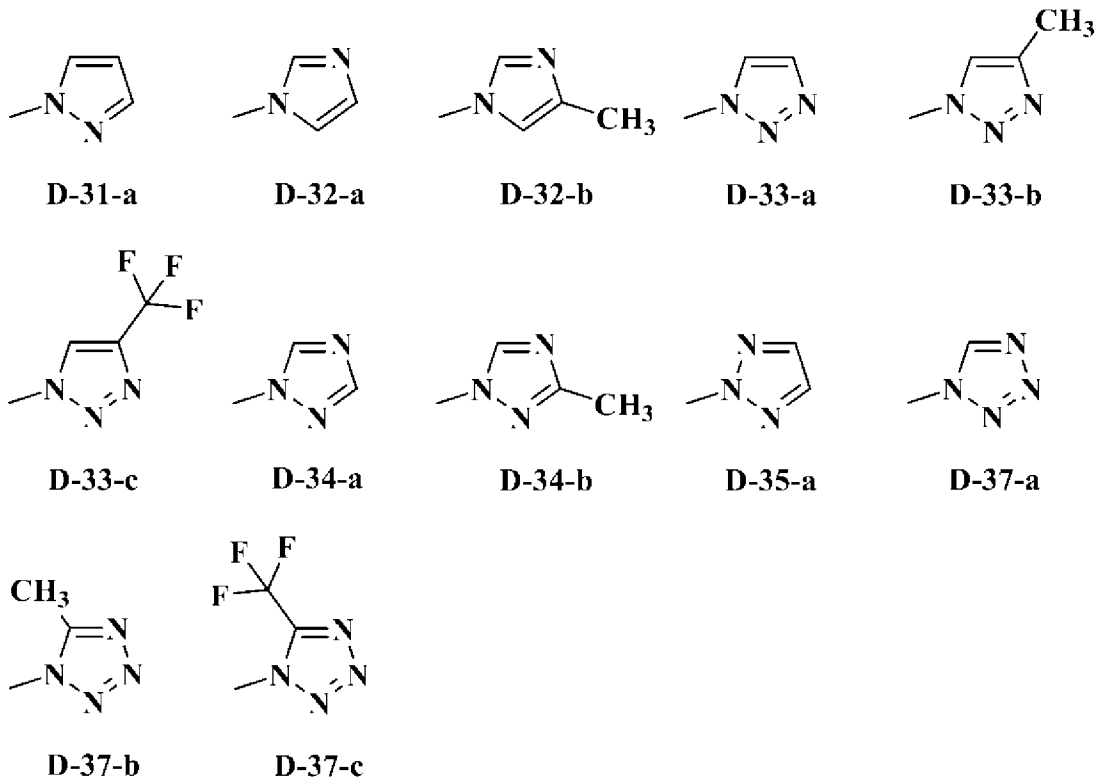
[0249] [化32]



[0250] 置換基(Z)_nの置換位置を表す番号は、上記の構造式において記された番号の位置に対応するものであり、例えば、表中、「(D-23-2b)-6-F」との記載は「6-フルオロピリジン-3-イル」を表し、

表中、D-31-a~D-37-cで表される芳香族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、

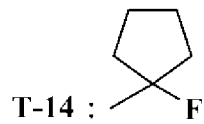
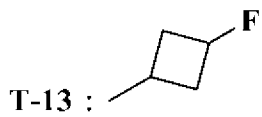
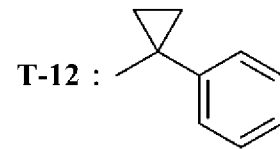
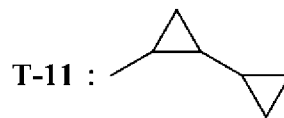
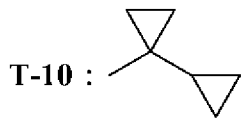
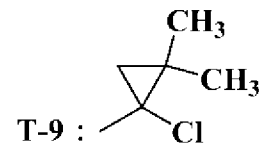
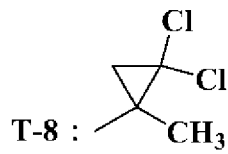
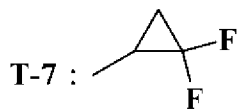
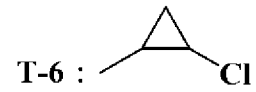
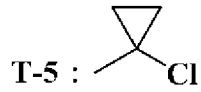
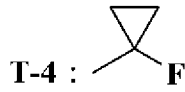
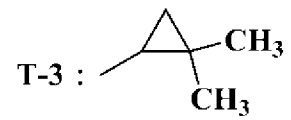
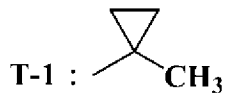
[0251] [化33]



表中、T-1~T-78は、それぞれ下記の構造を表す。

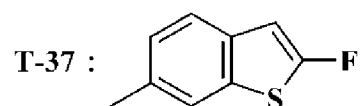
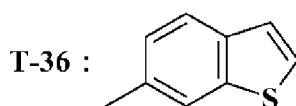
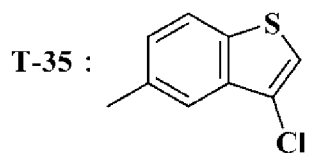
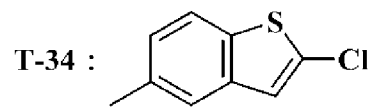
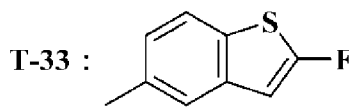
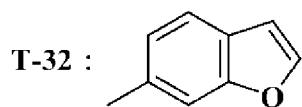
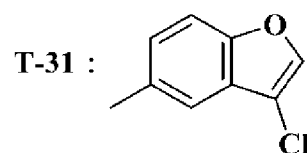
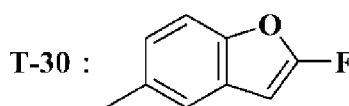
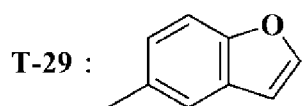
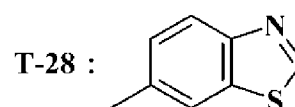
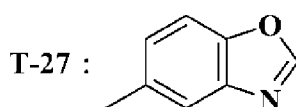
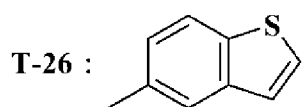
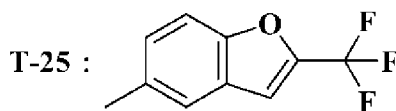
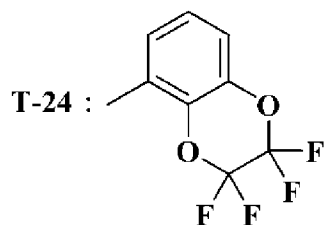
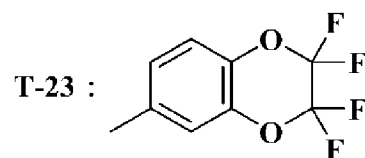
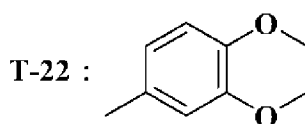
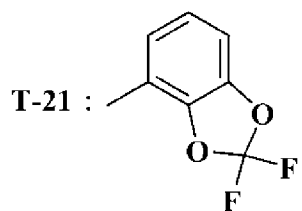
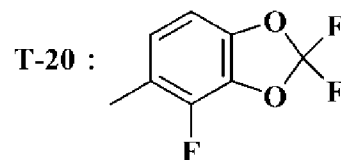
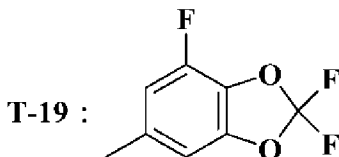
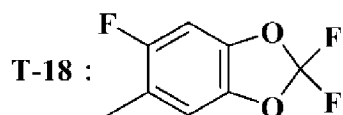
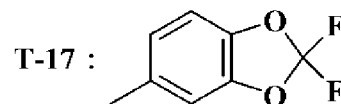
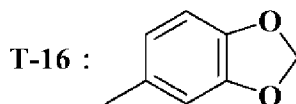
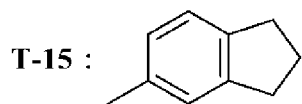
[0252]

[化34]

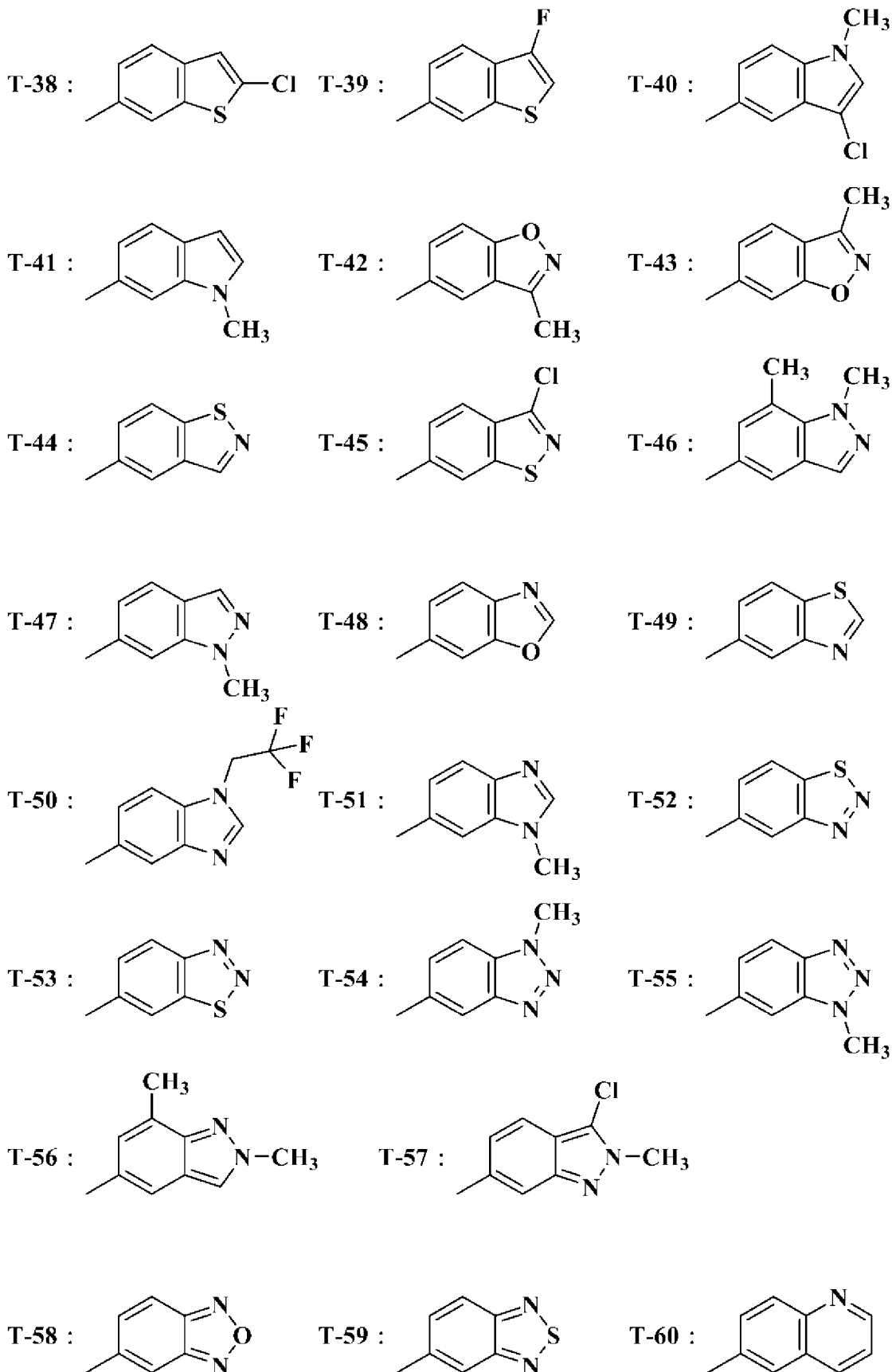


[0253]

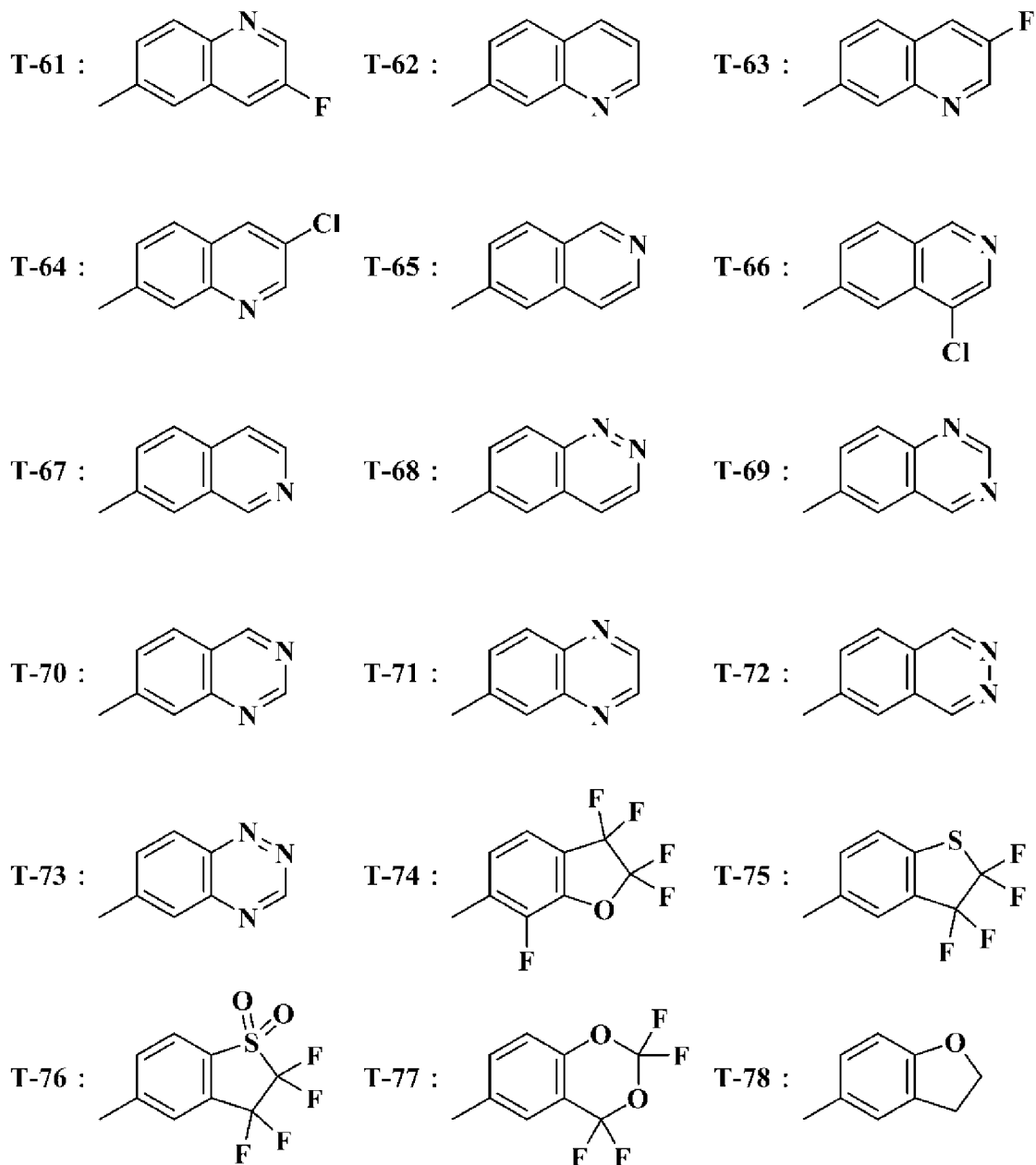
[化35]



[0254] [化36]



[0255] [化37]



[0256] また、表中、置換基 R^1 及び置換基 R^3 の欄における(R)及び(S)の表記は、 R^1 又は R^3 が結合する炭素原子の光学異性体の混合比において、(R)-体又は(S)-体の比が90%以上であることを表し、

表中、置換基 R^1 及び R^2 の欄における(E)及び(Z)の記載は、置換基 R^1 と R^2 とが一緒になって形成するアルキリデンの幾何異性体の混合比において、それぞれ(E)-体又は(Z)-体の比が90%以上であることを表す。

[0257]

[表2-1]

第2表

| R ⁵ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | Y ² | R ⁶ | Y ³ |
|---------------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|------------------------|----------------|
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| Et | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| i-Pr | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| c-Pr | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| c-Bu | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ CHF ₂ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ OCH ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ OEt | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ OC(O)CH ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ OC(O)OCH ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ SCH ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ CN | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ C(O)OCH ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ C(O)NH ₂ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ C(S)NH ₂ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₃ CH=CH ₂ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| OCH ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| OEt | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| SCCl ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |

[0258]

[表2-2]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|-------------------|-----------------|------------------------------|---|
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | H | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | H | H | Cl | CH ₃ | Ph-2-F | H |
| H | H | H | H | H | Cl | CH ₃ | Ph-3-F | H |
| H | H | H | H | H | Cl | CH ₃ | Ph-4-F | H |
| H | H | H | H | H | Br | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | H | H | Br | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | H | H | Br | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | H | H | CH ₃ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | H | H | CH ₃ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | H | H | CH ₃ | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Ph-2-F | H |
| H | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Ph-3-F | H |
| H | H | H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Ph-4-F | H |
| H | H | H | H | H | CF ₃ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | H | H | CF ₃ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | H | H | CF ₃ | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | H | H | OCH ₃ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | H | H | OCH ₃ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | H | H | OCH ₃ | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | H | H | OCHF ₂ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | H | H | OCHF ₂ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | H | H | OCHF ₂ | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | H | H | SCH ₃ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | H | H | SCH ₃ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | H | H | SCH ₃ | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-F | H |

[表2-3]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|----|---|------------------------------|---|
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | F | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |

[表2-4]

| | | | | | | | | |
|---------------------------------------|---|---|---|---|----|---|---------------------------------------|---|
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| i-Pr | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| c-Pr | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| c-Bu | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ Pr-c | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ CHF ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ OC(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ OC(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ SCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ C(O)NH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ C(S)NH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Br | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Bu-t | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OPen | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₂ Br | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCH ₂ CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-SCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-SCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-SCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-S(O)CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-S(O)CH ₃ | H |

[0261]

[表2-5]

| | | | | | | | | |
|------------------------------------|---|---|---|---|----|---|---------------------------------------|---|
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-S(O)CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-SO ₂ CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-SO ₂ CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-SO ₂ CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-SCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-SCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-SO ₂ CHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-SCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-SO ₂ CHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-SCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-SCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-SO ₂ CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-SCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-S(O)CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-SO ₂ CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-SF ₅ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-NO ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-NO ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-NO ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CN | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CN | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CN | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-(D-31-a) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-(D-32-a) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-(D-33-a) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-(D-33-b) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-(D-33-c) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-(D-34-a) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-4-(D-34-b) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 3-F ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 6-F ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-Cl-4-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-3-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |

[0262]

[表2-6]

| | | | | | | | | |
|------------------------------------|---|---|---|---|----|---|----------------------------|---|
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Br | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Br | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -3-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ -4-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ -3-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |

[0263]

[表2-7]

| | | | | | | | | |
|------------------------------------|---|---|---|---|----|---|---|---|
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-5-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-5-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-(CF ₃) ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ -4-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |

[表2-8]

| | | | | | | | | |
|------------------------------------|---|---|---|---|----|---|------------------------------|---|
| CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| Et | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| Et | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| Et | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| Et | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| Et | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |

[表2-9]

| | | | | | | | | |
|------------------------------------|---|---|---|---|----|---|-----------------------------|---|
| C(O)OCH ₃ | H | | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-OCF ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-Cl-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-15 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-78 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-16 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-21 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-75 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-76 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-22 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-23 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-24 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-77 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CN | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CN | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CN | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-(D-32-b) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-(D-32-b) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-(D-34-a) | H |

[0266]

[表2-10]

| | | | | | | | | |
|------------------------------------|---|---|---|---|----|---|---|---|
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4- (D-34-b) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4- (D-35-a) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4- (D-37-a) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4- (D-37-a) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4- (D-37-b) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4- (D-37-c) | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 3, 4-F ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 3, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 3, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 3-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4, 5-Cl ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4, 5-Cl ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl-5-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ -4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 3-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 6-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCH ₃ -5-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |

[0267]

[表2-11]

| | | | | | | | | |
|------------------------------------|---|---|---|---|----|---|---|---|
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ -5-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl-5-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCF ₂ Br | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-CN | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CN-5-Cl | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-CN | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-18 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-19 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-20 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-74 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | 1-Naph | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | 2-Naph | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-25 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-27 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-28 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-29 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-30 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-31 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-32 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-33 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-34 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-35 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-36 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-37 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-38 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-39 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| Et | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| CH ₂ OEt | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| CH ₂ CN | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| SCCl ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |

[0268]

[表2-12]

| | | | | | | | | |
|----------------------|---|---|---|---|----|---|----------------------------|---|
| C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-41 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-42 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-43 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-44 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-45 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-46 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-47 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-48 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-49 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-50 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-51 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-52 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-53 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-54 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-55 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-56 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-57 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-58 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-59 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-60 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-61 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-62 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-63 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-64 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-65 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-66 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-67 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-68 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-69 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-70 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-71 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-72 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | T-73 | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | D-1-1a | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-1b)-5-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-1b)-4-Br | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-1b)-5-Br | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-1b)-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-1b)-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-1b)-5-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-1b)-5-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | D-1-1c | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-F | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-5-CH ₃ | H |

[表2-13]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|----|---|----------------------------------|---|
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-1-2c | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-2-1a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-3-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-4-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-4-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-5-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-5-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-5-CHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-5-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-5-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-5-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-4-CN | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-5-CN | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-3-CH ₃ -5-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-1b)-3-CH ₃ -5-CN | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-2-1c | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-2-2a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-2-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-4-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-5-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-5-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-5-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-5-CHF ₂ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-5-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-5-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-5-CN | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-2, 5-C1 ₂ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-CN | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-2-2c | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-2-2d | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-6-1a)-1-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-7-1b)-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-7-1b)-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-8-1a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-8-1b)-4-F | H |

[表2-14]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|----|---|----------------------------------|---|
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-8-1b)-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-8-1b)-5-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-8-1b)-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-8-2a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-8-2b)-5-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-8-3a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-8-3b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-1a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-3-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-3-Cl | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-5-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-5-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-5-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-5-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-6-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-6-Cl | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-6-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-6-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-6-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-4, 5-F ₂ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-3-Cl-5-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-3, 5-Cl ₂ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-4, 5-Cl ₂ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-3-F-5-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-1b)-3-Cl-5-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-1c | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-1d | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-2a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-2-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-2-Cl | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-5-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-5-Cl | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-5-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-5-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-6-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-6-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-6-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-6-CN | H |

[表2-15]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|-----------------|---|----------------------------------|---|
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-4, 6-F ₂ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-4-F-6-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-5-F-6-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-5-F-6-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-4-F-6-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-5-F-6-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-2b)-5-F-6-OCF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-2c | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-2d | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-2e | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-2f | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-2g | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-2h | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-2i | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-2j | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-23-3a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-3b)-2-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-3b)-2-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-3b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-3b)-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-3b)-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-3b)-3-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-23-3b)-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-24-1a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-24-1b)-6-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-24-1b)-6-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-24-1c | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-25-1a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-25-1b)-4-F | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-25-1b)-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-25-1b)-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-25-1c | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-25-2a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-25-2b)-2-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-25-3a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-25-3b)-2-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-25-3b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-25-3b)-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-26-1a | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-26-1b)-5-CH ₃ | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | (D-26-1b)-6-C1 | H |
| H | H | H | F | F | C1 | H | D-26-1c | H |
| H | H | H | F | F | Br | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | F | F | Br | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | F | F | Br | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | F | F | CH ₃ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | F | F | CH ₃ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | F | F | CH ₃ | H | Ph-4-F | H |

[表2-16]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|-----------------|---|------------------|---|------------------------------|---|
| H | H | H | F | F | CF ₃ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | F | F | CF ₃ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | F | F | CF ₃ | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | F | F | CF ₃ | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | F | F | OCH ₃ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | F | F | OCH ₃ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | F | F | OCH ₃ | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |

[0273]

[表2-17]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|-----------------|-----------------|----|---|------------------------------|---|
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-F | H |

[0274]

[表2-18]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|-----------------|-----------------|----|---|------------------------------|---|
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | Et | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | Et | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | Et | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | Et | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | Et | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-F | H |

[0275]

[表2-19]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---------------------------------|-----------------|----|---|------------------------------|---|
| H | H | H | Et | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | n-Pr | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | n-Pr | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | n-Pr | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | i-Pr | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | i-Pr | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | i-Pr | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | c-Pr | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | c-Pr | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | c-Pr | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | CH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | CH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | CH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |

[0276]

[表2-20]

| | | | | | | | |
|---|---|---|------------------------------------|----|---|----------------------------|---|
| H | H | H | -CH ₂ - | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Br | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Br | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ - | Br | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH(F)- | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH(F)-(E) | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH(F)-(Z) | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH(F)- | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH(F)-(E) | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH(F)-(Z) | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH(F)- | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH(F)-(E) | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH(F)-(Z) | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH(Cl)- | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH(Cl)-(E) | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH(Cl)-(Z) | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH(Cl)- | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH(Cl)-(E) | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH(Cl)-(Z) | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH(Cl)- | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH(Cl)-(E) | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH(Cl)-(Z) | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH(CH ₃)- | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH(CH ₃)-(E) | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH(CH ₃)-(Z) | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH(CH ₃)- | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH(CH ₃)-(E) | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH(CH ₃)-(Z) | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH(CH ₃)- | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH(CH ₃)-(E) | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH(CH ₃)-(Z) | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |

[0277]

[表2-21]

| | | | | | | | |
|---|---|---|--|------------------|---|------------------------------|---|
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Br | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Br | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | Br | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | CH ₃ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | CH ₃ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | CH ₃ | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | OCH ₃ | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | OCH ₃ | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | OCH ₃ | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ OCH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -CH ₂ OCH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F | H |

[0278]

[表2-22]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|--|----|----|--------|----------------------------|---|
| H | H | H | -CH ₂ OCH ₂ - | Cl | H | Ph-4-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ SCH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ SCH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ SCH ₂ - | Cl | H | Ph-4-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ S(O)CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ S(O)CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ S(O)CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ SO ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ SO ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ SO ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-2-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-3-F | H | |
| H | H | H | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ - | Cl | H | Ph-4-F | H | |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |

[0279]

[表2-23]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|------------------|---|----|---|------------------------------|---|
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | D-1-2a | H |

[表2-24]

| | | | | | | | | |
|---|---|---|-------------------------------------|-----------------|----|---|----------------------------|---|
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | H | H | OEt | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | H | H | OPr-n | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | OPr-n | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | OPr-n | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | OPr-i | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | OPr-i | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | OPr-i | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | OCH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | OCH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | OCH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | OCH ₂ CH=CH ₂ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | OCH ₂ CH=CH ₂ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | OCH ₂ CH=CH ₂ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | OCH ₂ C≡CH | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | OCH ₂ C≡CH | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | OCH ₂ C≡CH | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | -OCH ₂ CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | -OCH ₂ CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | -OCH ₂ CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | SCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | SCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | SCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | NHOEt | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | NHOEt | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | NHOEt | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | NHOPr-i | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | NHOPr-i | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | NHOPr-i | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | NHOBu-s | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | NHOBu-s | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | NHOBu-s | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | NHOBu-t | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | NHOBu-t | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | NHOBu-t | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | CN | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | CN | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | CN | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | C(O)NH ₂ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | H | H | C(O)NH ₂ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | C(O)NH ₂ | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | H | H | C(S)NH ₂ | CH ₃ | Cl | H | Ph-2-F | H |

[0281]

[表2-25]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|---------------------|-----------------|----|---|------------------------|---|
| H | H | H | C(S)NH ₂ | CH ₃ | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | H | H | C(S)NH ₂ | CH ₃ | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2,4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2,4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3,4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3,4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2,4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2,4-Cl ₂ | H |

[0282]

[表2-26]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|---|---|----|---|------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ | H | H | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | H | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |

[0283]

[表2-27]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|---|---|----|---|------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | H | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Br | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | I | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Et | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Et | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | n-Pr | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | n-Pr | H |

[0284]

[表2-28]

| | | | | | | | | |
|------|---------------------|---|---|---|----|---|---|---|
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | i-Pr | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | i-Pr | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | c-Pr | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | c-Pr | H |
| c-Pr | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | c-Pr | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-2 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-2 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | c-Bu | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | c-Bu | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | t-Bu | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | t-Bu | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-1 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-1 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-3 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | c-Pen | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-10 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-11 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | c-Hex | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CH ₂ F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | CH ₂ F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-4 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-4 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-5 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-5 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-6 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-6 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-7 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-7 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-8 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-13 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-13 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-9 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-14 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CH ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | CH ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CH ₂ OEt | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CH ₂ OBu-t | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CH ₂ OCH ₂ CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CH ₂ OCH ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ OH | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ OCH ₂ CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CH(OCH ₃) ₂ | H |

[0285]

[表2-29]

| | | | | | | | | |
|------------------------------------|---------------------|---|---|---|----|---|--|---|
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-12 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Si(CH ₃) ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Si(CH ₃) ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Si(CH ₃) ₂ Bu-t | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Si(CH ₃) ₂ Ph | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | CH=NOCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | C(CH ₃)=NOCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F | H |
| c-Pr | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ (R) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| Et | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| c-Pr | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ OEt | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ SCH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ CN | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ CH=CH ₂ | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| CH ₂ C≡CH | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| SCCl ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| C(O)CH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| C(O)OCH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |

[0286]

[表2-30]

| | | | | | | | | |
|------|---------------------|---|---|---|----|---|----------------------------|---|
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₂ Br | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₂ Br | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-SCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-SCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CN | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CN | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 3-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 3-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 6-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 6-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| c-Pr | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-CH ₃ | H |

[0287]

[表2-31]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|---|---|----|---|------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-2-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-2-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-CF ₃ -4-C1 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-CF ₃ -4-C1 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCH ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCH ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCH ₃ -4-C1 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCH ₃ -4-C1 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCHF ₂ -4-C1 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCF ₃ -4-C1 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-OCF ₃ -4-C1 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-2-C1-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-2-C1-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-3-C1-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | T-23 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | T-23 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | C1 | H | Ph-2, 3, 4-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | C1 | H | Ph-2, 3, 4-F ₃ | H |

[0288]

[表2-32]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|---|---|----|---|---|---|
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4, 5-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4, 5-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4, 5-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4, 5-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl-5-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl-5-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ -4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ -4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 5-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 6-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 6-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCH ₃ -5-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCH ₃ -5-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ -5-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCHF ₂ -5-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl-5-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl-5-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCF ₂ Br | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-OCF ₂ Br | H |

[表2-33]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|---|---|----|---|-------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-CN | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-CN | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CN-5-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CN-5-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-CN | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-Cl ₂ -4-CN | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-18 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-18 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-19 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-19 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-20 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-20 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-29 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-29 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-30 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-30 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-31 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-31 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-32 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-32 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-33 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-33 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-34 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-34 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-35 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-35 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-36 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-36 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-37 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-37 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-38 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-38 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-39 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-39 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-5-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-5-CH ₃ | H |

[表2-34]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|-----------------|---|----|---|----------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | D-2-1a | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | D-2-1a | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-5-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-5-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | D-2-2a | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | D-2-2a | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-2-2b)-5-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-2-2b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-2-2b)-5-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-2-2b)-5-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-2-2b)-5-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-2-2b)-5-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-6-1a)-1-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-6-1a)-1-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-23-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-23-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-23-1b)-5-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-23-1b)-5-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-23-1b)-5-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-23-1b)-5-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |

[表2-35]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|-----------------|---|----|---|------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Et | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | Et | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | n-Pr | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | n-Pr | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | i-Pr | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | i-Pr | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | c-Pr | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | c-Pr | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-2 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-2 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | c-Bu | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | c-Bu | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | t-Bu | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | t-Bu | H |

[表2-36]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|-----------------|---|----|---|---|---|
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-1 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-1 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | CH ₂ F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | CH ₂ F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-4 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-4 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-5 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-5 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-6 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-6 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-7 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-7 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-8 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-13 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-13 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-9 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-14 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | CH ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | CH ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Si(CH ₃) ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | CH ₃ | F | Cl | H | Si(CH ₃) ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |

[0293]

[表2-37]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|------------------------------------|---|----|---|------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ | H | CH ₃ | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | -CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |

[表2-38]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|----------------------|---|----|---|------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |

[表2-39]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|----------------------|---|----|---|------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | T-26 | H |

[表2-40]

| | | | | | | | | |
|---|---------------------|---|----------------------|---|----|---|----------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (R) | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ (S) | H | OCH ₃ (S) | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |

[表2-41]

| | | | | | | | | |
|---|-----------------|---|-------------------------------------|---|----|---|------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ | H | OEt | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | OPr-n | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | OPr-n | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | OPr-n | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OPr-i | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | OPr-i | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | OPr-i | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ CH=CH ₂ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ CH=CH ₂ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ CH=CH ₂ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ C≡CH | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ C≡CH | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ C≡CH | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ Ph | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ Ph | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | OCH ₂ Ph | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | SCH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | SCH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | SCH ₂ CF ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |

[表2-42]

| | | | | | | | | |
|---|-----------------|-----------------|--------------------|---|----|---|------------------------------|---|
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOCH ₃ | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | CH ₃ | H | NHOEt | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOEt | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOEt | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOPr-i | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOPr-i | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOPr-i | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOBu-s | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOBu-s | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOBu-s | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOBu-t | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOBu-t | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | H | NHOBu-t | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |

[表2-43]

| | | | | | | | | |
|---|-----------------|-----------------|---|---|----|---|---|---|
| H | CH ₃ | CH ₃ | H | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Et | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | n-Pr | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | i-Pr | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | c-Pr | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-2 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | c-Bu | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | t-Bu | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-1 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | CH ₂ F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-4 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-5 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-6 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-7 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-13 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | CH ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Si(CH ₃) ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |

[0300]

[表2-44]

| | | | | | | | | |
|---|-----------------|-----------------|---|---|----|---|---|---|
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | Et | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | Et | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | Et | H | H | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | CH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Et | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | n-Pr | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | i-Pr | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | c-Pr | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-2 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | c-Bu | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | t-Bu | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-1 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | CH ₂ F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-4 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-5 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-6 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-7 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-13 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | CH ₂ OCH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | C(CH ₃) ₂ OCH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Si(CH ₃) ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |

[0301]

[表2-45]

| | | | | | | | | |
|---|------------------------------------|---|------------------|---|----|---|------------------------------|---|
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-17 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-26 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | T-40 | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | Et | H | F | F | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |
| H | Et | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | Et | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | Et | H | OCH ₃ | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | n-Pr | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | n-Pr | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | n-Pr | H | H | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | i-Pr | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | i-Pr | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | i-Pr | H | H | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | -CH ₂ CH ₂ - | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | -CH ₂ CH ₂ - | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | -CH ₂ CH ₂ - | H | H | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | -CH ₂ CH ₂ - | H | H | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |

[0302]

[表2-46]

| | | | | | | | | |
|---|-------------------|---|---|---|----|---|------------------------------|---|
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-4-F | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-Cl | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-Cl | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-4-Cl | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CH ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CF ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-OCH ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-OCH ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCH ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCHF ₂ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4-F ₂ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-Cl-4-F | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-Cl | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-Cl | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4-Cl ₂ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CH ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-CF ₃ -4-F | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-CF ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3-F-4-OCF ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | T-17 | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-2, 4, 6-F ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 4, 5-F ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | T-26 | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | T-40 | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | D-1-2a | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | (D-1-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | (D-2-1b)-5-F | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | (D-8-2b)-2-CH ₃ | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-F | H |
| H | CH ₂ F | H | H | H | Cl | H | (D-23-2b)-6-Cl | H |

[0303] 本発明化合物は、マツ目 (Pinales)、モクレン類 (magnoliids)、単子葉類 (monocots)、真正双子葉類 (eudicots) 等の維管束植物 (Tracheophyta) に発生する植物病害及び哺乳類 (Mammalia)、鳥類 (Aves)、爬虫類 (Rep

tilia)、真骨魚類 (Actinopterygii) 等の脊椎動物 (Vertebrata) 感染症の病原菌、さらに植物寄生性又は動物寄生性の線形動物、鉤頭動物、扁形動物及び原生動物等の有害生物を駆除できる。

植物の有害生物としては、子囊菌門 (Ascomycota) 菌類、担子菌門 (Basidiomycota) 菌類、ツボカビ門 (Chitridiomycota) 菌類、コウマクノウキン門 (Blastocladiomycota) 菌類、ケカビ亜門 (Mucoromycotina) 菌類、ケルコゾア門 (Cercozoa) 原生生物、不等毛植物門 (Heterokontophyta) 卵菌類 (Oomycetes)、放線菌門 (Actinobacteria) グラム陽性菌類、テネリクテス門 (Tenericutes) グラム陽性菌類、プロテオバクテリア門 (Proteobacteria) グラム陰性菌類及び葉線虫目 (Aphelenchida) 線虫、ハリセンチュウ目 (Tylenchida) 線虫等が挙げられるが、本発明化合物は、これらのうち特に子囊菌門及び担子菌門に属する植物病原性真菌類、葉線虫目及びハリセンチュウ目に属する植物寄生性線虫類に対して低濃度で優れた防除効果を発揮する。

[0304] 動物の有害生物としては、子囊菌門 (Ascomycota) 菌類、担子菌門 (Basidiomycota) 菌類、放線菌門 (Actinobacteria) グラム陽性菌類、フィルミクテス門 (Firmicutes) グラム陽性菌類、テネリクテス門 (Tenericutes) グラム陽性菌類、プロテオバクテリア門 (Proteobacteria) グラム陰性菌類及びエノプルス目 (Enoplida) 線虫、桿線虫目 (Rhabditida) 線虫、円虫目 (Strongylida) 線虫、回虫目 (Ascaridida) 線虫、旋尾線虫目 (Spirurida) 線虫、鉤頭虫類、擬葉目 (Pseudophyllidea) 条虫、円葉目 (Cyclophyllidea) 条虫、有壁吸虫目 (Strigeidida) 吸虫、棘口吸虫目 (Echinostomida) 吸虫、斜睾吸虫目 (Plagiorchiida) 吸虫、後睾吸虫目 (Opisthorchiida) 吸虫、アメーバ類、ピロプラズマ目 (Piroplasmida) 孢子虫類、住血孢子虫目 (Haemosporida) 孢子虫類、真コクシジウム目 (Eucoccidiorida) 孢子虫類、前庭目 (Vestibuliferida) 繊毛虫類、トリコモナス目 (Trichomonadida) 鞭毛虫類、ディプロモナス目 (Diplomonadida) 鞭毛虫類、キネトプラスト目 (Kinetoplastida) 鞭毛虫類等が挙げられるが、本発明化合物は、これらのうち特にオマキザル科 (Cebidae)、オナガザル科 (Cercopithecidae)、ヒト科 (Hom

inidae)、ウサギ科 (Leporidae)、チンチラ科 (Chinchillidae)、テンジクネズミ科 (Caviidae)、キヌゲネズミ科 (Cricetidae)、ネズミ科 (Muridae)、リス科 (Sciuridae)、ラクダ科 (Camelidae)、イノシシ科 (Suidae)、シカ科 (Cervidae)、ウシ科 (Bovidae)、ネコ科 (Felidae)、イヌ科 (Canidae)、イタチ科 (Mustelidae)、ウマ科 (Equidae)、カンガルー科 (Macropodidae) 等に属する哺乳類 (Mammalia) の寄生虫、とりわけイノシシ科、ウシ科、ネコ科、イヌ科及びウマ科哺乳動物に寄生するエノプルス目、桿線虫目、円虫目、葉線虫目、ハリセンチュウ目、回虫目、旋尾線虫目に属する動物寄生性線虫の駆除に優れた効果を示す。

[0305] また、本発明化合物は、既存の殺菌剤・殺線虫剤に対して抵抗性の発達した有害生物に対しても有効である。さらに、本発明化合物はホ乳類、魚類、甲殻類、天敵類及び有用昆虫等の非標的生物に対してはほとんど悪影響の無い極めて有用な特長を有している。

本発明化合物を使用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤、消泡剤、防腐剤および分解防止剤等を添加して、液剤 (soluble concentrate)、乳剤 (emulsifiable concentrate)、水和剤 (wetable powder)、水溶剤 (water soluble powder)、顆粒水和剤 (water dispersible granule)、顆粒水溶剤 (water soluble granule)、懸濁剤 (suspension concentrate)、乳濁剤 (concentrated emulsion)、サスポエマルジョン (suspoemulsion)、マイクロエマルジョン (microemulsion)、粉剤 (dustable powder)、粒剤 (granule)、錠剤 (tablet) および乳化性ゲル剤 (emulsifiable gel) 等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を、水溶性カプセルおよび水溶性フィルムの袋等の水溶性包装体に封入して供することもできる。

[0306] 固体担体としては、例えば石英、方解石、海泡石、ドロマイト、チョーク、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、ハロサイト、メタハロサ

イト、木節粘土、蛙目粘土、陶石、ジークライト、アロフェン、シラス、きら、タルク、ベントナイト、活性白土、酸性白土、軽石、アタパルジャイト、ゼオライト、珪藻土等の天然鉱物質；焼成クレー、パーライト、シラスバルーン、バーミキュライト、アタパルガスクレー、焼成珪藻土等の天然鉱物質の焼成品；炭酸マグネシウム、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、硫酸マグネシウム、リン酸水素二アンモニウム、リン酸二水素アンモニウム、塩化カリウム等の無機塩類；ブドウ糖、果糖、しょ糖、乳糖などの糖類；澱粉、粉末セルロース、デキストリン等の多糖類；尿素、尿素誘導体、安息香酸、安息香酸の塩等の有機物；木粉、コルク粉、トウモロコシ穂軸、クルミ殻、タバコ茎等の植物類；フライアッシュ、ホワイトカーボン（含水合成シリカ、無水合成シリカ、含水合成シリケート等）、肥料等が挙げられる。

[0307] 液体担体としては、例えばキシレン、アルキル（ C_9 または C_{10} 等）ベンゼン、フェニルキシリルエタン、アルキル（ C_1 または C_3 等）ナフタレン等の芳香族炭化水素類；マシン油、ノルマルパラフィン、イソパラフィン、ナフテン等の脂肪族炭化水素類；ケロシン等の芳香族炭化水素と脂肪族炭化水素の混合物；エタノール、イソプロパノール、シクロヘキサノール、フェノキシエタノール、ベンジルアルコール等のアルコール；エチレングリコール、プロピレングリコール、ジエチレングリコール、ヘキシレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール等の多価アルコール；プロピルセロソルブ、ブチルセロソルブ、フェニルセロソルブ、プロピレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノエチルエーテル、プロピレングリコールモノプロピルエーテル、プロピレングリコールモノブチルエーテル、プロピレングリコールモノフェニルエーテル等のエーテル；アセトフェノン、シクロヘキサノン、 γ -ブチロラクトン等のケトン；脂肪酸メチルエステル、コハク酸ジアルキルエステル、グルタミン酸ジアルキルエステル、アジピン酸ジアルキルエステル、フタル酸ジアルキルエステル等のエステル；N-アルキル（ C_1 、 C_8 または C_{12} 等）ピロリドン等の酸アミ

ド；大豆油、アマニ油、ナタネ油、ヤシ油、綿実油およびヒマシ油等の油脂；ジメチルスルホキシド、水等が挙げられる。

[0308] これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキル（モノまたはジ）フェニルエーテル、ポリオキシエチレン（モノ、ジまたはトリ）スチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸（モノまたはジ）エステル、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ヒマシ油エチレンオキサイド付加物、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、アセチレングリコールのエチレンオキサイド付加物、アセチレンアルコールのエチレンオキサイド付加物、アルキルグリコシド等のノニオン性界面活性剤；アルキル硫酸エステル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸またはリン酸エステル塩、ポリオキシエチレン（モノまたはジ）アルキルフェニルエーテル硫酸またはリン酸エステル塩、ポリオキシエチレン（モノ、ジまたはトリ）スチリルフェニルエーテル硫酸またはリン酸エステル塩、ポリカルボン酸塩（例えば、ポリアクリル酸塩、ポリマレイン酸塩、マレイン酸とオレフィンとの共重合体等）、ポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤；アルキルアミン塩、アルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤；アミノ酸型、ベタイン型等の両性界面活性剤；シリコーン系界面活性剤、フッ素系界面活性剤等が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05～20重量部の範囲が望ましく、0.1～20重量部がより望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用い

ても2種以上を併用してもよい。

[0309] 本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異は有るが、通常は、有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり0.005～50kgが好ましく、0.01～5kgがより好ましい。

[0310] 一方、家畜・家禽及び愛玩動物としての哺乳動物及び鳥類の寄生虫の防除に本発明化合物を使用するにあたっては、有効量の本発明化合物を製剤用添加物とともに経口投与又は非経口投与することができる。ここで、非経口投与の具体例としては、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内）、経皮投与（浸漬、スプレー、入浴、洗浄、滴下 (pouring-on)、スポッティング (spotting-on)、ダスティング (dusting)）、又は経鼻投与などが挙げられる。

[0311] 本発明化合物はまた、細片、プレート、バンド、カラー、イヤーマーク (ear mark)、リム (limb) ・バンド、標識装置などを用いた成形製品により投与することができる。投与にあたっては本発明化合物を投与経路に適した任意の剤型とすることができる。

調製される任意の剤型としては、粉剤、粒剤、水和剤、ペレット、錠剤、大丸薬、カプセル剤、活性化合物を含む成形製品などの固体調製物；注射用液剤、経口用液剤、皮膚上または体腔中に用いる液剤；滴下 (Pour-on) 剤、点下 (Spot-on) 剤、フロアブル剤、乳剤などの溶液調製物；軟膏剤、ゲルなどの半固体調製物などが挙げられる。

[0312] 固体調製物は、主に経口投与あるいは水などで希釈して経皮投与にあるいは環境処理にて用いることができる。固体調製物は、活性化合物を必要ならば補助剤を加えて適当な賦形剤と共に混合し、そして所望の形状に変えることにより調製できる。

賦形剤としては、例えば炭酸塩、炭酸水素塩、リン酸塩、酸化アルミニウム、シリカ、粘土などの無機物質、糖、セルロース、粉碎された穀物、澱粉などの有機物質が挙げられる。

[0313] 注射用液剤は、静脈内、筋肉内および皮下に投与できる、注射用液剤は、活性化合物を適当な溶媒に溶解させ、そして必要ならば可溶化剤、酸、塩基

、緩衝用塩、酸化防止剤、保護剤などの添加剤を加えることにより調製できる。

[0314] 溶媒としては、水、エタノール、ブタノール、ベンジルアルコール、グリセリン、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、N-メチルピロリドン並びにこれらの混合物、生理学的に許容しうる植物油、注射に適する合成油などが挙げられる。

可溶化剤としては、ポリビニルピロリドン、ポリオキシエチル化されたヒマシ油、ポリオキシエチル化されたソルビタンエステルなどが挙げられる。

保護剤としては、ベンジルアルコール、トリクロロブタノール、p-ヒドロキシ安息香酸エステル、n-ブタノールなどが挙げられる。

[0315] 経口液剤は直接または希釈して投与することができる。また、注射用液剤と同様に調製することができる。

フロアブル剤、乳剤などは直接または希釈して経皮的に、または環境処理にて投与できる。

皮膚上で用いる液剤は、滴下し、広げ、すり込み、噴霧し、散布するか、または浸漬（浸漬、入浴または洗浄）により塗布することにより投与できる。これらの液剤は注射用液剤と同様に調製できる。

[0316] 滴下(Pour-on)剤および点下(Spot-on)剤は皮膚の限定された場所に滴下するか、または噴霧し、これにより活性化合物を皮膚に浸漬させそして全身的に作用させることができる。滴下剤および点下剤は、有効成分を適当な皮膚適合性溶媒または溶媒混合物に溶解するか、懸濁させるかまたは乳化することにより調製できる。必要ならば、界面活性剤、着色剤、吸収促進物質、酸化防止剤、光安定剤、接着剤などの補助剤を加えてもよい。

溶媒としては、水、アルカノール、グリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン、ベンジルアルコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール、酢酸エチル、酢酸ブチル、安息香酸ベンジル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテル、アセトン、メチルエチルケトン、芳香族および／ま

たは脂肪族炭化水素、植物または合成油、DMF、流動パラフィン、軽質流動パラフィン、シリコン、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドンまたは2,2-ジメチル-4-オキシメチレン-1,3-ジオキソラン等が挙げられる。

[0317] 吸収促進物質としては、DMSO、ミリスチン酸イソプロピル、ペラルゴン酸ジプロピレングリコール、シリコン油、脂肪族エステル、トリグリセリド、脂肪アルコール等が挙げられる。

酸化防止剤としては、亜硫酸塩、メタ重亜硫酸塩、アスコルビン酸、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、トコフェロール等が挙げられる。

乳剤は、経口投与、経皮投与または注射として投与できる。乳剤は、有効成分を疎水性相または親水性相に溶解させ、このものを適当な乳化剤により、必要ならばさらに着色剤、吸収促進物質、保護剤、酸化防止剤、遮光剤、増粘物質などの補助剤と共に他の相の溶媒と均質化することにより調製できる。

[0318] 疎水性相（油）としては、パラフィン油、シリコン油、ゴマ油、アーモンド油、ヒマシ油、合成トリグリセリド、ステアリン酸エチル、アジピン酸ジ-n-ブチリル、ラウリル酸ヘキシル、ペラルゴン酸ジプロピレングリコール、分枝鎖状の短鎖長脂肪酸と鎖長 $C_{16} \sim C_{18}$ の飽和脂肪酸とのエステル、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、鎖長 $C_{12} \sim C_{18}$ の飽和脂肪アルコールのカプリル／カプリン酸エステル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル、オレイン酸エチル、乳酸エチル、ワックス状脂肪酸エステル、フタル酸ジブチル、アジピン酸ジイソプロピル、イソトリデシルアルコール、2-オクチルドデカノール、セチルステアリルアルコール、オレイルアルコール等が挙げられる。

[0319] 親水性相としては、水、プロピレングリコール、グリセリン、ソルビトール等が挙げられる。

乳化剤としては、ポリオキシエチル化されたヒマシ油、ポリオキシエチル

化されたモノオレフィン酸ソルビタン、モノステアリン酸ソルビタン、モノステアリン酸グリセリン、ステアリン酸ポリオキシエチル、アルキルフェノールポリグリコールエーテルなどの非イオン性界面活性剤；N-ラウリル-β-イミノジプロピオン酸二ナトリウム、レシチンなどの両性界面活性剤；ラウリル硫酸ナトリウム、脂肪アルコール硫酸エーテル、モノ/ジアルキルポリグリコールオルトリン酸エステルのモノエタノールアミン塩などの陰イオン性界面活性剤；塩化セチルトリメチルアンモニウムなどの陽イオン性界面活性剤などが挙げられる。

[0320] 他の補助剤としては、カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、ポリアクリレート、アルギネート、ゼラチン、アラビアゴム、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、メチルビニルエーテル、無水マレイン酸の共重合体、ポリエチレングリコール、ワックス、コロイド状シリカ等が挙げられる。

半固体調製物は皮膚上に塗布するか、もしくは広げるか、または体腔中に導入することにより投与できる。ゲルは注射用液剤について上記したように調製した溶液に、軟膏状の粘稠性を有する透明な物質を生じさせるに十分なシクナーを加えることにより調製できる。

[0321] 以下に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみ限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔水和剤〕

| | |
|--------|---------|
| 本発明化合物 | 0.1～80部 |
| 固体担体 | 5～98.9部 |
| 界面活性剤 | 1～10部 |
| その他 | 0～5部 |

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔乳剤〕

| | |
|--------|---------|
| 本発明化合物 | 0.1～30部 |
|--------|---------|

| | |
|-------|---------|
| 有機溶剤 | 45～95部 |
| 界面活性剤 | 4.9～30部 |
| 水 | 0～50部 |
| その他 | 0～10部 |

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0322] 〔懸濁剤〕

| | |
|--------|-----------|
| 本発明化合物 | 0.1～70部 |
| 液体担体 | 15～98.89部 |
| 界面活性剤 | 1～12部 |
| その他 | 0.01～30部 |

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

[0323] 〔顆粒水和剤〕

| | |
|--------|---------|
| 本発明化合物 | 0.1～90部 |
| 固体担体 | 0～98.9部 |
| 界面活性剤 | 1～20部 |
| その他 | 0～10部 |

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔液 剤〕

| | |
|--------|-----------|
| 本発明化合物 | 0.01～70部 |
| 液体担体 | 20～99.99部 |
| その他 | 0～10部 |

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

[0324] 〔粒 剤〕

| | |
|--------|-----------|
| 本発明化合物 | 0.01～80部 |
| 固体担体 | 10～99.99部 |
| その他 | 0～10部 |

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔粉 剤〕

| | |
|--------|-----------|
| 本発明化合物 | 0.01～30部 |
| 固体担体 | 65～99.99部 |
| その他 | 0～5部 |

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0325] 次に、本発明化合物を有効成分とする製剤例をより具体的に示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、以下の配合例において、「部」は重量部を意味する。

[0326] 〔配合例1〕水和剤

| | |
|-----------------|-----|
| 本発明化合物No. 1-019 | 20部 |
| パイロフィライト | 74部 |
| ソルポール5039 | 4部 |

(商品名、非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業社製)

| | |
|-------------|----|
| カープレックス#80D | 2部 |
|-------------|----|

(商品名、合成含水珪酸：塩野義製薬社製)

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

[0327] 〔配合例2〕乳剤

| | |
|-----------------|-----|
| 本発明化合物No. 3-012 | 5部 |
| キシレン | 75部 |
| N-メチルピロリドン | 15部 |
| ソルポール2680 | 5部 |

(商品名、非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業社製)

以上を均一に混合して乳剤とする。

〔配合例3〕乳剤

| | |
|-----------------|-----|
| 本発明化合物No. 3-053 | 4部 |
| DBE | 36部 |

(商品名、アジピン酸ジメチル、グルタル酸ジメチル、コハク酸ジメチルの

混合物：インビスタ（INVISTA）社製）

アジピン酸ジイソブチル 30部

N-メチルピロリドン 10部

ソプロフォールBSU 14部

（商品名、非イオン性界面活性剤：ローディア（Rhodia）社製）

ローダカル70BC 6部

（商品名、アニオン性界面活性剤：ローディア（Rhodia）社製）

以上を均一に混合して乳剤とする。

[0328] 〔配合例4〕乳剤

本発明化合物No.7-006 4部

DBE 11部

（商品名、アジピン酸ジメチル、グルタル酸ジメチル、コハク酸ジメチルの

混合物：インビスタ（INVISTA）社製）

アジピン酸ジイソブチル 30部

N-メチルピロリドン 5部

ソプロフォールBSU 14部

（商品名、非イオン性界面活性剤：ローディア（Rhodia）社製）

ローダカル70BC 6部

（商品名、アニオン性界面活性剤：ローディア（Rhodia）社製）

プロピレングリコール 10部

水 20部

以上を均一に混合して乳剤とする。

[0329] 〔配合例5〕懸濁剤

本発明化合物No.9-003 25部

アグリゾールS-710 10部

（商品名、非イオン性界面活性剤：花王社製）

ルノックス1000C 0.5部

（商品名、アニオン性界面活性剤：東邦化学工業社製）

キサンタンガム 0.2部

水 64.3部

以上を均一に混合した後、湿式粉碎して懸濁剤とする。

[0330] 〔配合例6〕 顆粒水和剤

本発明化合物No. 9-004 75部

ハイテノールNE-15 5部

(商品名、アニオン性界面活性剤：第一工業製薬社製)

バニレックスN 10部

(商品名、アニオン性界面活性剤：日本製紙社製)

カープレックス#80D 10部

(商品名、合成含水珪酸：塩野義製薬社製)

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して顆粒水和剤とする。

〔配合例7〕 粒 剤

本発明化合物No. 3-064 5部

ベントナイト 50部

タルク 45部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

[0331] 〔配合例8〕 粉 剤

本発明化合物No. 3-059 3部

カープレックス#80D 0.5部

(商品名、合成含水珪酸：塩野義製薬社製)

カオリナイト 95部

リン酸ジイソプロピル 1.5部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

[0332] 使用に際しては、上記の各製剤を水で1~20000倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.005~50kgになるように散布

する。

[0333] 〔配合例 9〕水和剤調製物

| | |
|---------------------------|-----|
| 本発明化合物 N o. 1-016 | 25部 |
| ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム | 1部 |
| n-ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム | 10部 |
| アルキルアリール ポリグリコールエーテル | 12部 |
| ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物のナトリウム塩 | 3部 |
| エマルジョン型シリコーン | 1部 |
| 二酸化ケイ素 | 3部 |
| カオリン | 45部 |

[0334] 〔配合例 10〕水溶性濃厚剤調製物

| | |
|-------------------|-------|
| 本発明化合物 N o. 1-049 | 20部 |
| ポリオキシエチレンラウリルエーテル | 3部 |
| ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム | 3.5部 |
| ジメチルスルホキシド | 37部 |
| 2-プロパノール | 36.5部 |

〔配合例 11〕噴霧用液剤

| | |
|-------------------|-----|
| 本発明化合物 N o. 1-048 | 2部 |
| ジメチルスルホキシド | 10部 |
| 2-プロパノール | 35部 |
| アセトン | 53部 |

[0335] 〔配合例 12〕経皮投与用液剤

| | |
|-------------------|-----|
| 本発明化合物 N o. 1-088 | 5部 |
| ヘキシレングリコール | 50部 |
| イソプロパノール | 45部 |

〔配合例 13〕経皮投与用液剤

| | |
|---------------------|-----|
| 本発明化合物 N o. 3-090 | 5部 |
| プロピレングリコールモノメチルエーテル | 50部 |

| | | |
|--------|-----------------------------|-----|
| | ジプロピレングリコール | 45部 |
| [0336] | 〔配合例14〕経皮投与(滴下)用液剤 | |
| | 本発明化合物No.1-087 | 2部 |
| | 軽質流動パラフィン | 98部 |
| | 〔配合例15〕経皮投与(滴下)用液剤 | |
| | 本発明化合物No.3-055 | 2部 |
| | 軽質流動パラフィン | 58部 |
| | オリーブ油 | 30部 |
| | ODO-H | 9部 |
| | 信越シリコーン(商品名、シリコーン:信越化学工業社製) | 1部 |

[0337] 本発明化合物を農園芸用殺菌剤及び線虫防除剤として使用する場合には、有効量の本発明化合物を活性成分として単独で用いることもできるが、必要に応じて他種の殺菌剤、他種の殺線虫剤、殺虫剤、殺ダニ剤、植物生長調節剤、除草剤、共力剤、肥料、土壌改良剤等と製剤時又は散布時に混合施用しても良い。

また、本発明化合物を寄生虫防除剤として使用する場合には、有効量の本発明化合物を活性成分として単独で投与することもできるが、必要に応じて他種の抗菌剤、他種の駆虫剤等と製剤時又は投与時に混合して投与することもできる。

[0338] 特に他種の殺菌剤、他種の殺線虫剤、他種の抗菌剤或いは他種の駆虫剤等と混合施用することにより、混合した薬剤相互の相加・相乗作用による防除スペクトラムの拡大、有害生物防除効果の向上、施用薬量の低減による防除コストの軽減、さらには、より長期間にわたる防除効果の持続等の効果が期待できる。特に、作用機作の異なる他種の殺菌剤、殺線虫剤、抗菌剤、駆虫剤と混合して施用することは、有害生物の薬剤抵抗性獲得を防ぐ観点から極めて有効な防除方法である。この際、同時に複数の公知殺菌剤、公知線虫剤、公知殺虫剤、公知殺ダニ剤、公知抗菌剤或いは公知駆虫剤との組み合わせも可能である。

[0339] 本発明化合物と混合使用する殺菌剤、殺線虫剤、殺虫剤、殺ダニ剤、駆虫剤或いは抗菌剤の種類としては、例えばザ・ペスティサイド・マニュアル (The Pesticide Manual) 16版、2012年等に記載されている化合物等が挙げられる。具体的にその一般名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみに限定されるものではない。

[0340] 殺菌剤：

A；核酸生合成阻害剤

ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシルーM (benalaxyl-M)、フララキシル (furalaxyl)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルーM (metalaxyl-M)、オフラセ (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、
ブピリメート (bupirimate)、エチリモール (ethirimol)、
ヒメキサゾール (hymexazol)。

B；有糸分裂及び細胞分裂阻害剤

ベノミル (benomyl)、カルベンダジム (carbendazim)、フベリダゾール (fuberidazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオファネート
ーメチル (thiophanate-methyl)、
ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、
エタボキサム (ethaboxam)、ゾキサミド (zoxamide)、
ペンシクロン (pencycuron)、
フルオピコリド (fluopicolide)。

[0341] C；呼吸阻害剤

ジフルメトリム (diflumentorim)、
ベノダニル (benodanil)、ベンゾビンジフルピル (benzovindiflupyr)、
ビキサフェン (bixafen)、ボスカリド (boscalid)、カルボキシシン (carb
oxin)、フェンフラム (fenfuram)、フルインダピル (fluindapyr)、フル
オピラム (fluopyram)、フルトラニル (flutolanil)、フルキサピロキサド
(fluxapyroxad)、フラメトピル (furametpyr)、イソフェタミド (isofeta
mid)、イソフルシプラム (isoflucypram)、イソピラザム (isopyrazam)、

メプロニル (mepronil)、オキシカルボキシ (oxycarboxin)、ペンフルフェン (penflufen)、ペンチオピラド (penthioapyrad)、ピジフルメトフェン (pydiflumetofen)、ピラジフルミド (pyraziflumid)、セダキサン (sedaxane)、チフルザミド (thifluzamide)、

アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クモキシストロビン (coumoxystrobin)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、エネストロビン (enestrobin)、エノキサストロビン (enoxastrobin)、ファモキサドン (famoxadone)、フェナミドン (fenamidone)、フェナミンストロビン (fenaminstrobin)、フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、クレソキシムーメチル (kresoxim-methyl)、マンデストロビン (mandestrobin)、メトミノストロビン (metominostrobin)、オリサストロビン (orysastrobin)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、ピリベンカルブメチル (pyribencarb-methyl)、ピリミノストロビン (pyriminostrobin)、トリクロピリカルブ (triclopyricab)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、

アミスルブロム (amisulbrom)、シアゾファミド (cyazofamid)、

ジノカップ (dinocap)、フルアジナム (fluazinam)、メプチルジノカップ (meptyldinocap)、

フェンチン (fentin)、トリブチル錫オキシド (tributyltin oxide)、

シルチオフアム (silthiofam)、

アメトクトラジン (ametoctradin)、

フェンピコキサミド (fenicoxamid)。

[0342] D ; アミノ酸及びタンパク質生合成阻害剤

シプロジニル (cyprodinil)、メパニピリム (mepanipyrim)、ピリメタニル (pyrimethanil)、

ブラストサイジン-S (blasticidin-S)、

カスガマイシン (kasugamycin)、

E ; シグナル伝達系に作用する薬剤

プロキナジド (proquinazid) 、キノキシフェン (quinoxifen) 、
フェンピクロニル (fenpiclonil) 、フルジオキシソニル (fludioxonil)

、
クロゾリネート (chlozolate) 、イプロジオン (iprodone) 、プロシ
ミドン (procymidone) 、ビクロゾリン (vinclozolin) 。

[0343] F ; 脂質合成及び細胞膜形成阻害剤

エジフェンホス (edifenphos) 、イプロベンホス (iprobenfos) 、イソ
プロチオラン (isoprothiolane) 、ピラゾホス (pyrazophos) 、
ビフェニル (biphenyl) 、クロロネブ (chloroneb) 、ジクロラン (dicl
oran) 、エトリジアゾール (etridiazole) 、キントゼン (quintozene) 、テ
クナゼン (tecnazene) 、トルクロホス—メチル (tolclofos-methyl) 、
プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride) 、
バチルス ズブチリス (Bacillus subtilis, Strain:D747, FZB24, GB03
, HAI0404, MBI600, QST713, Y1336等) 。

[0344] G ; ステロール生合成阻害剤

アザコナゾール (azaconazole) 、ビテルタノール (bitertanol) 、ブロ
ムコナゾール (bromuconazole) 、シプロコナゾール (cyproconazole) 、ジ
フェノコナゾール (difenoconazole) 、ジニコナゾール (diniconazole) 、
ジニコナゾール—M (diniconazole-M) 、エポキシコナゾール (epoxiconazo
le) 、エタコナゾール (etaconazole) 、フェナリモル (fenarimol) 、フェ
ンブコナゾール (fenbuconazole) 、フルキンコナゾール (fluquinconazole
) 、フルシラゾール (flusilazole) 、フルトリアホル (flutriafol) 、ヘ
キサコナゾール (hexaconazole) 、イマザリル (imazalil) 、イミベンコナ
ゾール (imibenconazole) 、イプコナゾール (ipconazole) 、イプフェント
リフルコナゾール (ipfentrifluconazole) 、メフェントリフルコナゾール (mefentrifluconazole) 、メトコナゾール (metconazole) 、ミクロブタニル
(myclobutanil) 、ヌアリモール (nuarimol) 、オキスポコナゾールフマル

酸塩 (oxpoconazole fumarate)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (penconazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、ピリフェノックス (pyrifenoxy)、ピリソキサゾール (pyrisoxazole)、シメコナゾール (simeconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリホリン (triforine)、トリチコナゾール (triticonazole)、アルジモルフ (aldimorph)、ドデモルフ酢酸塩 (dodemorph-acetate)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、ピペラルイン (piperalin)、スピロキサミン (spiroxamine)、トリデモルフ (tridemorph)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フェンピラザミン (fenpyrazamine)。

[0345] H ; 細胞壁合成阻害剤

バリダマイシン (validamycin)、ポリオキシシン (polyoxins)、ポリオキシシン-D (polyoxorim)、ベンチアバリカルブ-イソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl)、ジメトモルフ (dimethomorph)、フルモルフ (flumorph)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、マンジプロパミド (mandipropamid)、ピリモルフ (pyrimorph)、バリフェナレート (valifenalate)、

I ; メラニン合成阻害剤

フサライド (phthalide)、ピロキロン (pyroquilon)、トリシクラゾール (tricyclazole)、カルプロパミド (carpropamid)、ジクロシメット (diclocymet)、フェノキサニル (fenoxanil)。

[0346] P ; 植物の抵抗性誘導剤

アシベンゾラル-S-メチル (acibenzolar-S-methyl)、

ジクロベンチアゾックス (dichlobentiazox)、プロベナゾール (probenazole)、

イソチアニル (isotianil)、チアジニル (tiadinil)、

ラミナリン (laminarin)。

[0347] M；多作用点の薬剤

ボルドー液 (bordeaux mixture)、チェシュントミクスチャ (cheshunt mixture)、塩基性炭酸銅 (copper carbonate, basic)、水酸化第二銅 (copper hydroxide)、銅ナフテネート (copper naphthenate)、銅オレエート (copper oleate)、塩基性塩化銅 (copper oxychloride)、硫酸銅 (copper sulfate)、塩基性硫酸銅 (copper sulfate, basic)、オキシキノリン銅 (oxine copper)、石灰硫黄合剤 (calcium polysulfide)、硫黄 (sulfur)、アンバム (amobam)、ファーバム (ferbam)、マンコゼブ (mancozeb)、マンネブ (maneb)、メチラム (metiram)、ポリカーバメート (polycarbamate)、プロピネブ (propineb)、チウラム (thiram)、ジラム (ziram)、キャプタン (captan)、フォルペット (folpet)、クロロタロニル (chlorothalonil)、ジクロフルアニド (dichlofluanid)、トリルフルアニド (tolylfluanid)、グアザチン (guazatine)、イミノクタジン-アルベシル酸塩 (iminooctadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩 (iminooctadine-triacetate)、アニラジン (anilazine)、ジチアノン (dithianon)、キノメチオネート (chinomethionat)、フルオルイミド (fluoroimide)。

[0348] UN；作用機作不明及びその他の薬剤

シフルフェナミド (cyflufenamid)、シモキサニル (cymoxanil)、ジクロメジン (diclomezine)、ジピメチトロン (dipymetitrone)、ドジン (dodine)、フェリムゾン (ferimzone)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルチアニル (flutianil)、ホセチルーアルミニウム (fosetyl-aluminium)、メトラフェノン (metrafenone)、オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin)、ピカルブトラゾックス (picarbutrazox)、ピリオフェノン (pyriofenone)、キノフメリン (quinofumelin)、テブフロキン (tebufloquin)、ト

ルプロカルブ (tolprocarb)、トリアゾキシド (triazoxide)、炭酸水素カリウム (potassium hydrogen carbonate)、炭酸水素ナトリウム (sodium hydrogen carbonate)、シイタケ菌糸体抽出物、シイタケ子実体抽出物、BCF-082 (試験名)、ZF-9646 (試験名)。

[0349] 殺虫・殺ダニ剤：

A；アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤

アラニカルブ (alanycarb)、アルジカルブ (aldicarb)、ベンダイオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、ブトカルボキシム (butocarboxim)、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、エチオフエンカルブ (ethiofencarb)、フェノブカルブ (fenobucarb)、ホルメタネート (formetanate)、フラチオカルブ (furathiocarb)、イソプロカルブ (isoprocarb)、メチオカルブ (methiocarb)、メソミル (methomyl)、ピリミカーブ (pirimicarb)、チオジカルブ (thiodicarb)、チオフアノックス (thiofanox)、トリアザメート (triazamate)、

アセフェート (acephate)、アザメチホス (azamethiphos)、アジンホスーエチル (azinphos-ethyl)、アジンホスーメチル (azinphos-methyl)、クロルエトキシホス (chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、クロルメホス (chlormephos)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホスーメチル (chlorpyrifos-methyl)、シアノホス (cyanophos)、ダイアジノン (diazinon)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジメトエート (dimethoate)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジスルフオトン (disulfoton)、イーピーエヌ (EPN)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェンチオン (fenthion)、イソキサチオン (isoxathion)、馬拉チオン (malathion)、メタミドホス (methamidophos)、メチダチオン (methidathion)、オメトエート (omethoate)、オキシジメトンーメチル (oxydemeton-methyl)、パラチオンーメチル (parathion-methyl)、フェントエート (phenthoate)、ホレート (phorate)、ホサロン (phosalone)、ホスメット (ph

osmet)、ホキシム (phoxim)、ピリミホスーメチル (pirimiphos-methyl)、プロフェノホス (profenofos)、プロチオホス (prothiofos)、ピラクロホス (pyraclofos)、スルホテップ (sulfotep)、テルブホス (terbufos)、テトラクロロビンホス (tetrachlorvinphos)、チオメトン (thiometon)、トリクロルホン (trichlorfon)。

[0350] B ; G A B A 作動性塩素イオンチャネルアンタゴニスト

エンドスルファン (endosulfan)、アルファ-エンドスルファン (alpha-endosulfan)、

エチプロール (ethiprole)、フィプロニル (fipronil)、フルフィプロール (flufiprole)、ピリプロール (pyriprole)、

アフォキサネル (afoxolaner)、フルララネル (fluralaner)、ロチラネル (lotilaner)、サロラネル (sarolaner)。

C ; ナトリウムチャネルモジュレーター

アクリナトリン (acrinathrin)、アレスリン (allethrin)、ベンフルトリン (benfluthrin)、ビフェントリン (bifenthrin)、カッパービフェントリン (kappa-bifenthrin)、バイオアレスリン (bioallethrin)、バイオレスメトリン (bioresmethrin)、クロルプラレトリン (chloroprallethrin)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、シフルトリン (cyfluthrin)、ベーターシフルトリン (beta-cyfluthrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、ガンマーシハロトリン (gamma-cyhalothrin)、ラムダーシハロトリン (lambda-cyhalothrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、アルファ-シペルメトリン (alpha-cypermethrin)、ベーターシペルメトリン (beta-cypermethrin)、ゼターシペルメトリン (zeta-cypermethrin)、シフェノトリン (cyphenothrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、エンペントリン (empenthrin)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エトフェンプロックス (etofenprox)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンバレレート (fenvalerate)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルメトリン (flumethrin)、フルバリネート (fluvalinate)、タウフルバリネート (tau-fluvalin)

ate)、ハルフェンプロックス (halfenprox)、ヘプタフルトリン (heptafluthrin)、イミプロトリン (imiprothrin)、メペルフルトリン (meperfluthrin)、メトフルトリン (metofluthrin)、イプシロン-メトフルトリン (epsilon-metofluthrin)、モムフルオロトリン (momfluorothrin)、イプシロン-モムフルオロトリン (epsilon-momfluorothrin)、ペルメトリン (permethrin)、フェノトリン (phenothrin)、ピレトリン (pyrethrins)、レスメトリン (resmethrin)、シラフルオフエン (silafluofen)、テフルトリン (tefluthrin)、カッパーテフルトリン (kappa-tefluthrin)、テトラメスリン (tetramethrin)、d-T-80-フタルスリン (d-tetramethrin)、テトラメチルフルスリン (tetramethylfluthrin)、トラロメトリン (tralomethrin)、トランスフルトリン (transfluthrin)、
メトキシクロル (methoxychlor)。

[0351] D ; ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) アゴニスト

アセタミプリド (acetamiprid)、クロチアニジン (clothianidin)、ジノテフラン (dinotefuran)、イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyram)、チアクロプリド (thiacloprid)、チアメトキサム (thiamethoxam)、

スルホキサフロール (sulfoxaflor)、

フルピラジフロロン (flupyradifurone)。

E ; ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) アロステリックモジュレーター

スピネトラム (spinetoram)、スピノサド (spinosad)。

F ; 塩素イオンチャネルアクチベーター

アバメクチン (abamectin)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、レピメクチン (lepimectin)、ミルベメクチン (milbemectin)。

G ; 幼若ホルモン類似剤

メソプレン (methoprene)、

フェノキシカルブ (fenoxycarb)、

ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)。

[0352] H ; 半翅目選択的摂食阻害剤

ピメトロジン (pymetrozine)、

フロニカミド (flonicamid)。

I ; ダニ類成長阻害剤

クロフェンテジン (clofentezine)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)

、

エトキサゾール (etoxazole)。

J ; 微生物由来昆虫中腸内膜破壊剤

バチルスチューリングエンシス (bacillus thuringiensis, subsp. israelensis, subsp. aizawai, subsp. kurstaki, subsp. tenebrionis等)

K ; ミトコンドリア ATP 合成酵素阻害剤

ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、

アゾシクロチン (azocyclotin)、フェンブタチン-オキシド (fenbutat in oxide)、

プロパルギット (propargite)。

L ; 酸化的リン酸化脱共役剤

クロルフェナピル (chlorfenapyr)、

M ; ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) チャンネルブロッカー
ベンスルタップ (bensultap)、カルタップ (cartap)、チオシクラム (thiocyclam)。

[0353] N ; キチン生合成阻害剤 (タイプO)

ビストリフルロン (bistrifluron)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、フルシクロクスロン (flucyclooxuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ルフェヌロン (lufenuron)、ノバルロン (novaluron)、ノビフルムロン (noviflumuron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、トリフルムロン (triflumuron)。

O ; キチン生合成阻害剤 (タイプ1)

ブプロフェジン (buprofezin) 。

[0354] P ; 脱皮阻害剤 (ハエ目昆虫)

シロマジン (cyromazine)

Q ; 脱皮ホルモン (エクダイソン) 受容体アゴニスト

クロマフェノジド (chromafenozide) 、 ハロフェノジド (halofenozide) 、 メトキシフェノジド (methoxyfenozide) 、 テブフェノジド (tebufenozide) 。

R ; オクトパミン受容体アゴニスト

アミトラズ (amitraz)

S ; ミトコンドリア電子伝達系複合体III阻害剤

ヒドラメチルノン (hydramethylnon) 、

アセキノシル (acequinocyl) 、

フルアクリピリム (fluacrypyrim) 。

[0355] T ; ミトコンドリア電子伝達系複合体I阻害剤

フェナザキン (fenazaquin) 、 フェンピロキシメート (fenproximate) 、 ピリミジフェン (pyrimidifen) 、 ピリダベン (pyridaben) 、 テブフェンピラド (tebufenpyrad) 、 トルフエンピラド (tolfenpyrad) 、 ロテノン (rotenone) 。

U ; 電位依存性ナトリウムチャネルブロッカー

インドキサカルブ (indoxacarb) 、 インドキサカルブ-MP (indoxacarb-MP) 、

メタフルミゾン (metaflumizone) 。

V ; アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤

スピロジクロフェン (spirodiclofen) 、 スピロメシフェン (spiromesifen) 、 スピロテトラマト (spirotetramat) 。

[0356] W ; ミトコンドリア電子伝達系複合体II阻害剤

シエノピラフェン (cyenopyrafen) 、 シフルメトフェン (cyflumetofen)

)。

X ; リアノジン受容体モジュレーター

クロルアントラニリプロール (chlorantraniliprole) 、シアントラニリプロール (cyantraniliprole) 、シクラニリプロール (cyclaniliprole) 、シハロジアミド (cyhalodiamide) 、フルベンジアミド (flubendiamide) 、テトラニリプロール (tetraniliprole) 。

UN ; 作用機作不明及びその他の薬剤

アザジラクチン (azadirachtin) 、ベンゾキシメート (benzoximate) 、ピフェナゼート (bifenazate) 、ブromoプロピレート (bromopropylate) 、ジコホール (dicofol) 、ピリダリル (pyridalyl) 、ピリフルキナゾン (pyr ifluquinazon) 、

アシノナピル (acynonapyr) 、アフィドピロペン (afidopyropen) 、ベンズピリモキサン (benzpyrimoxan) 、ブロフラニリド (broflanilide) 、ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz) 、フロメトキン (flometoquin) 、フルヘキサホン (fluhexafon) 、フルキサメタミド (fluxametamide) 、ピフルブミド (pyflubumide) 、トリフルメゾピリム (triflumezopyrim) 、ME 5 3 8 2 (試験名) 、NC - 5 1 5 (試験名) 及びZD I 2 5 0 1 (試験名) 。

[0357] 殺線虫剤 : カズサホス (cadusafos) 、ジクロフェンチオン (dichlofenthion) 、エトプロホス (ethoprophos) 、フェナミホス (fenamiphos) 、フルエン sulfon (fluensulfone) 、フルアザインドリジン (fluazaindolizine) 、ホスチアゼート (fosthiazate) 、フォスチエタン (fosthietan) 、イミシアホス (imicyafos) 、イサミドホス (isamidofos) 、イサゾホス (isazofos) 、臭化メチル (methyl bromide) 、メチルイソチオシアネート (methyl isothiocyanate) 、オキサミル (oxamyl) 、アジ化ナトリウム (sodium azide) 、チオキサザフェン (tioxazafen) 、BY I - 1 9 2 1 (試験名) 及びM A I - 0 8 0 1 5 (試験名) 。

[0358] 駆虫剤 : アクリフラビン (acriflavine) 、アルベンダゾール (albendazol

e)、アトバコン (atovaguone)、アジスロマイシン (azithromycin)、ビチオノール (bithionol)、ブロムフェノホス (bromofenofos)、カンベンダゾール (cambendazole)、カルニダゾール (carnidazole)、クロロキン (chloroquine)、クラズリル (clazuril)、クリンダマイシン (clindamycin hydrochloride)、クロルスロン (clorsulon)、クロサンテル (closantel)、クマホス (coumaphos)、シミアゾル (cymiazol)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジエチルカルバマジン (diethylcarbamazine)、ジミナゼン (diminazene)、ジソフェノール (disophenol)、ヨウ化ジチアザニン (dithiazanine iodide)、ドキシサイクリン (doxycycline hydrochloride)、ドラメクチン (doramectin)、エモデプシド (emodepside)、エプリノメクチン (eprinomectin)、フェバンテル (febantel)、フェンベンダゾール (fenbendazole)、フルベンダゾール (flubendazole)、フラゾリドン (furazolidone)、グリカルピラミド (glycalpyramide)、イミドカルブ (imidocarb)、イベルメクチン (ivermectin)、レバミゾール (levamisole)、メベンダゾール (mebendazole)、メフロキン (mefloquine)、メラルソミン二塩酸塩 (mela rsamine hydrochloride)、メトロニダゾール (metronidazole)、メチリジン (metyridine)、ミルベマイシンオキシム (milbemycin oxime)、モネパンテル (monepantel)、酒石酸モランテル (morantel tartrate)、モキシデクチン (moxidectin)、ナイカルバジン (nicarbazin)、ニコロサミド (niclosamide)、ニトロスカネート (nitroscanate)、ニトロキシニル (nitroxy nil)、オムファロチン (omphalotin)、パモ酸オキササンテル (oxantel pamoate)、酒石酸オキササンテル (oxantel tartrate)、オクスフェンダゾール (oxfendazole)、オキシベンダゾール (oxibendazole)、オキシクロザニド (oxyclozanide)、パマキン (pamaquine)、フェノチアジン (phenothiazine)、アジピン酸ピペラジン (piperazine adipate)、クエン酸ピペラジン (piperazine citrate)、リン酸ピペラジン (piperazine phosphate)、PNU-97333 (paraherquamide A)、PNU-141962 (2-deoxyparaherquamide)、プラジクアンテル (praziquantel)、プリマキン (primaquin

e)、プロペタムホス (propetamphos)、プロポクスル (propoxur)、パモ酸ピランテル (pyrantel pamoate)、ピリメタミン (pyrimethamine)、サントニン (santonin)、セラメクチン (selamectin)、スルファジメトキシン (sulfadimethoxine)、スルファドキシン (sulfadoxine)、スルファメラジン (sulfamerazine)、スルファモノメトキシン (sulfamonomethoxine)、スルファモイルダプソン (sulfamoildapsone)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チニダゾール (tinidazole)、トルトラズリル (toltrazuril)、トリブロムサラン (tribromsalan)、トリクラベンダゾール (triclabendazole)。

抗真菌剤：クリムバゾール (climbazole)、ケトコナゾール (ketoconazole) 及びミコナゾール硝酸塩 (miconazole nitrate)。

[0359] 抗菌剤：アモキシシリン (amoxicillin)、アンピシリン (ampicillin)、ベトキサジン (bethoxazin)、ピチオノール (bithionol)、ブロンポール (bronopol)、セファピリン (cefapirin)、セファゾリン (cefazolin)、セフキノム (cefquinome)、セフチオフル (ceftiofur)、クロルテトラサイクリン (chlortetracycline)、クラブラン酸 (clavulanic acid)、ダノフロキサシン (danofloxacin)、ジフロキサシン (difloxacin)、ジニトルミド (dinitolmide)、エンロフロキサシン (enrofloxacin)、フロルフエニコール (florfenicol)、リンコマイシン (lincomycin)、ロメフロキサシン (lomefloxacin)、マルボフロキサシン (marbofloxacin)、ミロキサシン (mloxacin)、ミロサマイシン (mirosamycin)、ニトラピリン (nitrapyrin)、ノルフロキサシン (norfloxacin)、オクチリノン (octhilinone)、オフロキサシン (ofloxacin)、オルビフロキサシン (orbifloxacin)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)、ペニシリン (penicillin)、ストレプトマイシン (streptomycin)、チアンフェニコール (thiamphenicol)、フマル酸チアムリン (tiamulin fumarate)、リン酸チルミコシン (tilmicosin phosphate)、酢酸イソ吉草酸タイロシン (acetylisovaleryltylosin)、リン酸タイロシン (tylosin phosphate)

）、ツラスロマイシン (tulathromycin)、バルネムリン (valnemulin)、貝殻焼成カルシウム (酸化カルシウム)、タラロマイセス属菌、トリコデルマ属菌、コニオチリウム属菌。

実施例

[0360] 以下に本発明化合物の合成例、試験例を実施例として具体的に述べることで、本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

[0361] [合成例]

合成例 1

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (本発明化合物No.1-004)。

工程 1 ; 2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロアセトニトリルの製造

2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)アセトニトリル 2.00 g のテトラヒドロフラン 40 ml 溶液に、 -78°C にて攪拌下、リチウムビス(トリメチルシリル)アミドの 1.3 M テトラヒドロフラン溶液 16 ml を滴下し、滴下終了後、同温度にて 30 分間攪拌した。次いで、この反応混合物に N-フルオロベンゼンスルホンイミド 6.00 g のテトラヒドロフラン 25 ml 溶液を滴下し、滴下終了後、同温度にてさらに 3 時間攪拌を継続した。反応完了後、反応混合物に水 50 ml を加えヘキサンにて抽出 (50 ml x 3) した。有機層を併せ水洗 (50 ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー {酢酸エチル-ヘキサン [0 : 100 ~ 5 : 95 (体積比、以下同様である。)] のグラジエント} にて精製し、目的物 0.81 g を淡黄色油状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300 MHz) δ 8.66 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 8.08 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H)。

[0362] 工程 2 ; 2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロエチルアミンの製造

窒素雰囲気下の 2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロアセトニトリル 810mg のジクロロメタン 20ml 溶液に、-78℃にて攪拌下、ジイソブチルアルミニウムヒドライドの 1.0Mヘキサン溶液 9ml を滴下し、滴下終了後、同温度にて 2 時間攪拌した。次いで、反応混合物に酒石酸カリウムナトリウム（ロッシェル塩）飽和水溶液 20ml 及びジクロロメタン 20ml を添加し、室温にてさらに 2 時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物に水 30ml を加え有機層を分取し、得られた有機層を飽和ロッシェル塩水溶液（20ml x 1）、次いで水（20ml x 2）にて洗浄した後、減圧下にて溶媒を留去、粗製の目的物 607mg を褐色油状物質として得た。このものはさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.56 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 8.00 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 3.49 (t, $J=13.8\text{Hz}$, 2H)。

[0363] 工程 3 ; N-[2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロエチルアミン 607mg 及びトリエチルアミン 271mg の、ジクロロメタン 5ml 溶液に、二炭酸ジ-tert-ブチル 584mg を添加し、室温にて 2 時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー [酢酸エチル-ヘキサン(0:10~1:9のグラジエント)]にて精製し、目的物 430mg を淡黄色油状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 8.00 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 5.05 (bs, 1H), 4.0-4.2 (m, 2H), 1.40 (s, 9H)。

[0364] 工程 4 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

N-[2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフル

オロエチル]カルバミド酸-tert-ブチル 1.50gのN,N-ジメチルホルムアミド4ml溶液に、トリエチルアミン1.64g、1-エチニル-4-フルオロベンゼン631mg、ヨウ化銅(I)231mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)283mgを添加し、窒素雰囲気下、室温にて2時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液15mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(20mlx1)した。得られた有機層を水洗(10mlx2)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(0:10~2:8のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物1.40gを白色結晶として得た。

融点107.0~108.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.57 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.5-7.6 (m, 2H), 7.05-7.15 (m, 2H), 5.10 (bs, 1H), 4.0-4.2 (m, 2H), 1.41 (s, 9H)。

[0365] 工程5 ; 2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチルアミンの製造

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]カルバミド酸-tert-ブチル1.40gのジクロロメタン5ml溶液に、トリフルオロ酢酸3mlを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸カリウム水溶液10mlを加えて、酢酸エチルにて抽出(10mlx2)した。有機層を併せ水洗(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物1.01gを褐色油状物質として得た。このものはさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.59 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.91 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.5-7.6 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 2H), 3.4-3.6 (m, 2H)。

[0366] 工程6 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]

ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチルアミン 90 mgの酢酸エチル 2 ml溶液に、10重量%炭酸カリウム水溶液 2 ml及び2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド 67 mgを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水 10 ml添加し、酢酸エチルにて抽出 (10 ml x 2) した。有機層を併せ水洗 (10 ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィ [酢酸エチル-ヘキサン(0 : 10 ~ 2 : 8のグラジエント)] にて精製し、目的物 105 mgを白色結晶として得た。

融点 164.0 ~ 166.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.54 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.45-7.7 (m, 6H), 7.0-7.15 (m, 2H), 6.45 (bs, 1H), 4.4-4.55 (m, 2H)。

[0367] 合成例 2

2-クロロ-N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロプロピル]ニコチンアミド (本発明化合物No. 3-010)。

工程 1 ; 5-ブロモ-3-クロロ-2-(2-メチルオキシラン-2-イル)ピリジンの製造

トリメチルスルホキソニムヨージド 5.2 gのジメチルスルホキシド 15 ml溶液に、氷冷攪拌下、55重量%油性水素化ナトリウム 1.1 gを添加し、同温度にて30分間攪拌した。次いで、この反応混合物を、氷冷攪拌下、1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エタン-1-オン 5.0 gのジメチルスルホキシド 10 ml溶液に滴下し、滴下終了後、室温にてさらに15時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物に水 20 mlを加え、酢酸エチルにて抽出 (30 ml x 1) した。得られた有機層を水洗 (30 ml x 1) 後、飽和

食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー〔酢酸エチルーヘキサン(0 : 10 ~ 3 : 7のグラジエント)〕にて精製し、目的物5.7gを褐色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.66 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 8.36 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 3.03 (d, $J=5.2\text{Hz}$, 1H), 2.92 (d, $J=5.2\text{Hz}$, 1H), 1.58 (s, 3H)

。

[0368] 工程2 ; N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-ヒドロキシプロピル]フタルイミドの製造

5-ブロモ-3-クロロ-2-(2-メチルオキシラン-2-イル)ピリジン5.70gのジメチルスルホキシド40ml溶液にフタルイミドカリウム4.48gを添加し、100℃にて6時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、水30mlを加え、酢酸エチルにて抽出(20mlx2)した。有機層を併せて水洗(40mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー〔酢酸エチルーヘキサン(1 : 9 ~ 3 : 7のグラジエント)〕にて精製し、目的物3.90gを褐色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.3-8.4 (m, 1H), 7.9-7.95 (m, 1H), 7.7-7.8 (m, 2H), 7.65-7.7 (m, 2H), 5.64 (s, 1H), 4.31 (d, $J=14.0\text{Hz}$, 1H), 4.21 (d, $J=14.0\text{Hz}$, 1H), 1.80 (s, 3H)。

[0369] 工程3 ; N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-フルオロプロピル]フタルイミドの製造

氷冷攪拌下のN-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-ヒドロキシプロピル]フタルイミド3.90gのジクロロメタン20ml溶液に、ビス(2-メトキシエチル)アミノサルファートリフルオリド2.62gを滴下し、滴下終了後、50℃にて12時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液30mlを加え、ジクロロメタンにて抽出(20mlx2)した。有機層を併せて水洗(40mlx1)後、

飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をジイソプロピルエーテル10mlにて洗浄し、目的物3.50gを淡黄色結晶として得た。

融点134.0~136.0℃

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.45-8.55 (m, 1H), 7.85-7.9 (m, 1H), 7.8-7.85 (m, 2H), 7.7-7.8 (m, 2H), 4.3-4.55 (m, 2H), 1.82 (d, $J=22.4\text{Hz}$, 3H)。

[0370] 工程4 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロプロピル]フタルイミドの製造

N-[2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2-フルオロプロピル]フタルイミド1.0gのN,N-ジメチルホルムアミド4ml溶液に、トリエチルアミン762mg、1-エチニル-4-フルオロベンゼン452mg、ヨウ化銅(I)143mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)176mgを添加し、窒素雰囲気下、60℃にて5時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和塩化アンモニウム水溶液10mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(10mlx1)した。得られた有機層を水洗(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー[酢酸エチル-ヘキサン(5:95~10:90のグラジエント)]にて精製し、目的物1.2gを褐色結晶として得た。

融点153.0~155.0℃

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.45-8.55 (m, 1H), 7.8-7.9 (m, 3H), 7.7-7.75 (m, 2H), 7.45-7.6 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 2H), 4.3-4.6 (m, 2H), 1.86 (d, $J=23.0\text{Hz}$, 3H)。

[0371] 工程5 ; 2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロプロピルアミンの製造

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロプロピル]フタルイミド1.2gのエタノール4ml

溶液に、ヒドラジン-水和物 432 mg を添加し、80℃にて5時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 5 ml を加え、酢酸エチルにて抽出 (10 ml x 2) した。有機層を併せて水洗 (10 ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー [酢酸エチル-ヘキサン (5 : 5 ~ 9 : 1 のグラジエント)] にて精製し、目的物 323 mg を褐色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.45-8.75 (m, 1H), 7.75-8.05 (m, 1H), 7.45-7.75 (m, 2H), 7.0-7.3 (m, 2H), 3.05-3.8 (m, 2H), 1.74 (d, $J=23.0\text{Hz}$, 3H), 1.05-1.45 (m, 2H)。

[0372] 工程 6 ; 2-クロロ-N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロプロピル]ニコチンアミドの製造

氷冷攪拌下の 2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロプロピルアミン 100 mg 及びトリエチルアミン 50 mg の、ジクロロメタン 1 ml 溶液に、2-クロロニコチニルクロリド 63 mg を滴下し、滴下終了後、室温にて1時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物に水 2 ml 添加して、ジクロロメタンにて抽出 (5 ml x 1) した。得られた有機層を水洗 (5 ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン (2 : 8 ~ 5 : 5 のグラジエント) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 69 mg を白色結晶として得た。

融点 149.0 ~ 151.0℃

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.54 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 8.4-8.45 (m, 1H), 8.05-8.1 (m, 1H), 7.86 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.45-7.6 (m, 2H), 7.3-7.35 (m, 1H), 7.2-7.25 (m, 1H), 7.05-7.15 (m, 2H), 4.15-4.4 (m, 2H), 1.90 (d, $J=21.0\text{Hz}$, 3H)。

[0373] 合成例 3

N-[2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]-3-(トリフルオロメチル)チオフェン-2-カルボキサミド (本発明化合物No.7-006)。

工程1 ; 2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチルアミンの製造

合成例1の工程1にて製造した2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロアセトニトリル1.0gのジエチルエーテル5ml溶液に、氷冷攪拌下、メチルマグネシウムブロミドの35重量%ジエチルエーテル溶液3.1mlを滴下し、同温度にて1時間攪拌した。次いで、この反応混合物に、氷冷攪拌下、メタノール15mlを添加した後水素化ホウ素ナトリウム423mgを添加し、同温度にてさらに1時間攪拌を継続した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和塩化アンモニウム水溶液10mlを加え、酢酸エチルにて抽出(15mlx2)した。有機層を併せ水洗(20mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物1.0gを褐色樹脂状物質として得た。このものはさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55-8.65 (m, 1H), 7.95-8.0 (m, 1H), 3.7-3.95 (m, 1H), 1.5-1.6 (m, 2H), 1.23 (d, $J=6.7\text{Hz}$, 3H)。

[0374] 工程2 ; N-[2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

2-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチルアミン1.0gのジクロロメタン5mlに、二炭酸ジ-tert-ブチル895mg及びトリエチルアミン566mgを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水10mlを加え、ジクロロメタンにて抽出(10mlx1)した。得られた有機層を水洗(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー [酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)]にて精製し、目的物1.3gを褐色樹脂状物

質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55–8.6 (m, 1H), 7.95–8.0 (m, 1H), 4.5–4.9 (m, 1H), 1.35 (d, $J=7.0\text{Hz}$, 3H), 1.29 (bs, 9H)。

[0375] 工程3 ; N-[2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチル 1.3gのN,N-ジメチルホルムアミド 3ml溶液に、トリエチルアミン 1.1g、シクロプロピルアセチレン 493mg、ヨウ化銅(I) 213mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II) 262mgを添加し、窒素雰囲気下、室温にて18時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液 10mlを添加し、酢酸エチルにて抽出 (10mlx1) した。得られた有機層を水洗 (10mlx1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー [酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)]にて精製し、目的物 750mgを褐色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.4–8.45 (m, 1H), 7.7–7.75 (m, 1H), 7.35–7.4 (m, 1H), 4.6–4.8 (m, 1H), 1.4–1.5 (m, 1H), 1.33 (d, $J=6.7\text{Hz}$, 3H), 1.30 (s, 9H), 0.9–1.0 (m, 2H), 0.8–0.9 (m, 2H)。

[0376] 工程4 ; 2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチルアミンの製造

N-[2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチル 750mgのジクロロメタン 5ml溶液に、トリフルオロ酢酸 2.5mlを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10mlを加え、酢酸エチルにて抽出 (10mlx2) した。有機層を併せ水洗 (10mlx1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナ

トリウム順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物 660mg を褐色樹脂状物質として得た。このものはさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.46 (d, $J=1.5\text{Hz}$, 1H), 7.74 (d, $J=1.5\text{Hz}$, 1H), 3.7-3.9 (m, 1H), 1.5-1.7 (m, 2H), 1.4-1.55 (m, 1H), 1.21 (d, $J=6.7\text{Hz}$, 3H), 0.9-1.0 (m, 2H), 0.8-0.9 (m, 2H)。

[0377] 工程 5 ; N-[2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]-3-(トリフルオロメチル)チオフエン-2-カルボキサミドの製造

2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチルアミン 150mg の N,N-ジメチルホルムアミド 3ml 溶液に、トリエチルアミン 62mg、N,N-ジメチル-4-アミノピリジン 5mg、3-(トリフルオロメチル)チオフエン-2-カルボン酸 120mg 及び 1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 212mg を添加し、室温にて 16 時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水 10ml 添加し、酢酸エチルにて抽出 (10ml x 2) した。有機層を併せ水洗 (10ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー [酢酸エチル-ヘキサン (3 : 7 ~ 5 : 5 のグラジエント)] にて精製し、目的物 23mg を淡黄色結晶として得た。

融点 98.0 ~ 101.0 °C

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.41 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.76 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.4-7.5 (m, 1H), 7.35-7.4 (m, 1H), 6.85-7.05 (m, 1H), 5.1-5.3 (m, 1H), 1.5-1.55 (m, 1H), 1.45 (d, $J=6.8\text{Hz}$, 3H), 0.9-1.0 (m, 2H), 0.8-0.9 (m, 2H)。

[0378] 合成例 4

N-[2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]-N-シクロプロピル-2-(

トリフルオロメチル)ベンズアミド (本発明化合物No. 15-001)。

工程 1 ; 1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-1,1-ジフルオロプロパン-2-オンの製造

合成例 1 の工程 1 にて製造した 2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロアセトニトリル 1.0g のジエチルエーテル 5ml 溶液に、氷冷攪拌下、メチルマグネシウムブロミドの 35 重量%ジエチルエーテル溶液 3.1ml を滴下し、同温度にて 1 時間攪拌した。次いで、この反応混合物を、氷冷攪拌下、4 M 塩酸水溶液 20ml に滴下し、滴下終了後、同温度にてさらに 1 時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物を酢酸エチルにて抽出 (15ml x 1) した。得られた有機層を水洗 (10ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物 920mg を褐色油状物質として得た。このものは更なる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 8.01 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 2.47 (s, 3H)。

[0379] 工程 2 ; N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]-N-シクロプロピルアミンの製造

1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-1,1-ジフルオロプロパン-2-オン 920mg のメタノール-酢酸 (10 : 1) 2.2ml 溶液に、シクロプロピルアミン 203mg を添加し、90°C にて 1 時間攪拌した。次いで、この反応混合物を、室温まで放冷後、ピコリンボラン錯体 381mg を添加し、90°C にてさらに 2 時間攪拌を継続した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10ml を添加し、酢酸エチルにて抽出 (20ml x 2) した。有機層を併せ水洗 (20ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物 830mg を褐色油状物質として得た。このものは更なる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55-8.6 (m, 1H), 7.9-8.0 (m, 1H), 3.

6-3.85 (m, 1H), 2.15-2.3 (m, 1H), 1.65-1.85 (m, 1H), 1.29 (d, J=7.4Hz, 3H), 0.05-0.55 (m, 4H)。

[0380] 工程3 ; N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]-N-シクロプロピル-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]-N-シクロプロピルアミン300mg及びトリエチルアミン112mgの、ジクロロメタン2ml溶液に、氷冷攪拌下、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド211mgを滴下し、40℃にて5時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷、水2mlを加え、ジクロロメタンにて抽出(10mlx1)した。得られた有機層を水洗(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー〔酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)〕にて精製し、目的物130mgを無色樹脂状物質として得た。

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.45-8.7 (m, 1H), 7.9-8.0 (m, 1H), 7.55-7.75 (m, 2H), 7.35-7.55 (m, 2H), 5.8-6.1 (m, 1H), 2.4-2.65 (m, 1H), 1.56 (d, J=7.0Hz, 3H), 0.45-0.8 (m, 3H), 0.3-0.45 (m, 1H)。

[0381] 工程4 ; N-[2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]-N-シクロプロピル-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]-N-シクロプロピル-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド100mgのN,N-ジメチルホルムアミド1ml溶液に、トリエチルアミン61mg、シクロプロピルアセチレン26mg、ヨウ化銅(I)11mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)14mgを添加し、窒素雰囲気下、室温にて5時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に、飽和塩化アンモニウム水溶液10mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(10mlx1)し

た。得られた有機層を水洗（10ml×1）後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー〔酢酸エチル-ヘキサン（1：9～3：7のグラジエント）〕にて精製し、目的物79mgを褐色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.45-8.55 (m, 1H), 7.73 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.6-7.65 (m, 1H), 7.35-7.5 (m, 3H), 5.9-6.1 (m, 1H), 2.45-2.6 (m, 1H), 1.55 (d, $J=9.0\text{Hz}$, 3H), 1.4-1.5 (m, 1H), 0.9-1.05 (m, 2H), 0.8-0.9 (m, 2H), 0.6-0.7 (m, 2H), 0.25-0.4 (m, 2H)。

[0382] 合成例5

N-[2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1,1-ジメチルエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド（本発明化合物No.1-017）。

工程1；2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1,1-ジメチルエチルアミンの製造

合成例1の工程1にて製造した2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロアセトニトリル423mgのジエチルエーテル3ml溶液に、氷冷攪拌下、メチルマグネシウムブロミドの3Mジエチルエーテル溶液2mlを滴下し、同温度にて30分間攪拌した。次いで、この反応混合物に、氷冷攪拌下、チタニウム(IV)テトライソプロポキシド568mgを添加し、室温にてさらに4時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物に、水酸化ナトリウム300mgの水10ml溶液を加え、ジエチルエーテルにて抽出（10ml×2）した。有機層を併せ水洗（20ml×1）後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物534mgを褐色油状物質として得た。このものはさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.60 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.98 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 1.29 (s, 6H)。

[0383] 工程2；N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2

ージフルオロ-1,1-ジメチルエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1,1-ジメチルエチルアミン534mgの酢酸エチル5ml溶液、及び炭酸カリウム828mgの水5ml溶液の混合溶液に、氷冷攪拌下、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド417mgを滴下、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、有機層を分取して水洗(10ml×1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー〔酢酸エチル-ヘキサン(5:95~15:85のグラジエント)〕にて精製し、目的物340mgを褐色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.50 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 8.00 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 7.4-7.7 (m, 4H), 6.85 (s, 1H), 1.54 (s, 6H)。

[0384] 工程3; N-[2-[3-クロロ-5-(シクロプロピルエチニル)ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1,1-ジメチルエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1,1-ジメチルエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド170mgのジメチルスルホキシド1ml溶液に、トリエチルアミン146mg、シクロプロピルアセチレン31mg、ヨウ化銅(I)20mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)25mgを添加し、窒素雰囲気下、室温にて2時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液5mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(5ml×1)した。得られた有機層を水洗(5ml×1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムにて脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー〔酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)〕にて精製し、目的物41mgを無色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.35 (d, $J=1.5\text{Hz}$, 1H), 7.76 (d, $J=1.5$

Hz, 1H), 7.4-7.7 (m, 4H), 7.13 (bs, 1H), 1.73 (s, 6H), 1.4-1.55 (m, 1H), 0.9-1.0 (m, 2H), 0.8-0.9 (m, 2H)。

[0385] 合成例 6

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]エチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (本発明化合物No.1-019)。

工程 1 ; N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

窒素雰囲気下の2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)アセトニトリル1.00gのジクロロメタン10ml溶液に、-40℃にて攪拌下、ジイソブチルアルミニウムヒドリドの1.0Mヘキサン溶液12mlを30分かけて滴下し、滴下終了後、同温度にて1時間攪拌した。次いで、反応混合物を室温まで昇温し、氷冷攪拌下の酒石酸カリウムナトリウム(ロッシェル塩)飽和水溶液50mlに滴下した。滴下終了後、室温にてさらに1時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物をジクロロメタンにて抽出(50mlx2)、有機層を併せ飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。

[0386] 残留物をジクロロメタン20mlに溶解し、二炭酸ジ-tert-ブチル1.41g及びトリエチルアミン0.66gを添加、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水20mlを加えクロロホルムにて抽出(20mlx1)し、有機層を水洗(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~5:5のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物615mgを淡黄色油状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.49 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.82 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 5.08 (bs, 1H), 3.5-3.65 (m, 2H), 3.06 (t, $J=6.0\text{Hz}$, 2H), 1.42 (s, 9H)。

[0387] 工程 2 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]

ピリジン-2-イル]エチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル]カルバミド酸-tert-ブチル 1.0gのN,N-ジメチルホルムアミド 1ml溶液にトリエチルアミン 455mg、1-エチニル-4-フルオロベンゼン 540mg、ヨウ化銅(I) 114mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II) 209mgを添加し、窒素雰囲気下、80℃にて2時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和塩化アンモニウム水溶液 10mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(5mlx2)した。有機層を併せ、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(0:10~1:9のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 1.1gを褐色結晶として得た。

融点 109.0~111.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.54 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.76 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 2H), 5.13 (bs, 1H), 3.55-3.7 (m, 2H), 3.12 (t, J=6.1Hz, 2H), 1.42 (s, 9H)。

[0388] 工程3 ; 2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]エチルアミンの製造

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]エチル]カルバミド酸-tert-ブチル 1.1gのジクロロメタン 2ml溶液にトリフルオロ酢酸 2mlを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10mlを加え、酢酸エチルにて抽出(10mlx2)した。有機層を併せ水洗(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物 710mgを暗褐色結晶として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

融点 116.0~119.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.5-8.6 (m, 1H), 7.75-7.8 (m, 1H), 7.

45-7.55 (m, 2H), 7.0-7.1 (m, 2H), 3.1-3.35 (m, 2H), 2.3-2.45 (m, 2H)

。

[0389] 工程4 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]エチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]エチルアミン200mg及びトリエチルアミン110mgのジクロロメタン2ml溶液に、氷冷攪拌下、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド182mgを滴下し、滴下終了後、室温にて1時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物に水2mlを添加し、ジクロロメタンにて抽出(5mlx1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物91mgを黄色結晶として得た。

融点133.0~135.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.49 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.79 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.45-7.7 (m, 6H), 7.0-7.1 (m, 2H), 6.65-6.8 (m, 1H), 0.95-4.05 (m, 2H), 3.24 (t, J=6.1Hz, 2H)。

[0390] 合成例7

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(本発明化合物No.1-020)。

工程1 ; 2-ブロモ-1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エタノールの製造

2-ブロモ-1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エタノン2.0gのメタノール10ml溶液に、氷冷攪拌下、水素化ホウ素ナトリウム266mgを添加し、同温度にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液20mlを添加し酢酸エチルにて抽出(25mlx2)

した。有機層を併せ水洗（20ml×1）後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物1.9gを褐色油状物質として得た。得られた目的物は更なる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.58 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.90 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 5.2-5.3 (m, 1H), 4.36 (bs, 1H), 3.6-3.9 (m, 1H), 3.15-3.3 (m, 1H)。

[0391] 工程2；N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-ヒドロキシエチル]フタルイミドの製造

2-ブロモ-1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エタノール1.90gのジメチルスルホキシド2ml溶液にフタルイミドカリウム1.17gを添加し、60℃にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、水15mlを加え酢酸エチルにて抽出（15ml×1）した。有機層を水洗（15ml×1）後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物0.93gを暗褐色結晶として得た。このものはさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

融点146.0~149.0℃

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.52 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 7.88 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 7.8-7.85 (m, 2H), 7.65-7.8 (m, 2H), 5.3-5.5 (m, 1H), 3.95-4.2 (m, 2H), 1.55-1.8 (m, 1H)。

[0392] 工程3；N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-フルオロエチル]フタルイミドの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-ヒドロキシエチル]フタルイミド930mgのジクロロメタン3ml溶液にビス(2-メトキシエチル)アミノサルファートリフルオリド808mgを滴下し、滴下終了後、60℃にて3時間攪拌した。次いで反応混合物を室温まで放冷し、ビス(2-メトキシエチル)アミノサルファートリフルオリド540mgを追加し、再び6

0℃にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液15mlを加え、酢酸エチルにて抽出(15mlx1)した。有機層を水洗(15mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチルーヘキサン(1:9~2:8のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物700mgを黄色結晶として得た。

融点153.0~154.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.6-8.65 (m, 1H), 7.9-7.95 (m, 1H), 7.85-7.9 (m, 2H), 7.7-7.8 (m, 2H), 6.17 (ddd, J=47.0, 8.5, 4.1Hz, 1H), 4.55-4.7 (m, 1H), 4.0-4.2 (m, 1H)。

[0393] 工程4 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロエチル]フタルイミドの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-フルオロエチル]フタルイミド700mgのN,N-ジメチルホルムアミド1ml溶液にトリエチルアミン276mg、1-エチニル-4-フルオロベンゼン285mg、ヨウ化銅(I)69mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)64mgを添加し、窒素雰囲気下、80℃にて2時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和塩化アンモニウム水溶液10mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(10mlx1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチルーヘキサン(0:10~1:9のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物580mgを褐色結晶として得た。

融点184.0~186.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.65-8.7 (m, 1H), 7.8-7.95 (m, 3H), 7.7-7.8 (m, 2H), 7.5-7.6 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 2H), 6.22 (ddd, J=48.7, 8.5, 4.1Hz, 1H), 4.55-4.75 (m, 1H), 4.05-4.25 (m, 1H)。

[0394] 工程5 ; 2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジ

ン-2-イル]-2-フルオロエチルアミンの製造

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロエチル]フタルイミド580mgのエタノール3ml溶液にヒドラジーン水和物110mgを添加し、室温にて2時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液5mlを加え、酢酸エチルにて抽出(10mlx1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物300mgを黄色樹脂状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.65-8.7 (m, 1H), 7.8-7.85 (m, 1H), 7.5-7.6 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 2H), 5.85 (ddd, $J=47.8, 7.4, 3.7\text{Hz}$, 1H), 3.1-3.45 (m, 2H), 1.57 (bs, 2H)。

[0395] 工程6 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-フルオロエチルアミン100mg及びトリエチルアミン51mgのジクロロメタン2ml溶液に、氷冷攪拌下、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド86mgを滴下し、滴下終了後、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水2mlを加えジクロロメタンにて抽出(5mlx1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物49mgを淡黄色結晶として得た。

融点141.0~143.0°C

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.64 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 8.47 (dd, $J=4.8, 1.7\text{Hz}$, 1H), 8.12 (dd, $J=8.2, 2.0\text{Hz}$, 1H), 7.85-7.9 (m, 1H), 7.5-7.6 (m, 2H), 7.3-7.4 (m, 2H), 7.15-7.2 (m, 1H), 7.05-7.1 (m, 2H), 6.13 (

ddd, J=46.7, 6.5, 4.1Hz, 1H), 4.1-4.45 (m, 2H)。

[0396] 合成例 8

2-クロロ-N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]プロピル]ニコチンアミド (本発明化合物No.3-050)

。

工程 1 ; 2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)プロパンニトリルの製造

2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)アセトニトリル 1.50 g のテトラヒドロフラン 20 ml 溶液に、-5℃にて攪拌下、カリウムtert-ブトキシドの 1.0 M テトラヒドロフラン溶液 7 ml を添加、室温にて 2 時間攪拌した。次いで、この反応混合物にヨードメタン 0.97 g を添加し、室温にてさらに 1 時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物に水 30 ml を加え酢酸エチルにて抽出 (25 ml x 2) し、有機層を併せ水洗 (20 ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン (5 : 95 ~ 15 : 85 のグラジエント) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 1.38 g を無色油状物質として得た。

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.58 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.88 (d, J=2.1 Hz, 1H), 4.43 (q, J=7.2Hz, 1H), 1.67 (d, J=7.2Hz, 3H)。

[0397] 工程 2 ; 2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-1-プロパンアミンの製造

窒素雰囲気下の 2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)プロパンニトリル 1.38 g のジクロロメタン 20 ml 溶液に、-40℃にて攪拌下、ジイソブチルアルミニウムヒドリドの 1.0 M ヘキサン溶液 16 ml を 20 分かけて滴下し、滴下終了後、同温度にて 1 時間攪拌した。次いで、反応混合物を室温まで昇温し、氷冷攪拌下の酒石酸カリウムナトリウム (ロッシェル塩) 飽和水溶液 50 ml に滴下した。滴下終了後、室温にてさらに 1 時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物をジクロロメタンにて抽出 (50 ml x 2)

し、有機層を併せ水洗（20ml×1）後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル10mlに溶解し、1N塩酸水溶液10mlにて抽出した。水層に10重量%水酸化ナトリウム水溶液を添加してpH14とした後、酢酸エチル30mlにて抽出した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物1.04gを赤褐色油状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.50 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 7.80 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 3.35–3.45 (m, 1H), 3.05–3.15 (m, 1H), 2.85–2.95 (m, 1H), 1.20 (d, $J=6.6\text{Hz}$, 3H)。

[0398] 工程3；N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)プロピル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-1-プロパンアミン1.04g及びトリエチルアミン0.63gのジクロロメタン10ml溶液に二炭酸ジ-tert-ブチル1.08gを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物を酢酸エチル-ヘキサン(5:95~15:85のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物1.05gを無色油状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.51 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.82 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 4.86 (bs, 1H), 3.55–3.7 (m, 1H), 3.4–3.5 (m, 2H), 1.41 (s, 9H), 1.21 (d, $J=7.2\text{Hz}$, 3H)。

[0399] 工程4；N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]プロピル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)プロピル]カルバミド酸-tert-ブチル1.0gのN,N-ジメチルホルムアミド1ml溶液にトリエチルアミン434mg、1-エチニル-4-フルオロベンゼン447mg、ヨウ化銅(I)109mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(I)100mgを添加し、窒素雰囲気下、80℃にて12時間攪拌した。反応完

結後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和塩化アンモニウム水溶液 10ml を添加し、酢酸エチルにて抽出 (10ml x 1) した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン (1 : 9 ~ 2 : 8 のグラジエント) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 480mg を褐色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.56 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.96 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.45-7.6 (m, 2H), 6.95-7.2 (m, 2H), 4.91 (bs, 1H), 3.6-3.75 (m, 1H), 3.50 (t, $J=6.3\text{Hz}$, 2H), 1.41 (s, 9H), 1.24 (d, $J=6.7\text{Hz}$, 3H)。

[0400] 工程 5 ; 2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-プロパンアミンの製造

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]プロピル]カルバミド酸-tert-ブチル 480mg のジクロロメタン 1ml 溶液にトリフルオロ酢酸 1ml を添加し、室温にて 1 時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10ml を加え酢酸エチルにて抽出 (10ml x 2) した。有機層を併せ水洗 (10ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物 380mg を褐色樹脂状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.79 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 2H), 3.55-3.7 (m, 1H), 3.2-3.35 (m, 1H), 3.05-3.2 (m, 1H), 2.59 (s, 2H), 1.31 (d, $J=7.2\text{Hz}$, 3H)。

[0401] 工程 6 ; 2-クロロ-N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]プロピル]ニコチンアミドの製造

2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-プロパンアミン 120mg 及びトリエチルアミン 63mg のジクロロメタン 2ml 溶液に、氷冷攪拌下、2-クロロニコチニルクロリド 88mg を添

加し、滴下終了後、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水2mlを加え、ジクロロメタンにて抽出(5mlx1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物74mgを褐色結晶として得た。

融点129.0~130.0℃

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.56 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 8.42 (dd, $J=4.8, 2.0\text{Hz}$, 1H), 8.09 (dd, $J=7.5, 2.0\text{Hz}$, 1H), 7.79 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.25-7.35 (m, 2H), 7.0-7.1 (m, 2H), 3.8-4.0 (m, 3H), 1.34 (d, $J=6.5\text{Hz}$, 3H)。

[0402] 合成例9

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メチルプロピル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(本発明化合物No.1-059)。

工程1; 2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メチルプロパンニトリルの製造

2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)アセトニトリル1.50gのテトラヒドロフラン20ml溶液に、-5℃にて攪拌下、カリウムtert-ブトキシドの1.0Mテトラヒドロフラン溶液13.6mlを添加、同温度にて10分間攪拌した。次いで、この反応混合物にヨードメタン1.94gを添加し、室温にてさらに1時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物に水30mlを加え酢酸エチルにて抽出(25mlx2)した。有機層を併せ水洗(20mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(0:10~1:9のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物1.61gを無色油状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.45 (d, $J=2.0\text{Hz}$, 1H), 7.84 (d, $J=2.0$

Hz, 1H), 1.76 (s, 6H)。

[0403] 工程2 ; 2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メチル-1-プロパンアミンの製造

窒素雰囲気下の2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メチルプロパンニトリル1.61gのジクロロメタン15ml溶液に、-40℃にて攪拌下、ジイソブチルアルミニウムヒドリドの1.0Mヘキサン溶液18.5mlを20分かけて滴下した。滴下終了後、同温度にて15分間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水30mlを滴下し、同温度にて30分間攪拌した後に室温まで昇温し、ジクロロメタン15ml及び酒石酸カリウムナトリウム(ロッシェル塩)6.70gを添加し、室温にてさらに3時間攪拌を継続した。有機層を分取し、水層はジクロロメタンにて抽出(50mlx2)した。有機層を併せ水洗(20mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物1.54gを褐色油状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.44 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.74 (d, J=2.1 Hz, 1H), 3.90 (bs, 2H), 3.10 (s, 2H), 1.44 (s, 6H)。

[0404] 工程3 ; N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メチルプロピル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メチル-1-プロパンアミン1.54g及びトリエチルアミン1.60mlのジクロロメタン15ml溶液に二炭酸ジ-tert-ブチル1.50gを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水10mlを加え、酢酸エチルにて抽出(20mlx2)した。有機層を併せ、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(0:10~3:7のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物911mgを黄色油状物質として得た。

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.45 (d, J=2.0Hz, 1H), 7.80 (d, J=2.0

Hz, 1H), 5.41 (bs, 1H), 3.54 (d, J=6.5Hz, 2H), 1.47 (s, 6H), 1.42 (s, 9H)。

[0405] 工程4 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メチルプロピル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メチルプロピル]カルバミド酸-tert-ブチル 1.0gのN,N-ジメチルホルムアミド 1ml 溶液にトリエチルアミン 419mg、1-エチニル-4-フルオロベンゼン 431mg、ヨウ化銅(I) 105mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II) 97mgを添加し、窒素雰囲気下、80℃にて2時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和塩化アンモニウム水溶液 10mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(10mlx1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(0:10~1:9のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 1.0gを褐色結晶として得た。

融点 70.0~73.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.51 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.75 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 2H), 5.44 (bs, 1H), 3.55 (d, J=6.8Hz, 2H), 1.48 (s, 6H), 1.42 (s, 9H)。

[0406] 工程5 ; 2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-プロパンアミンの製造

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メチルプロピル]カルバミド酸-tert-ブチル 1.0gのジクロロメタン 5ml 溶液にトリフルオロ酢酸 3mlを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10mlを加え、酢酸エチルにて抽出(10mlx2)した。有機層を併せ水洗(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で

脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物780mgを褐色結晶として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

融点60.0~62.0℃

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.51 (d, $J=2.0\text{Hz}$, 1H), 7.79 (d, $J=2.0\text{Hz}$, 1H), 7.45-7.6 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 2H), 3.26 (s, 2H), 1.57 (s, 6H)。

[0407] 工程6 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メチルプロピル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-プロパンアミン260mg及びトリエチルアミン130mgのジクロロメタン2ml溶液に、氷冷攪拌下、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド215mgを添加し、滴下終了後、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水2mlを添加しジクロロメタンにて抽出(5mlx1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物218mgを褐色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.44 (d, $J=2.0\text{Hz}$, 1H), 7.77 (d, $J=2.0\text{Hz}$, 1H), 7.65-7.75 (m, 2H), 7.45-7.6 (m, 4H), 6.95-7.15 (m, 3H), 3.89 (d, $J=6.5\text{Hz}$, 2H), 1.58 (s, 6H)。

[0408] 合成例10

N-[[1-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]シクロプロピル]メチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(本発明化合物No.1-060)。

工程1 ; N-[[1-(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)シクロプロピル]メチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

[1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)シクロプロピル]メチルアミン462mg及びトリエチルアミン269mgのジクロロメタン5ml溶液に二炭酸ジ-tert-ブチル578mgを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水10mlを加えジクロロメタンにて抽出(10mlx2)した。有機層を併せ飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物498mgを白色結晶として得た。

融点81.0~82.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.47 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.83 (d, J=2.1 Hz, 1H), 4.78 (bs, 1H), 3.38 (d, J=6.0Hz, 2H), 1.33 (s, 9H), 0.9-1.05 (m, 4H)。

[0409] 工程2 ; N-[[1-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]シクロプロピル]メチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

N-[[1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)シクロプロピル]メチル]カルバミド酸-tert-ブチル450mgのN,N-ジメチルホルムアミド3ml溶液にトリエチルアミン380mg、1-エチニル-4-フルオロベンゼン224mg、ヨウ化銅(I)71mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)87mgを添加し、窒素雰囲気下、60℃にて3時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、酢酸エチル10ml及び飽和塩化アンモニウム水溶液10mlを添加し、有機層を分取し、水層は酢酸エチルにて抽出(10mlx2)した。有機層を併せて飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(0:100~15:85のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物407mgを褐色結晶として得た。

融点103.0~104.0℃

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.52 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.77 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.45–7.55 (m, 2H), 7.0–7.1 (m, 2H), 4.83 (bs, 1H), 3.41 (d, $J=5.7\text{Hz}$, 2H), 1.34 (s, 9H), 0.95–1.05 (m, 4H)。

[0410] 工程3 ; [1-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]シクロプロピル]メチルアミンの製造

N-[[1-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]シクロプロピル]メチル]カルバミド酸-tert-ブチル 400mgのジクロロメタン6ml溶液に、氷冷攪拌下、トリフルオロ酢酸2mlを添加し、次いで室温にて1時間攪拌を継続した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液10mlを加え、酢酸エチルにて抽出(10ml \times 2)した。有機層を併せて水洗(10ml \times 1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物337mgを褐色樹脂状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55–8.6 (m, 1H), 7.75–7.8 (m, 1H), 7.45–7.55 (m, 2H), 7.0–7.1 (m, 2H), 2.75–3.25 (m, 2H), 1.47 (bs, 2H), 0.95–1.05 (m, 4H)。

[0411] 工程4 ; N-[[1-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]シクロプロピル]メチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

[1-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]シクロプロピル]メチルアミン110mg及びトリエチルアミン56mgのジクロロメタン2mlに、氷冷攪拌下、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド99mgを滴下した。滴下終了後、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水2ml添加し、ジクロロメタンにて抽出(5ml \times 1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をジイソプロピルエーテル10mlにて洗浄し、目的物107mgを褐色結晶として得た。

融点 148.0 ~ 150.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.49 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.81 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.65-7.7 (m, 2H), 7.45-7.6 (m, 3H), 7.4-7.45 (m, 1H), 7.0-7.1 (m, 2H), 6.19 (bs, 1H), 3.73 (d, J=5.1Hz, 2H), 1.05-1.15 (m, 4H)。

[0412] 合成例 11

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-メチルエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (本発明化合物No.1-061)。

工程 1 ; 5-ブロモ-3-クロロ-2-(2-ニトロ-1-プロペニル)ピリジンの製造

5-ブロモ-3-クロロピコリルアルデヒド 2.06g 及び 1-ブチルアミン 1.00g のトルエン 10ml 溶液を、ディーンスターク管を用いて共沸脱水しながら、2時間過熱還流させた。次いで、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に酢酸 10ml 及びニトロエタン 1.05g を添加し、100°C にて 40 分間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、水 30ml を加えて酢酸エチルにて抽出 (50ml x 2) した。有機層を併せ、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン (3 : 97) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 0.76g を褐色結晶として得た。

融点 44.0 ~ 50.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.65 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.96 (d, J=1.8Hz, 1H), 2.67 and 2.66 (s, 3H)。

[0413] 工程 2 ; 5-ブロモ-3-クロロ-2-(2-ニトロプロピル)ピリジンの製造

5-ブロモ-3-クロロ-2-(2-ニトロ-1-プロペニル)ピリジン 156mg のメタノール 1.5ml 溶液に、氷冷攪拌下、水素化ホウ素ナトリウム 85mg を添加し室温にて 6 時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水 5ml を添加し、酢酸エチルにて抽出 (10ml x 2) した。有機層を併せ、飽和食塩水

、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物120mgを黄色樹脂状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.38 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 7.76 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 5.1-5.25 (m, 1H), 3.62 (dd, $J=16.5, 8.6\text{Hz}$, 1H), 3.11 (dd, $J=16.5, 5.2\text{Hz}$, 1H), 1.599 (d, $J=7.0\text{Hz}$, 3H)。

[0414] 工程3 ; 2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-1-メチルエチルアミンの製造

5-ブロモ-3-クロロ-2-(2-ニトロプロピル)ピリジン120mgをメタノール-水(2:1)混合溶媒3mlに溶解し、塩化アンモニウム138mg及び還元鉄72mgを添加し、室75℃にて16時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、セライト濾過にて不溶物を除去した後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をジエチルエーテル10mlに溶解し、1N塩酸水溶液10mlにて抽出した。水層に1N水酸化ナトリウム水溶液をpH14となるまで添加した後、酢酸エチルにて抽出(30mlx2)した。有機層を併せ、飽和食塩水次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物86mgを黄色樹脂状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.50 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 7.82 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 3.4-3.55 (m, 1H), 2.98 (dd, $J=14.4, 4.9\text{Hz}$, 1H), 2.85 (dd, $J=14.2, 8.1\text{Hz}$, 1H), 1.76 (bs, 2H), 1.18 (d, $J=6.4\text{Hz}$, 3H)。

[0415] 工程4 ; N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-1-メチルエチルアミン86mg及びトリエチルアミン42mgのジクロロメタン1ml溶液に二炭酸ジ-tert-ブチル91mgを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物を酢酸エチル-ヘキサン(2:8~4:6のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し

、目的物 74 mg を黄色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.48 (d, $J=2.0\text{Hz}$, 1H), 7.81 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 4.92 (bs, 1H), 4.0–4.3 (m, 1H), 2.9–3.2 (m, 2H), 1.36 (s, 9H), 1.21 (d, $J=6.5\text{Hz}$, 3H)。

[0416] 工程 5 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチル 350 mg の N,N-ジメチルホルムアミド 1 ml 溶液にトリエチルアミン 152 mg、1-エチニル-4-フルオロベンゼン 156 mg、ヨウ化銅(I) 38 mg 及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II) 56 mg を添加し、窒素雰囲気下、80°C にて 2 時間攪拌した。反応完了後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和塩化アンモニウム水溶液 10 ml を添加し、酢酸エチルにて抽出 (10 ml x 1) した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン (0 : 10 ~ 1 : 9 のグラジエント) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 260 mg を褐色結晶として得た。

融点 117.0 ~ 119.0°C

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.54 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.76 (d, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.5–7.55 (m, 2H), 7.1–7.0 (m, 2H), 4.85–5.05 (m, 1H), 4.1–4.3 (m, 1H), 3.09 (d, $J=6.8\text{Hz}$, 2H), 1.37 (s, 9H), 1.21 (d, $J=6.5\text{Hz}$, 3H)。

[0417] 工程 6 ; 2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-メチルエチルアミンの製造

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチル 260 mg のジクロロメタン 2 ml 溶液に、氷冷攪拌下、トリフルオロ酢酸 1 ml を添加し、次

いで室温にて1時間攪拌を継続した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液10mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(10mlx2)した。有機層を併せ、水洗(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物250mgを褐色樹脂状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.45-8.5 (m, 1H), 7.8-7.85 (m, 1H), 7.5-7.6 (m, 2H), 7.0-7.1 (m, 2H), 3.55-3.95 (m, 1H), 3.26 (d, $J=8.5\text{Hz}$, 2H), 1.65-1.85 (m, 2H), 1.51 (d, $J=6.5\text{Hz}$, 3H)。

[0418] 工程7 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-メチルエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-1-メチルエチルアミン80mg及びトリエチルアミン57mgのジクロロメタン2ml溶液に、氷冷攪拌下、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド87mgを滴下した。滴下終了後、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水2ml添加し、ジクロロメタンにて抽出(5mlx1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物72mgを淡黄色結晶として得た。

融点139.0~141.0°C

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.49 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.80 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.6-7.7 (m, 1H), 7.4-7.65 (m, 6H), 7.0-7.1 (m, 2H), 6.7-6.8 (m, 1H), 3.15-3.3 (m, 2H), 1.33 (d, $J=6.7\text{Hz}$, 3H)。

[0419] 合成例12

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メトキシ-1-メチルエチル]-2-(トリフルオロメチル)

)ベンズアミド (本発明化合物No.1-066)。

[0420] 工程 1 ; 5-ブロモ-3-クロロ-2-(1-メトキシ-2-ニトロプロピル)ピリジンの製造

合成例 11 の工程 1 にて製造した 5-ブロモ-3-クロロ-2-(2-ニトロ-1-プロペニル)ピリジン 760mg のトルエン 10ml 溶液に、氷冷攪拌下、28重量%ナトリウムメトキシドメタノール溶液 2.1g をメタノール 3ml にて希釈して滴下した。同温度にて 30 分間攪拌した。反応完結後、反応混合物に酢酸 1.5ml 及び水 10ml を添加し、ジクロロメタンにて抽出 (30ml x 1) した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン (3 : 97) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 683mg を赤色油状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.67 and 8.64 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 7.95 and 7.91 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 5.35 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 1H) and 5.30 (d, $J=9.6\text{Hz}$, 1H), 5.1-5.25 (m, 1H) and 5.04 (qui, $J=6.6\text{Hz}$, 1H), 3.36 and 3.27 (s, 3H), 1.69 and 1.29 (d, $J=6.9\text{Hz}$, 3H)。

[0421] 工程 2 ; 2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メトキシ-1-メチルエチルアミンの製造

5-ブロモ-3-クロロ-2-(1-メトキシ-2-ニトロプロピル)ピリジン 340mg をメタノール-水 (1 : 1) 混合溶媒 4ml に溶解し、塩化アンモニウム 350mg 及び還元鉄 182mg を添加し、室温にて 30 分、次いで、65°C にて 1.5 時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、セライト濾過にて不溶物を除去した後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をジエチルエーテル 30ml に溶解し、1 重量%塩酸水溶液 20ml にて抽出した。水層に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 20ml を添加して塩基性とした後、酢酸エチル 100ml にて抽出した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物 200mg を褐色油状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うこと

なく、そのまま次の工程に用いた。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.66 and 8.65 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 7.88 and 7.87 (d, $J=2.1\text{Hz}$, 1H), 4.58 (d, $J=5.7\text{Hz}$, 1H) and 4.46 (d, $J=7.5\text{Hz}$, 1H), 3.30 and 3.27 (s, 3H), 3.25–3.45 (m, 1H), 1.12 and 0.93 (d, $J=6.6\text{Hz}$, 3H)。

[0422] 工程3 ; N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メトキシ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メトキシ-1-メチルエチルアミン190mg及びピリジン80mgのジクロロメタン2ml溶液に二炭酸ジ-tert-ブチル178mgを添加し、室温にて30分間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水10mlを加え、ジクロロメタンにて抽出(10ml \times 2)した。有機層を併せ、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(2:98~20:80のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物200mgを無色油状物質として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.65 and 8.59 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.87 and 7.85 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 5.31 and 4.85 (d, $J=8.1\text{Hz}$, 1H), 4.75 (d, $J=4.2\text{Hz}$, 1H) and 4.67 (d, $J=2.4\text{Hz}$, 1H), 4.0–4.3 (m, 1H), 3.53 (s, 3H), 1.42 and 1.26 (s, 9H), 1.32 and 1.05 (d, $J=6.6\text{Hz}$, 3H)。

[0423] 工程4 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メトキシ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

N-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2-メトキシ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチル272mgのN,N-ジメチルホルムアミド1ml溶液にトリエチルアミン109mg、1-エチニル-4-フルオロベンゼン109mg、ヨウ化銅(I)27mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)25mgを添加し、窒素雰囲気下、80℃にて2時間攪拌し、次いでジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)4

2 mgを追加し、さらに1時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和塩化アンモニウム水溶液 10 mlを添加し、酢酸エチルにて抽出 (10 ml x 1) した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(0 : 10 ~ 1 : 9のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 220 mgを褐色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.69 and 8.64 (d, $J=2.0\text{Hz}$, 1H), 7.80 and 7.78 (d, $J=2.0\text{Hz}$, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.0-7.1 (m, 2H), 5.35-5.5 and 4.85-4.95 (m, 1H), 4.75-4.85 and 4.15-4.3 (m, 1H), 3.36 (s, 3H), 1.43 and 1.29 (s, 9H), 1.32 and 1.06 (d, $J=6.8\text{Hz}$, 3H)。

[0424] 工程5 ; 2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メトキシ-1-メチルエチルアミンの製造

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メトキシ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチル 220 mgのジクロロメタン 2 ml溶液に、氷冷攪拌下、トリフルオロ酢酸 1 mlを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10 mlを添加し、酢酸エチルにて抽出 (10 ml x 2) した。有機層を併せ、水洗 (10 ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物 167 mgを暗褐色樹脂状物質として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.7-8.75 (m, 1H), 7.8-7.85 (m, 1H), 7.5-7.55 (m, 2H), 7.0-7.1 (m, 2H), 4.66 and 4.52 (d, $J=5.5\text{Hz}$, 1H), 3.35-3.55 (m, 1H), 3.32 and 3.29 (s, 3H), 1.84 and 1.68 (bs, 2H), 1.14 and 0.97 (d, $J=6.5\text{Hz}$, 3H)。

[0425] 工程6 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メトキシ-1-メチルエチル]-2-(トリフルオ

ロメチル)ベンズアミドの製造

2-[3-クロロ-5-[(4-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2-メトキシ-1-メチルエチルアミン80mg及びトリエチルアミン38mgのジクロロメタン2ml溶液に、氷冷攪拌下、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド63mgを滴下し、滴下終了後、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水2ml添加し、ジクロロメタンにて抽出(5mlx1)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物125mgを無色樹脂状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.64 and 8.62 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.85 and 7.83 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.45-7.75 (m, 6H), 7.3-7.4 and 7.15-7.25 (m, 1H), 7.0-7.1 (m, 2H), 4.96 and 4.83 (d, $J=4.0\text{Hz}$, 1H), 4.75-4.9 and 4.55-4.7 (m, 1H), 3.41 and 3.38 (s, 3H), 1.48 and 1.13 (d, $J=6.7\text{Hz}$, 3H)。

[0426] 合成例13

2-クロロ-N-[2-[3-クロロ-5-[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]ニコチンアミド(本発明化合物No.3-089)。

[0427] 工程1; N-[2-[3-クロロ-5-[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

合成例3の工程2にて製造したN-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチル1.23g、トリエチルアミン969mg、[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)エチニル]トリメチルシラン832mg、ヨウ化銅(I)182mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)224mgのN,N-ジメチルホルムアミド6ml溶液にフッ化テトラブチルアンモニウムの1.0Mテ

トラヒドロフラン溶液 3.8 ml を添加し、窒素雰囲気下、70 °C にて 1.5 時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、飽和塩化アンモニウム水溶液 10 ml 及び酢酸エチル 10 ml を添加し、有機層を分取し、水層は酢酸エチルにて抽出 (10 ml x 2) した。有機層を併せ、飽和塩化アンモニウム水溶液にて洗浄 (20 ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン (0 : 100 ~ 15 : 85 のグラジエント) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 851 mg を褐色結晶として得た。

融点 127.0 ~ 129.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.63 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=8.4, 7.2Hz, 1H), 7.1-7.2 (m, 2H), 4.7-4.9 (m, 2H), 1.37 (d, J=6.6Hz, 3H), 1.31 (s, 9H)。

[0428] 工程 2 ; 2-[3-クロロ-5-[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチルアミンの製造

氷冷攪拌下の N-[2-[3-クロロ-5-[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]カルバミド酸-tert-ブチル 830 mg のジクロロメタン 6 ml 溶液にトリフルオロ酢酸 2 ml を添加し、室温にて 1 時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10 ml を加え、酢酸エチルにて抽出 (10 ml x 2) した。有機層を併せ、水洗 (10 ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物 653 mg を褐色結晶として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

融点 69.0 ~ 71.0 °C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.6-8.65 (m, 1H), 7.9-7.95 (m, 1H), 7.47 (dd, J=8.4, 7.2Hz, 1H), 7.15-7.2 (m, 2H), 3.8-3.95 (m, 1H), 1.58

(bs, 2H), 1.25 (d, J=6.9Hz, 3H)。

[0429] 工程3 ; 2-クロロ-N-[2-[3-クロロ-5-[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル]ニコチンアミドの製造

2-[3-クロロ-5-[(4-クロロ-2-フルオロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチルアミン 131mg のN,N-ジメチルホルムアミド2ml溶液にトリエチルアミン 111mg、N,N-ジメチル-4-アミノピリジン 9mg、2-クロロニコチン酸 69mg及びO-(ベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボラート 176mgを添加し、室温にて16時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水2mlを添加し、酢酸エチルにて抽出(5mlx2)した。有機層を併せ、水洗(5mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~4:6のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 111mgを白色結晶として得た。

融点 141.0~147.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.61 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.45 (dd, J=4.8, 2.1Hz, 1H), 7.95-8.0 (m, 2H), 7.46 (dd, J=8.4, 7.8Hz, 1H), 7.32 (dd, J=7.5, 4.8Hz, 1H), 7.15-7.2 (m, 2H), 7.04 (d, J=9.9Hz, 1H), 5.3-5.4 (m, 1H), 1.52 (d, J=6.9Hz, 3H)。

[0430] 合成例 14

N-[2-[3-クロロ-5-[(6-フルオロピリジン-3-イル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (本発明化合物No.1-011)。

工程1 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(トリメチルシリル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

合成例1の工程3にて製造したN-[2-(5-ブロモ-3-クロロピリジ

ン-2-イル)-2,2-ジフルオロエチル]カルバミド酸-tert-ブチル1.86gのN,N-ジメチルホルムアミド15ml溶液にトリエチルアミン1.52g、トリメチルシリルアセチレン0.59g、ヨウ化銅(I)285mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)350mgを添加し、窒素雰囲気下、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液20ml及び酢酸エチル20mlを添加し、有機層を分取し、水層は酢酸エチルにて抽出(10mlx2)した。有機層を併せて、飽和塩化アンモニウム水溶液20mlにて洗浄後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(0:10~2:8のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物1.44gを黄色結晶として得た。

融点93.0~97.0°C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.50 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.85 (d, J=1.5Hz, 1H), 5.08 (bs, 1H), 4.07 (td, J=12.9, 6.6Hz, 2H), 1.41 (s, 9H), 0.27 (s, 9H)。

[0431] 工程2 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(6-フルオロピリジン-3-イル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]カルバミド酸-tert-ブチルの製造

N-[2-[3-クロロ-5-[(トリメチルシリル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]カルバミド酸-tert-ブチル480mg、トリエチルアミン375mg、2-フルオロ-5-ヨードピリジン303mg、ヨウ化銅(I)71mg及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(I)87mgのN,N-ジメチルホルムアミド6ml溶液にフッ化テトラブチルアンモニウムの1.0Mテトラヒドロフラン溶液1.3mlを添加し、窒素雰囲気下、室温にて16時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液10ml及び酢酸エチル10mlを添加し有機層を分取し、水層は酢酸エチルにて抽出(10mlx2)した。有機層を併せ、飽和塩化アンモニウム水溶液20mlにて洗浄後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱

水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(0 : 10~2 : 8のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物324mgを無色樹脂上物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55-8.65 (m, 1H), 8.4-8.5 (m, 1H), 7.9-8.0 (m, 2H), 6.95-7.05 (m, 1H), 5.05-5.2 (m, 1H), 4.0-4.2 (m, 2H), 1.41 (s, 9H)。

[0432] 工程3 ; 2-[3-クロロ-5-[(6-フルオロピリジン-3-イル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチルアミンの製造

氷冷攪拌下のN-[2-[3-クロロ-5-[(6-フルオロピリジン-3-イル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]カルバミド酸-tert-ブチル324mgのジクロロメタン3ml溶液にトリフルオロ酢酸1mlを添加し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、減圧下にて溶媒を留去し、残留物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液10mlを加えて酢酸エチルにて抽出(10mlx2)した。有機層を併せ水洗(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物253mgを黄色結晶として得た。得られた目的物はさらなる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

融点109.0~111.0°C

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.61 (d, $J=1.2\text{Hz}$, 1H), 8.43 (d, $J=2.4\text{Hz}$, 1H), 7.9-8.0 (m, 2H), 7.00 (dd, $J=8.4, 3.0\text{Hz}$, 1H), 3.52 (t, $J=14.1\text{Hz}$, 2H), 1.58 (bs, 2H)。

[0433] 工程4 ; N-[2-[3-クロロ-5-[(6-フルオロピリジン-3-イル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

氷冷攪拌下の2-[3-クロロ-5-[(6-フルオロピリジン-3-イル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチルアミン119mg及びトリチルアミン77mgのジクロロメタン2ml溶液に2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド88mgを滴下した。滴下終了後、室温にて16時間攪

拌した。反応完結後、反応混合物に水 2 ml を添加し有機層を分取し、水層はジクロロメタンにて抽出 (5 ml x 1) した。有機層を併せ水洗 (10 ml x 1) 後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留した固体をジイソプロピルエーテル 10 ml にて洗浄し、目的物 148 mg を白色結晶として得た。

融点 155.0 ~ 157.0 °C

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55-8.6 (m, 1H), 8.4-8.45 (m, 1H), 7.97 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.93 (ddd, $J=8.7, 7.5, 2.4\text{Hz}$, 1H), 7.5-7.7 (m, 4H), 6.99 (ddd, $J=8.7, 3.3, 0.9\text{Hz}$, 1H), 6.42 (t, $J=6.6\text{Hz}$, 1H), 4.47 (td, $J=13.5, 6.6\text{Hz}$, 2H)。

[0434] 合成例 15

N-[2-[3-クロロ-5-[(4-クロロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]-N-エチル-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (本発明化合物No. 15-002)。

合成例 1 と同様にして製造した N-[2-[3-クロロ-5-[(4-クロロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]-2,2-ジフルオロエチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (本発明化合物No. 1-023) 150 mg のテトラヒドロフラン 1 ml 溶液に、氷冷攪拌下、55%油性水素化ナトリウム 26 mg を添加して、窒素雰囲気下、同温度にて 30 分間攪拌した。水素ガスの発生が止んだ後、ヨードエタン 92 mg のテトラヒドロフラン 0.5 ml 溶液を添加し、室温にて 2 時間攪拌した。次いで 55%油性水素化ナトリウム 26 mg 及びヨードエタン 92 mg のテトラヒドロフラン 0.5 ml 溶液を追加、室温にてさらに 16 時間、攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液 2 ml を添加し酢酸エチルにて抽出 (5 ml x 2) した。有機層を併せて、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン (5 : 95 ~ 30 : 70 のグラジエント) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 105 mg を黄色結晶として得た。

融点 100.0~103.0°C

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.62 and 8.48 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.90 and 7.81 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.65-7.7 (m, 1H), 7.3-7.6 (m, 7H), 3.9-4.9 (m, 2H), 3.35-3.5 (m, 2H), 1.30 and 1.11 (t, $J=6.9\text{Hz}$, 3H)。

[0435] 合成例 16

N-[1-[[3-クロロ-5-[(4-クロロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]メチル]シクロプロピル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (本発明化合物No.1-160)。

工程 1 ; 1-[(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)メチル]シクロプロパンアミンの製造

2-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)アセトニトリル 2.38 g 及びチタニウム(IV)テトライソプロポキシド 3.21 g のジエチルエーテル 20 ml 溶液に、氷冷攪拌下、3 M エチルマグネシウムブロミドジエチルエーテル溶液 6.90 ml を滴下し、室温にて 1 時間攪拌した。次いで、この反応混合物に三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体 2.92 g を滴下し、同温度にてさらに 2 時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物に氷冷攪拌下 10% 水酸化ナトリウム水溶液 15 ml 及び酢酸エチル 15 ml を加え 30 分間攪拌、セライト濾過後、有機層を分取した。飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物 2.50 g を褐色樹脂状物質として得た。このものは更なる精製を行うことなく、そのまま次の工程に用いた。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.55 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.84 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 3.04 (s, 2H), 1.9-2.0 (m, 2H), 0.6-0.65 (m, 4H)。

[0436] 工程 2 ; N-[1-[(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)メチル]シクロプロピル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

1-[(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)メチル]シクロプロパンアミン 2.50 g 及びトリエチルアミン 2.08 g のジクロロメタン 10 ml 溶液に、氷冷攪拌下、2-(トリフルオロメチル)ベンゾイルクロリド 2.04 g

を滴下し、室温にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水5mlを加えクロロホルムにて抽出(5mlx2)した。有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(5:95~30:70のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物584mgを黄色結晶として得た。

融点151.0~152.0°C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.48 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.83 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.45-7.65 (m, 4H), 6.56 (s, 1H), 3.28 (s, 2H), 0.9-1.1 (m, 4 H)。

[0437] 工程3; N-[1-[[3-クロロ-5-[(4-クロロフェニル)エチニル]ピリジン-2-イル]メチル]シクロプロピル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの製造

N-[1-[(5-ブromo-3-クロロピリジン-2-イル)メチル]シクロプロピル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド270mgのN,N-ジメチルホルムアミド3ml溶液に炭酸セシウム409mg、ヨウ化銅(I)12mg、酢酸パラジウム(II)14mg、4,5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9,9-ジメチルキサンテン36mg及び4-クロロ-1-エチニルベンゼン102mgを添加し、窒素雰囲気下、70°Cにて2時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し酢酸エチル5ml及び水5mlを添加して有機層を分取、水層は酢酸エチルにて抽出(5mlx2)した。有機層を併せ飽和塩化アンモニウム水溶液にて洗浄(10mlx1)後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:9~3:7のグラジエント)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物230mgを褐色結晶として得た。

融点161.0~162.0°C

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.53 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.78 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.6-7.65 (m, 1H), 7.4-7.55 (m, 5H), 7.3-7.35 (m, 2H), 6.62 (

s, 1H), 3.35 (s, 2H), 0.95-1.1 (m, 4H)。

[0438] 本発明化合物は、前記製造法及び実施例に準じて製造することができる。合成例1～合成例16と同様に製造した本発明に包含されるアルキニルピリジン置換アミド化合物の例を第3表～第17表に、さらに、それらの製造中間体の例を第18表～第20表に示すが、本発明に包含されるアルキニルピリジン置換アミド化合物及びそれらの製造中間体はこれらのみ限定されるものではない。

尚、表中、Etはエチルを、c-Pr及びPr-cはシクロプロピルを、Bu-tはtert-ブチルを、Penはペンチルを、Phはフェニルを、1-Naphは1-ナフチルを、2-Naphは2-ナフチルをそれぞれ表し、

表中、D-1-2a～D-25-3aで表される芳香族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、

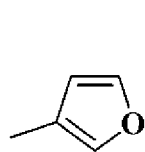
本発明化合物は、前記製造法及び実施例に準じて製造することができる。合成例1～合成例14と同様に製造した本発明に包含されるアルキニルピリジン置換アミド化合物の例を第3表～第17表に、さらに、それらの製造中間体の例を第18表～第20表に示すが、本発明に包含されるアルキニルピリジン置換アミド化合物及びそれらの製造中間体はこれらのみ限定されるものではない。

尚、表中、Etはエチルを、c-Prはシクロプロピルを、Bu-tはtert-ブチルを、Penはペンチルを、Phはフェニルを、1-Naphは1-ナフチルを、2-Naphは2-ナフチルをそれぞれ表し、

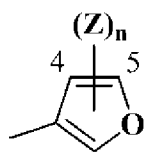
表中、D-1-2a～D-25-3aで表される芳香族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、

[0439]

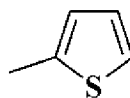
[化38]



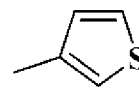
D-1-2a



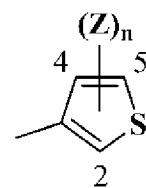
D-1-2b



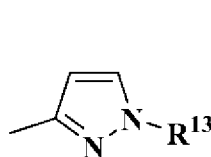
D-2-1a



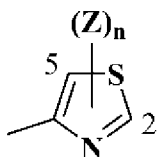
D-2-2a



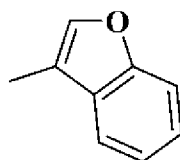
D-2-2b



D-6-1a



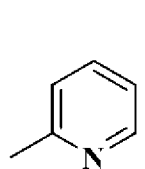
D-8-2b



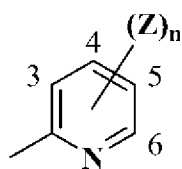
D-1-2c



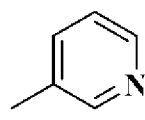
D-2-2d



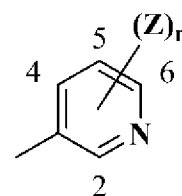
D-23-1a



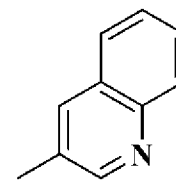
D-23-1b



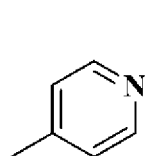
D-23-2a



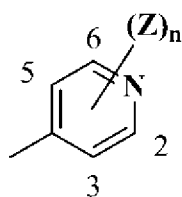
D-23-2b



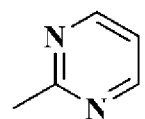
D-23-2c



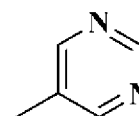
D-23-3a



D-23-3b



D-25-1a

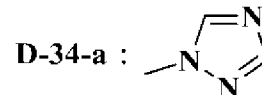
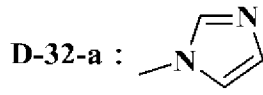
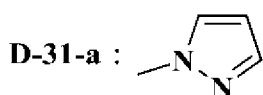


D-25-3a

置換基 $(Z)_n$ の置換位置を表す番号は、上記の構造式において記された番号の位置に対応するものであり、例えば、表中、「(D-23-2b)-6-F」との記載は「6-フルオロピリジン-3-イル」を表し、

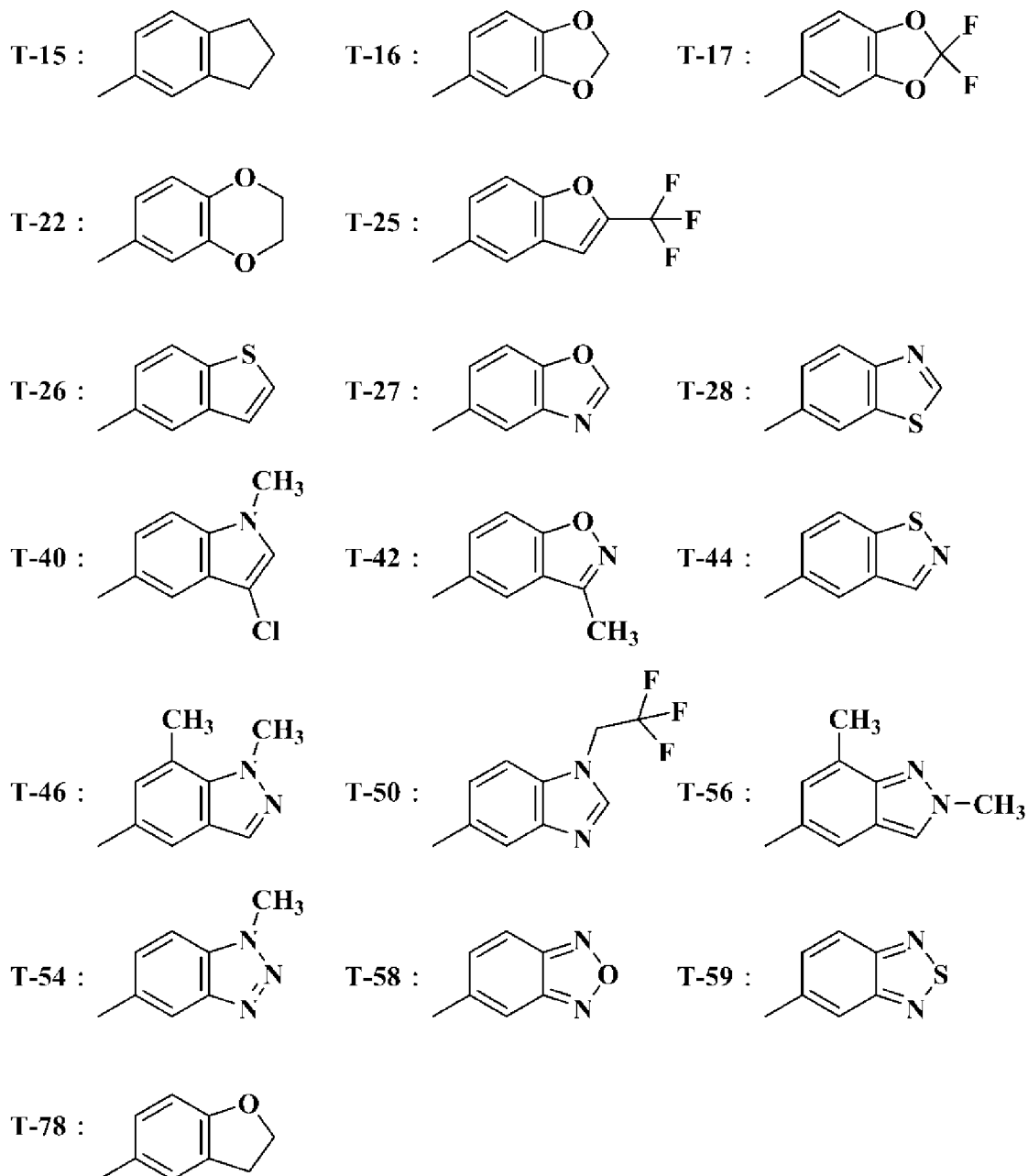
表中、D-31-a~D-34-aで表される芳香族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、

[0440] [化39]



表中、T-15～T-78は、それぞれ下記の構造を表す。

[0441] [化40]



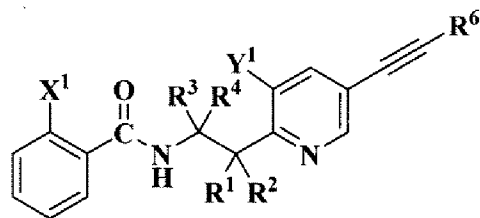
[0442] また、表中、化合物番号の欄における1-015(-)及び1-015(+)等の記載は、それぞれ比旋光度が(-)及び(+)の光学異性体であることを表し、

表中、置換基R³の欄における(R)及び(S)の表記は、R³が結合する炭素原子の光学異性体の混合比において、(R)-体又は(S)-体の比が90%以上であることを表し、

表中、融点の欄における「*1」との記載は化合物の性状が油状又は樹脂状であったことを意味する。

[0443] [表3-1]

第3表



| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|-----------|---------------------------------|---------------------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|-----------------------|-------------|
| 1-001 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 177.0-178.0 |
| 1-002 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F | 145.0-147.0 |
| 1-003 | I | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 163.0-166.0 |
| 1-004 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 164.0-166.0 |
| 1-005 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ | 92.0-94.0 |
| 1-006 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ | 119.0-121.0 |
| 1-007 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 148.0-150.0 |
| 1-008 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CN | 178.0-180.0 |
| 1-009 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-2-2a | 176.0-178.0 |
| 1-010 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-23-2a | 190.0-191.0 |
| 1-011 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | 155.0-157.0 |
| 1-012 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-23-3a | *1 |
| 1-013 | CF ₃ | H | H | CH ₃ | F | Cl | Ph-4-F | 146.0-149.0 |
| 1-014 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | c-Pr | 126.0-129.0 |
| 1-015 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 178.0-180.0 |
| 1-015 (-) | CF ₃ | CH ₃ (R) | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 176.5-176.8 |
| 1-015 (+) | CF ₃ | CH ₃ (S) | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 176.8-177.1 |
| 1-016 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 162.0-163.0 |
| 1-017 | CF ₃ | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | c-Pr | *1 |
| 1-018 | CF ₃ | CH ₃ | CH ₃ | F | F | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 1-019 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-4-F | 133.0-135.0 |
| 1-020 | CF ₃ | H | H | F | H | Cl | Ph-4-F | 141.0-143.0 |
| 1-021 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-Cl | 173.0-174.0 |
| 1-022 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl | 142.0-145.0 |
| 1-023 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 148.0-151.0 |
| 1-024 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Br | 174.5-176.5 |
| 1-025 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ | 124.5-128.5 |
| 1-026 | CH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ | 118.0-120.0 |
| 1-027 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ | 141.0-143.0 |
| 1-028 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CH ₃ | 136.0-139.0 |
| 1-029 | NO ₂ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CH ₃ | 183.0-184.0 |
| 1-030 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CH ₃ | 184.0-186.0 |
| 1-031 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Bu-t | *1 |
| 1-032 | SO ₂ CH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Bu-t | 188.0-189.0 |
| 1-033 | Br | H | H | F | F | Cl | Ph-2-OCH ₃ | 132.0-134.0 |
| 1-034 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-OCH ₃ | 125.0-128.0 |
| 1-035 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ | *1 |

[0444] [表3-2]

| | | | | | | | | |
|-------|-----------------|-----------------|---|------------------------------------|-----------------|----|--------------------------------------|-------------|
| 1-036 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₃ | 154.0-157.0 |
| 1-037 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCHF ₂ | 133.0-137.0 |
| 1-038 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCF ₃ | 111.0-114.0 |
| 1-039 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCH ₃ | 152.0-155.0 |
| 1-040 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CH ₃ | 204.0-205.0 |
| 1-041 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CH ₃ | 209.0-211.0 |
| 1-042 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCF ₃ | 134.0-136.0 |
| 1-043 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-NO ₂ | 171.0-172.0 |
| 1-044 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4-F ₂ | 139.0-141.5 |
| 1-045 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4-F ₂ | 136.5-139.5 |
| 1-046 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3,5-F ₂ | 133.5-136.0 |
| 1-047 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl-4-F | 141.5-142.5 |
| 1-048 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 151.5-152.5 |
| 1-049 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 132.0-134.0 |
| 1-050 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4-Cl ₂ | 127.5-130.5 |
| 1-051 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 125.0-127.0 |
| 1-052 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4,5-F ₃ | 122.0-124.0 |
| 1-053 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-1-2a | 169.0-172.0 |
| 1-054 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-2-1a | 149.0-151.0 |
| 1-055 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-8-2b)-2-CH ₃ | 142.0-144.0 |
| 1-056 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-Cl | 137.0-139.0 |
| 1-057 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-2-F | 132.0-134.0 |
| 1-058 | CF ₃ | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-4-F | 168.0-170.0 |
| 1-059 | CF ₃ | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 1-060 | CF ₃ | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-F | 148.0-150.0 |
| 1-061 | CF ₃ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-F | 139.0-141.0 |
| 1-062 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | C(CH ₃) ₂ F | *1 |
| 1-063 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 161.0-165.0 |
| 1-064 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₃ | *1 |
| 1-065 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CN | 171.0-173.0 |
| 1-066 | CF ₃ | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 1-067 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F | 137.0-139.0 |
| 1-068 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-4-Cl | 147.0-149.0 |
| 1-069 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | 156.0-159.0 |
| 1-070 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 147.0-149.0 |
| 1-071 | CF ₃ | H | H | F | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 147.0-150.0 |
| 1-072 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 178.0-180.0 |
| 1-073 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-Cl | 147.0-149.0 |
| 1-074 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-1-2b)-2-CH ₃ | *1 |
| 1-075 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-5-CH ₃ | 164.0-165.0 |
| 1-076 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-6-1a)-1-CH ₃ | 166.0-167.0 |
| 1-077 | Cl | H | H | F | F | Cl | D-23-1a | 151.0-153.0 |
| 1-078 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-23-1a | 157.0-160.0 |
| 1-079 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-CF ₃ | 133.0-137.0 |
| 1-080 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-CF ₃ | 153.0-157.0 |
| 1-081 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-3-F | 130.0-132.0 |
| 1-082 | Cl | H | H | F | F | Cl | D-25-1a | 154.0-155.0 |
| 1-083 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-25-1a | 174.0-176.0 |

[0445]

[表3-3]

| | | | | | | | | |
|-------|-----------------|-----------------|---|------------------------------------|---|-----------------|---------------------------------------|-------------|
| 1-084 | Cl | H | H | F | F | Cl | D-25-3a | 154.0-159.0 |
| 1-085 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-25-3a | 165.0-170.0 |
| 1-086 | CF ₃ | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-2-F | 89.0-91.0 |
| 1-087 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 149.0-151.0 |
| 1-088 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 160.0-161.0 |
| 1-089 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | 155.0-157.0 |
| 1-090 | I | H | H | H | H | Cl | Ph-3-F | 160.0-162.0 |
| 1-091 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-3-F | 150.0-152.0 |
| 1-092 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CF ₃ | 160.0-162.0 |
| 1-093 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CF ₃ | 102.0-105.0 |
| 1-094 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-Cl ₂ | 153.0-154.0 |
| 1-095 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 149.0-150.0 |
| 1-096 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 149.0-150.0 |
| 1-097 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ -4-F | 151.0-153.0 |
| 1-098 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-3-CF ₃ | 147.0-150.0 |
| 1-099 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 143.0-144.0 |
| 1-100 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 142.5-143.5 |
| 1-101 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-F | 164.0-166.0 |
| 1-102 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCH ₃ | 169.0-171.0 |
| 1-103 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 165.0-166.0 |
| 1-104 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCF ₃ | 127.0-129.0 |
| 1-105 | I | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 150.0-153.0 |
| 1-106 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-17 | 141.0-145.0 |
| 1-107 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | 121.0-122.0 |
| 1-108 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 154.0-156.0 |
| 1-109 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 121.0-123.0 |
| 1-110 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | 191.0-195.0 |
| 1-111 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | 2-Naph | 194.0-196.0 |
| 1-112 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-Cl | 146.0-148.0 |
| 1-113 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-1b)-3, 5-Cl ₂ | 156.0-157.0 |
| 1-114 | CF ₃ | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-Cl | 145.0-147.0 |
| 1-115 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 150.0-152.0 |
| 1-116 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 145.0-147.0 |
| 1-117 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-F ₂ | *1 |
| 1-118 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 162.0-164.0 |
| 1-119 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 141.0-144.0 |
| 1-120 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 146.0-148.0 |
| 1-121 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 141.0-143.0 |
| 1-122 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 168.0-170.0 |
| 1-123 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 145.0-148.0 |
| 1-124 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 140.0-142.0 |
| 1-125 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-Cl | 165.0-166.0 |
| 1-126 | CF ₃ | H | H | F | F | CF ₃ | Ph-4-Cl | 159.0-161.0 |
| 1-127 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OPen | 134.0-136.0 |
| 1-128 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₂ CF ₃ | 143.0-145.0 |
| 1-129 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-31-a) | 200.0-202.0 |
| 1-130 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-34-a) | 195.0-197.0 |
| 1-131 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ | 192.0-194.0 |

[0446]

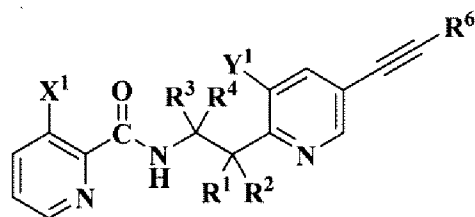
[表3-4]

| | | | | | | | | |
|-------|-----------------|------------------------------------|---|---|---|----|---|-------------|
| 1-132 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-(CF ₃) ₂ | 145.0-147.0 |
| 1-133 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | 143.0-144.0 |
| 1-134 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | 104.0-106.0 |
| 1-135 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-15 | 155.0-158.0 |
| 1-136 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 152.0-154.0 |
| 1-137 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | 1-Naph | 120.0-123.0 |
| 1-138 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-27 | 193.0-196.0 |
| 1-139 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-28 | 173.0-175.0 |
| 1-140 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-1b)-5-CF ₃ | *1 |
| 1-141 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-Cl ₂ | 173.0-174.0 |
| 1-142 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 137.0-141.0 |
| 1-143 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 138.0-141.0 |
| 1-144 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 163.0-165.0 |
| 1-145 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | T-17 | 165.0-166.0 |
| 1-146 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | T-17 | 138.0-140.0 |
| 1-147 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | 129.0-132.0 |
| 1-148 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | 141.0-143.0 |
| 1-149 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 159.0-161.0 |
| 1-150 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-32-a) | 186.0-188.0 |
| 1-151 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-16 | 181.0-182.0 |
| 1-152 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-22 | 162.0-168.0 |
| 1-153 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-25 | 176.0-179.0 |
| 1-154 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-26 | 198.0-200.0 |
| 1-155 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-40 | 156.0-159.0 |
| 1-156 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-44 | 190.0-191.0 |
| 1-157 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-46 | 198.0-199.0 |
| 1-158 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-50 | 171.0-173.0 |
| 1-159 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-56 | 198.0-199.0 |
| 1-160 | CF ₃ | -CH ₂ CH ₂ - | H | H | H | Cl | Ph-4-Cl | 161.0-162.0 |
| 1-161 | CF ₃ | Et | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 143.0-149.0 |
| 1-162 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-78 | 187.0-189.0 |
| 1-163 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-42 | 191.0-194.0 |
| 1-164 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-54 | 211.0-213.0 |
| 1-165 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-58 | 154.0-155.0 |
| 1-166 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-59 | 164.0-166.0 |
| 1-167 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-1-2c | 179.0-181.0 |
| 1-168 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-2-2d | 138.0-140.0 |

[0447]

[表4-1]

第4表



| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|-------|-----------------|-----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|--------------------------------------|-------------|
| 2-001 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 2-002 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | *1 |
| 2-003 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 142.0-146.0 |
| 2-004 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Br | 150.5-152.0 |
| 2-005 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCHF ₂ | 135.5-137.5 |
| 2-006 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CH ₃ | 178.5-179.5 |
| 2-007 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCF ₃ | 115.0-119.0 |
| 2-008 | Cl | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F | 107.0-111.0 |
| 2-009 | Cl | H | H | H | H | Cl | Ph-4-Cl | 140.0-141.0 |
| 2-010 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | 140.0-146.0 |
| 2-011 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 133.0-135.0 |
| 2-012 | CF ₃ | H | H | F | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 153.0-155.0 |
| 2-013 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-Cl | 121.0-124.0 |
| 2-014 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-5-CH ₃ | 151.0-155.0 |
| 2-015 | Cl | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-2-F | *1 |
| 2-016 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 109.0-112.0 |
| 2-017 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 124.0-127.0 |
| 2-018 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 130.0-132.0 |
| 2-019 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 126.0-128.0 |
| 2-020 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 142.0-144.0 |
| 2-021 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 155.0-156.0 |
| 2-022 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 142.0-143.0 |
| 2-023 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 153.0-155.0 |
| 2-024 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 172.5-173.5 |
| 2-025 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CF ₃ | 129.0-131.0 |
| 2-026 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CF ₃ | 159.0-161.0 |
| 2-027 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 132.0-133.0 |
| 2-028 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 146.0-148.0 |
| 2-029 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-Cl ₂ | 157.0-159.0 |
| 2-030 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 166.0-167.0 |
| 2-031 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 145.0-148.0 |
| 2-032 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 111.0-115.0 |
| 2-033 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 154.0-156.0 |
| 2-034 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 151.5-153.0 |
| 2-035 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ -4-F | 145.0-148.0 |
| 2-036 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-3-CF ₃ | 164.0-165.0 |
| 2-037 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 139.0-140.0 |

[0448]

[表4-2]

| | | | | | | | | |
|-------|-----------------|-----------------|---|------------------------------------|---|----|---|-------------|
| 2-038 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 150.0-152.0 |
| 2-039 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-F | 160.0-162.0 |
| 2-040 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCH ₃ | 139.0-141.0 |
| 2-041 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 181.0-183.0 |
| 2-042 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCF ₃ | 137.0-139.0 |
| 2-043 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 126.0-129.0 |
| 2-044 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-17 | 125.0-129.0 |
| 2-045 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | 127.0-129.0 |
| 2-046 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 173.0-177.0 |
| 2-047 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 121.0-123.0 |
| 2-048 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | 167.0-169.0 |
| 2-049 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | 2-Naph | 175.0-176.0 |
| 2-050 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-Cl | 157.0-160.0 |
| 2-051 | F | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-Cl | 137.0-140.0 |
| 2-052 | Cl | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-Cl | 194.0-195.0 |
| 2-053 | CH ₃ | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-Cl | 151.0-152.0 |
| 2-054 | CF ₃ | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-Cl | 149.0-151.0 |
| 2-055 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 107.0-111.0 |
| 2-056 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 135.0-138.0 |
| 2-057 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 141.0-143.0 |
| 2-058 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | *1 |
| 2-059 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 119.0-121.0 |
| 2-060 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 115.0-117.0 |
| 2-061 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 138.0-139.0 |
| 2-062 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-F ₂ | 91.0-101.0 |
| 2-063 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-F ₂ | 125.0-127.0 |
| 2-064 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 142.0-145.0 |
| 2-065 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 141.0-144.0 |
| 2-066 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 124.0-126.0 |
| 2-067 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 109.0-111.0 |
| 2-068 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 162.0-164.0 |
| 2-069 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 152.0-157.0 |
| 2-070 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 120.0-121.0 |
| 2-071 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 138.0-140.0 |
| 2-072 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-31-a) | 196.0-198.0 |
| 2-073 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ | 179.0-180.0 |
| 2-074 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-(CF ₃) ₂ | 137.0-139.0 |
| 2-075 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | 123.0-125.0 |
| 2-076 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | 125.0-126.0 |
| 2-077 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 151.0-152.0 |
| 2-078 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | 1-Naph | 140.0-142.0 |
| 2-079 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-27 | 165.0-168.0 |
| 2-080 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-28 | 182.0-184.0 |
| 2-081 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-Cl ₂ | 120.0-122.0 |
| 2-082 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 124.0-127.0 |
| 2-083 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 125.0-129.0 |
| 2-084 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | *1 |
| 2-085 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | T-17 | 137.0-138.0 |

[0449]

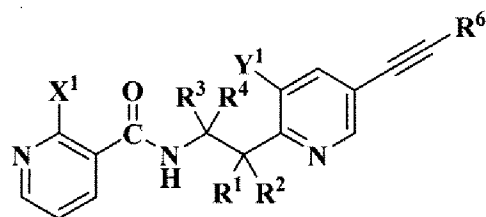
[表4-3]

| | | | | | | | | |
|-------|-----------------|-----------------|---|---|---|----|------------------------------|-------------|
| 2-086 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | 143.0-145.0 |
| 2-087 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | 151.0-153.0 |
| 2-088 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 146.0-148.0 |
| 2-089 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-32-a) | 159.0-161.0 |
| 2-090 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-22 | 167.0-170.0 |
| 2-091 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-25 | 149.0-152.0 |
| 2-092 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-26 | 168.0-171.0 |
| 2-093 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-46 | 198.0-201.0 |
| 2-094 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-50 | 166.0-168.0 |
| 2-095 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-56 | 160.0-161.0 |
| 2-096 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-42 | 183.0-184.0 |
| 2-097 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-23-2c | 187.0-190.0 |

[0450]

[表5-1]

第5表



| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|-------|----------------------------------|-----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|--------------------------------------|-------------|
| 3-001 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 177.0-179.0 |
| 3-002 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F | *1 |
| 3-003 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 143.0-146.0 |
| 3-004 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl | 175.0-177.5 |
| 3-005 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ | 161.0-163.0 |
| 3-006 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ | 111.0-113.0 |
| 3-007 | CHF ₂ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ | 142.0-143.0 |
| 3-008 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CN | 179.0-181.0 |
| 3-009 | Cl | H | H | F | F | Cl | D-2-2a | 142.0-143.0 |
| 3-010 | Cl | H | H | CH ₃ | F | Cl | Ph-4-F | 149.0-151.0 |
| 3-011 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 155.0-159.0 |
| 3-012 | Cl | H | H | H | H | Cl | Ph-4-F | 107.0-109.0 |
| 3-013 | Cl | H | H | F | H | Cl | Ph-4-F | 135.0-138.0 |
| 3-014 | CHF ₂ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 139.0-141.0 |
| 3-015 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 170.0-172.0 |
| 3-016 | SCH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 144.0-146.0 |
| 3-017 | SO ₂ CH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 171.0-174.0 |
| 3-018 | SO ₂ CHF ₂ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 3-019 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-Cl | 162.5-164.0 |
| 3-020 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl | 129.0-131.0 |
| 3-021 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 155.0-158.0 |
| 3-022 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Br | 162.5-164.5 |
| 3-023 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ | 102.0-105.0 |
| 3-024 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CH ₃ | 116.0-119.0 |
| 3-025 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CH ₃ | 114.0-116.0 |
| 3-026 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Bu-t | *1 |
| 3-027 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-OCH ₃ | 113.0-118.0 |
| 3-028 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ | 131.0-134.0 |
| 3-029 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₃ | 144.0-147.0 |
| 3-030 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCHF ₂ | 133.0-137.0 |
| 3-031 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCF ₃ | 126.0-129.0 |
| 3-032 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCH ₃ | 161.0-166.0 |
| 3-033 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CH ₃ | 152.0-154.0 |
| 3-034 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CH ₃ | 173.0-180.0 |
| 3-035 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCF ₃ | 147.0-149.0 |
| 3-036 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4-F ₂ | 148.0-150.0 |
| 3-037 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4-F ₂ | 129.5-131.5 |

[0451]

[表5-2]

| | | | | | | | | |
|-------|----------------------------------|-----------------|---|------------------------------------|-----------------|----|-----------------------------|-------------|
| 3-038 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ | 152.5-153.5 |
| 3-039 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl-4-F | 143.0-144.0 |
| 3-040 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 139.0-143.0 |
| 3-041 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 134.0-138.0 |
| 3-042 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 163.0-166.0 |
| 3-043 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 125.0-127.0 |
| 3-044 | Cl | H | H | F | F | Cl | D-1-2a | 139.5-141.5 |
| 3-045 | Cl | H | H | F | F | Cl | D-2-1a | 139.0-141.0 |
| 3-046 | SO ₂ CH ₃ | H | H | F | F | Cl | D-2-1a | 179.0-181.0 |
| 3-047 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-8-2b)-2-CH ₃ | 149.0-150.5 |
| 3-048 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-Cl | 157.0-159.0 |
| 3-049 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-2-F | 133.0-135.0 |
| 3-050 | Cl | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-4-F | 129.0-130.0 |
| 3-051 | Cl | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 3-052 | Cl | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-F | 107.0-109.0 |
| 3-053 | Cl | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-F | 111.0-112.0 |
| 3-054 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 149.0-152.0 |
| 3-055 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 184.0-185.0 |
| 3-056 | SO ₂ CH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 173.0-177.0 |
| 3-057 | SO ₂ CHF ₂ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 186.0-189.0 |
| 3-058 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 156.0-160.0 |
| 3-059 | CHF ₂ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | *1 |
| 3-060 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₃ | 171.0-173.0 |
| 3-061 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CN | 196.0-197.0 |
| 3-062 | Cl | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 3-063 | Cl | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F | 129.0-131.0 |
| 3-064 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F | 136.0-137.0 |
| 3-065 | Cl | H | H | H | H | Cl | Ph-4-Cl | 140.0-141.0 |
| 3-066 | Cl | H | H | H | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | 140.0-142.0 |
| 3-067 | Cl | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 136.0-139.0 |
| 3-068 | CF ₃ | H | H | F | H | Cl | Ph-4-Cl | 148.0-149.0 |
| 3-069 | Cl | H | H | F | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 206.0-207.0 |
| 3-070 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 153.0-156.0 |
| 3-071 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 170.0-172.0 |
| 3-072 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 194.0-196.0 |
| 3-073 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-Cl | 151.0-154.0 |
| 3-074 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-Cl | 177.0-179.0 |
| 3-075 | SO ₂ CH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-Cl | 72.0-77.0 |
| 3-076 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-1-2b)-2-CH ₃ | *1 |
| 3-077 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-1-2b)-2-CH ₃ | 144.0-146.0 |
| 3-078 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-5-CH ₃ | 139.0-140.0 |
| 3-079 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-CF ₃ | 178.0-181.0 |
| 3-080 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-3-F | 119.0-121.0 |
| 3-081 | Cl | H | H | F | F | Cl | D-25-1a | 210.0-211.0 |
| 3-082 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-25-1a | 206.0-207.0 |
| 3-083 | Cl | H | H | F | F | Cl | D-25-3a | 171.0-173.0 |
| 3-084 | Cl | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-2-F | 109.0-112.0 |
| 3-085 | CF ₃ | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-2-F | 127.0-129.0 |

[0452]

[表5-3]

| | | | | | | | | |
|-------|---------------------------------|-----------------|---|---|---|----|--------------------------------------|-------------|
| 3-086 | SO ₂ CH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 188.0-190.0 |
| 3-087 | CH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 159.0-161.0 |
| 3-088 | OCH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 105.0-107.0 |
| 3-089 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 141.0-147.0 |
| 3-090 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 178.0-179.0 |
| 3-091 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 153.0-155.0 |
| 3-092 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 162.0-166.0 |
| 3-093 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | 170.0-172.0 |
| 3-094 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | 122.0-124.0 |
| 3-095 | Cl | H | H | H | H | Cl | Ph-3-F | 121.0-123.0 |
| 3-096 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 169.0-171.0 |
| 3-097 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Br | 210.0-212.0 |
| 3-098 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 162.5-164.0 |
| 3-099 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 172.0-174.0 |
| 3-100 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCHF ₂ | 152.0-154.0 |
| 3-101 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CF ₃ | 141.0-144.0 |
| 3-102 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CF ₃ | 150.0-152.0 |
| 3-103 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CF ₃ | 93.0-96.0 |
| 3-104 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4-F ₂ | 153.0-155.0 |
| 3-105 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 200.0-202.0 |
| 3-106 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 181.0-183.0 |
| 3-107 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4-Cl ₂ | 182.0-183.0 |
| 3-108 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 128.0-129.0 |
| 3-109 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 129.0-130.0 |
| 3-110 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 143.0-146.0 |
| 3-111 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 152.5-154.5 |
| 3-112 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ -4-F | 158.0-161.0 |
| 3-113 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ -4-F | 183.0-185.0 |
| 3-114 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-3-CF ₃ | 163.0-164.0 |
| 3-115 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-3-CF ₃ | 158.0-160.0 |
| 3-116 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 173.0-174.0 |
| 3-117 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 154.0-155.0 |
| 3-118 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 156.0-157.0 |
| 3-119 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 191.0-193.0 |
| 3-120 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-F | 181.0-183.0 |
| 3-121 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-F | 167.0-169.0 |
| 3-122 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCH ₃ | 175.0-177.0 |
| 3-123 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCH ₃ | 174.0-176.0 |
| 3-124 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 171.0-172.0 |
| 3-125 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 177.0-180.0 |
| 3-126 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCF ₃ | 147.0-149.0 |
| 3-127 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCF ₃ | 166.0-167.0 |
| 3-128 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 155.0-157.0 |
| 3-129 | Cl | H | H | F | F | Cl | T-17 | 162.0-166.0 |
| 3-130 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-17 | 159.0-161.0 |
| 3-131 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4,5-F ₃ | 172.0-174.0 |
| 3-132 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4,6-F ₃ | 168.0-171.0 |
| 3-133 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4,6-F ₃ | 162.0-167.0 |

[0453]

[表5-4]

| | | | | | | | | |
|-------|---------------------------------|-----------------|---|---|---|-----------------|---|-------------|
| 3-134 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 145.0-147.0 |
| 3-135 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 153.0-157.0 |
| 3-136 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | 190.0-194.0 |
| 3-137 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | 2-Naph | 194.0-196.0 |
| 3-138 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-Cl | 117.0-120.0 |
| 3-139 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 142.0-146.0 |
| 3-140 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 154.0-157.0 |
| 3-141 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 161.0-163.0 |
| 3-142 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 150.0-154.0 |
| 3-143 | SO ₂ CH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 169.0-173.0 |
| 3-144 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 160.0-162.0 |
| 3-145 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 174.0-178.0 |
| 3-146 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-F ₂ | 128.0-130.0 |
| 3-147 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-F ₂ | 139.0-141.0 |
| 3-148 | CH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 161.0-163.0 |
| 3-149 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 167.0-169.0 |
| 3-150 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 120.0-122.0 |
| 3-151 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 170.0-172.0 |
| 3-152 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 181.0-182.0 |
| 3-153 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 158.0-161.0 |
| 3-154 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 182.0-185.0 |
| 3-155 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 186.0-188.0 |
| 3-156 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 142.0-146.0 |
| 3-157 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 174.0-176.0 |
| 3-158 | Cl | H | H | F | F | CF ₃ | Ph-4-Cl | 144.0-146.0 |
| 3-159 | CF ₃ | H | H | F | F | CF ₃ | Ph-4-Cl | 187.0-190.0 |
| 3-160 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-31-a) | 225.0-227.0 |
| 3-161 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-34-a) | 213.0-216.0 |
| 3-162 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ | 205.0-208.0 |
| 3-163 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-(CF ₃) ₂ | 187.0-189.0 |
| 3-164 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | 168.0-170.0 |
| 3-165 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | 160.0-162.0 |
| 3-166 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-15 | 185.0-188.0 |
| 3-167 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 186.0-188.0 |
| 3-168 | Cl | H | H | F | F | Cl | 1-Naph | 132.0-135.0 |
| 3-169 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | 1-Naph | 124.0-128.0 |
| 3-170 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-27 | 196.0-199.0 |
| 3-171 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-28 | 191.0-192.0 |
| 3-172 | CF ₃ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 103.0-105.0 |
| 3-173 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-Cl ₂ | 187.0-188.0 |
| 3-174 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 170.0-171.0 |
| 3-175 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | *1 |
| 3-176 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 161.0-164.0 |
| 3-177 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 161.0-163.0 |
| 3-178 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | T-17 | 162.0-164.0 |
| 3-179 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | 162.0-164.0 |
| 3-180 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | 181.0-183.0 |
| 3-181 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 124.0-127.0 |

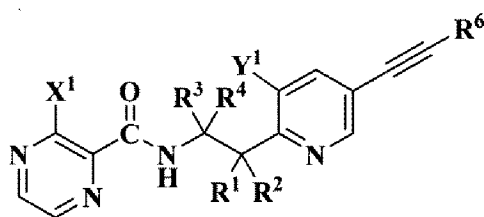
[0454]

[表5-5]

| | | | | | | | | |
|-------|-----------------|----|---|---|---|----|---------------|-------------|
| 3-182 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-32-a) | 211.0-213.0 |
| 3-183 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-16 | 195.0-197.0 |
| 3-184 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-22 | 207.0-210.0 |
| 3-185 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-25 | 199.0-201.0 |
| 3-186 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-26 | 203.0-207.0 |
| 3-187 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-44 | 173.0-176.0 |
| 3-188 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-46 | 201.0-202.0 |
| 3-189 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-50 | 206.0-209.0 |
| 3-190 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-56 | 192.0-194.0 |
| 3-191 | CF ₃ | Et | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 172.0-176.0 |
| 3-192 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-42 | 202.0-204.0 |
| 3-193 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-23-2c | 239.0-241.0 |

[0455] [表6]

第6表

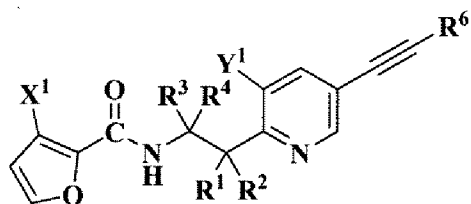


| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|-------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------------------|-------------|
| 4-001 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 172.0-174.0 |
| 4-002 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 114.0-117.0 |
| 4-003 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 113.0-116.0 |
| 4-004 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 102.0-107.0 |
| 4-005 | Cl | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-5-CH ₃ | 129.0-131.0 |
| 4-006 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 149.0-152.0 |
| 4-007 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 147.0-149.0 |
| 4-008 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 133.0-136.0 |
| 4-009 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 124.0-127.0 |
| 4-010 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 176.0-179.0 |
| 4-011 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 154.0-156.0 |
| 4-012 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 149.0-151.0 |
| 4-013 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 148.0-152.0 |
| 4-014 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 147.0-149.0 |
| 4-015 | Cl | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 133.0-141.0 |
| 4-016 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 142.0-145.0 |
| 4-017 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 153.0-157.0 |
| 4-018 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 169.0-171.0 |
| 4-019 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-23-2c | 219.0-221.0 |

[0456]

[表7]

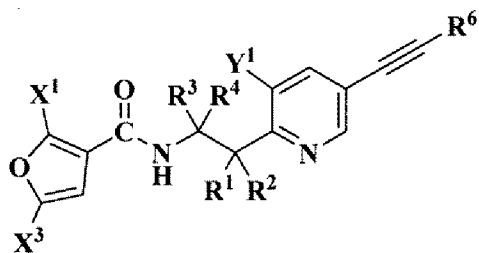
第7表



| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|-------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-----------------------|------------|
| 5-001 | Br | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCF ₃ | *1 |

[0457] [表8]

第8表

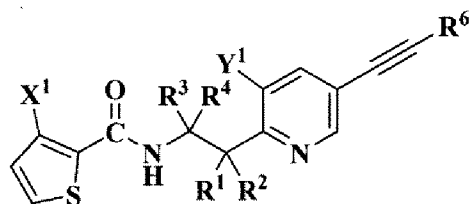


| No. | X ¹ | X ³ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|-------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-----------------------|-------------|
| 6-001 | CH ₃ | H | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 104.0-105.0 |
| 6-002 | CF ₃ | CH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 111.0-112.0 |
| 6-003 | CF ₃ | CH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCF ₃ | 116.0-118.0 |

[0458]

[表9]

第9表

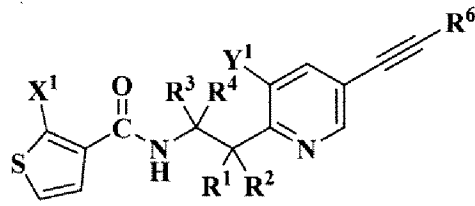


| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|-------|-----------------|-----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|------------------------------------|-------------|
| 7-001 | CH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 114.0-115.0 |
| 7-002 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 109.0-111.0 |
| 7-003 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ | 103.0-105.0 |
| 7-004 | CH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-F ₂ | 127.5-129.5 |
| 7-005 | CF ₃ | H | H | CH ₃ | F | Cl | Ph-4-F | 101.0-103.0 |
| 7-006 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | c-Pr | 98.0-101.0 |
| 7-007 | CF ₃ | H | H | H | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 7-008 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 153.0-156.0 |
| 7-009 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 141.5-143.5 |
| 7-010 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 92.0-95.0 |
| 7-011 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-2-F | 126.0-128.0 |
| 7-012 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | C(CH ₃) ₂ F | *1 |
| 7-013 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 127.0-131.0 |
| 7-014 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-CF ₃ | 145.0-149.0 |
| 7-015 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-3-F | 93.0-95.0 |
| 7-016 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | D-25-3a | 137.0-139.0 |
| 7-017 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | 132.0-137.0 |
| 7-018 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 113.0-114.5 |
| 7-019 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 105.0-107.0 |
| 7-020 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 121.0-123.0 |
| 7-021 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 107.0-109.0 |
| 7-022 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-Cl | 141.0-143.0 |
| 7-023 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 104.0-106.0 |

[0459]

[表10]

第10表

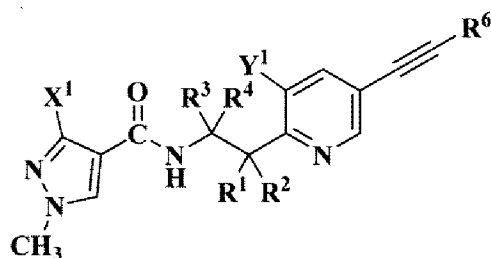


| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|-------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------------|
| 8-001 | I | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 126.0-128.0 |
| 8-002 | I | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl | 120.5-122.0 |
| 8-003 | I | CH ₃ | H | F | F | Cl | c-Pr | 168.0-170.0 |
| 8-004 | I | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 121.0-123.0 |
| 8-005 | I | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | *1 |
| 8-006 | I | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 155.0-156.0 |

[0460]

[表11]

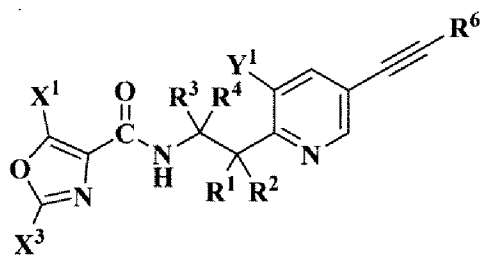
第 1 1 表



| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|-------|------------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|-----------------|----------------------------|-------------|
| 9-001 | CHF ₂ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 137.0-139.0 |
| 9-002 | CHF ₂ | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ | 119.0-122.0 |
| 9-003 | CHF ₂ | CH ₃ | H | F | F | Cl | c-Pr | *1 |
| 9-004 | CHF ₂ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 9-005 | CHF ₂ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-2-F | *1 |
| 9-006 | CHF ₂ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-Cl | 146.0-148.0 |
| 9-007 | CHF ₂ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CF ₃ | *1 |
| 9-008 | CHF ₂ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 116.0-118.0 |
| 9-009 | CHF ₂ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | *1 |
| 9-010 | CHF ₂ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | *1 |
| 9-011 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 149.0-152.0 |
| 9-012 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 146.0-148.0 |
| 9-013 | CHF ₂ | H | H | F | F | CF ₃ | Ph-4-Cl | *1 |
| 9-014 | CHF ₂ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | *1 |
| 9-015 | CF ₃ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | 55.0-58.0 |
| 9-016 | CHF ₂ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 121.0-125.0 |
| 9-017 | CF ₃ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 140.0-142.0 |
| 9-018 | CHF ₂ | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | *1 |
| 9-019 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 133.0-135.0 |
| 9-020 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | *1 |

[0461] [表12]

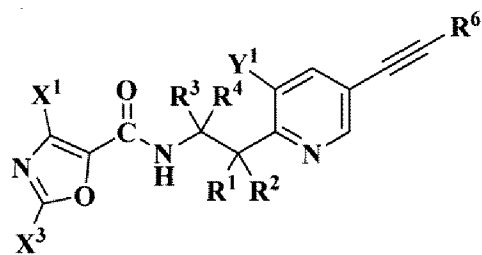
第 1 2 表



| No. | X ¹ | X ³ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|--------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|------------|
| 10-001 | CF ₃ | CH ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | *1 |

[0462] [表13]

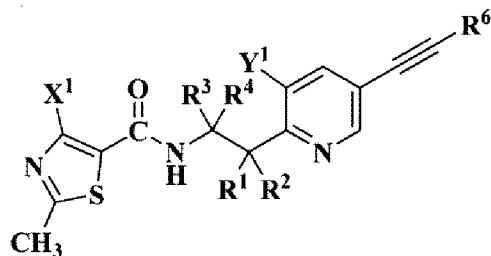
第 1 3 表



| No. | X ¹ | X ³ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|--------|-----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|------------|
| 11-001 | CF ₃ | H | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | *1 |

[0463] [表14]

第 1 4 表

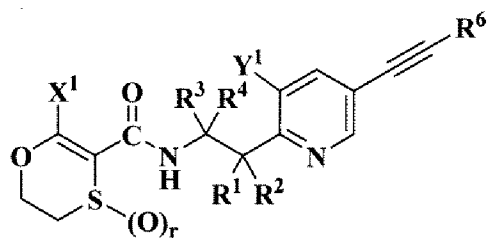


| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|--------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|-------------|
| 12-001 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 149.0-152.0 |
| 12-002 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CH ₃ | 153.0-155.0 |
| 12-003 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 156.0-158.0 |
| 12-004 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-Cl ₂ | 125.0-127.0 |
| 12-005 | CF ₃ | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 127.0-130.0 |
| 12-006 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-22 | 158.0-161.0 |
| 12-007 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | T-26 | 170.0-174.0 |

[0464]

[表15]

第 1 5 表

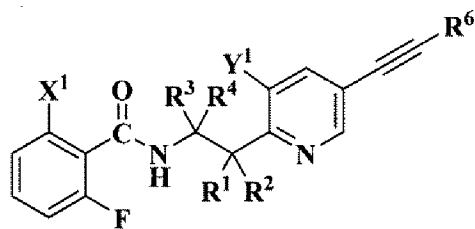


| No. | X ¹ | r | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|--------|-----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------------|
| 13-001 | CF ₃ | 0 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 151.0-153.0 |
| 13-002 | CF ₃ | 1 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 174.0-178.0 |
| 13-003 | CF ₃ | 2 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 168.0-170.0 |

[0465]

[表16-1]

第 16 表



| No. | X ¹ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|--------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--------------------------------------|-------------|
| 14-001 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 160.0-161.0 |
| 14-002 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F | 138.0-140.0 |
| 14-003 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 174.0-177.0 |
| 14-004 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ | 148.0-150.0 |
| 14-005 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ | 141.0-143.0 |
| 14-006 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CN | 203.0-205.0 |
| 14-007 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4-F ₂ | 126.0-128.0 |
| 14-008 | F | H | H | F | F | Cl | D-2-2a | 157.0-159.0 |
| 14-009 | F | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 145.0-148.0 |
| 14-010 | F | H | H | H | H | Cl | Ph-4-F | 144.0-146.0 |
| 14-011 | F | H | H | F | H | Cl | Ph-4-F | 147.0-149.0 |
| 14-012 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-2-Cl | 163.5-164.5 |
| 14-013 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl | 164.0-166.0 |
| 14-014 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 132.5-135.5 |
| 14-015 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Br | 158.5-159.5 |
| 14-016 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ | 151.0-153.0 |
| 14-017 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CH ₃ | 174.0-177.0 |
| 14-018 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CH ₃ | 177.0-180.0 |
| 14-019 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Bu-t | *1 |
| 14-020 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-2-OCH ₃ | 155.0-158.0 |
| 14-021 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ | 134.0-139.0 |
| 14-022 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₃ | 156.0-159.0 |
| 14-023 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCHF ₂ | 138.0-139.0 |
| 14-024 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCF ₃ | 123.0-126.0 |
| 14-025 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCH ₃ | 150.0-155.0 |
| 14-026 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CH ₃ | 184.0-187.0 |
| 14-027 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CH ₃ | 182.0-185.0 |
| 14-028 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCF ₃ | 122.0-124.0 |
| 14-029 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-4-NO ₂ | 197.0-199.0 |
| 14-030 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4-F ₂ | 157.0-160.0 |
| 14-031 | Cl | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4-F ₂ | 187.5-190.0 |
| 14-032 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3,5-F ₂ | 148.0-151.0 |
| 14-033 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl-4-F | 158.0-159.0 |
| 14-034 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 119.0-121.0 |
| 14-035 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 133.0-135.0 |
| 14-036 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4-Cl ₂ | 173.0-174.0 |

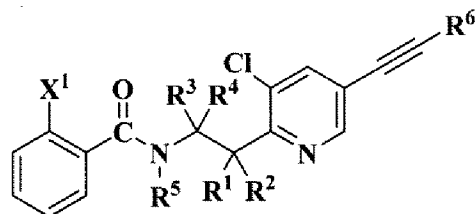
[0466]

[表16-2]

| | | | | | | | | |
|--------|-----------------|-----------------|---|------------------------------------|-----------------|----|-----------------------------|-------------|
| 14-037 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 120.0-121.5 |
| 14-038 | CF ₃ | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 125.0-126.0 |
| 14-039 | F | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 165.0-168.0 |
| 14-040 | F | H | H | F | F | Cl | D-1-2a | 146.0-149.0 |
| 14-041 | F | H | H | F | F | Cl | D-2-1a | 144.0-146.0 |
| 14-042 | F | H | H | F | F | Cl | (D-8-2b)-2-CH ₃ | 147.5-149.5 |
| 14-043 | F | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-Cl | 170.0-174.0 |
| 14-044 | F | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-2-F | 136.0-139.0 |
| 14-045 | F | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-4-F | 162.0-164.0 |
| 14-046 | F | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 14-047 | F | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-F | 148.0-149.0 |
| 14-048 | F | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-F | 167.0-169.0 |
| 14-049 | F | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 164.0-166.0 |
| 14-050 | F | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 176.0-177.0 |
| 14-051 | F | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | 155.0-157.0 |
| 14-052 | F | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-CF ₃ | 155.0-159.0 |
| 14-053 | F | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-3-F | 136.0-139.0 |

[0467] [表17]

第 17 表

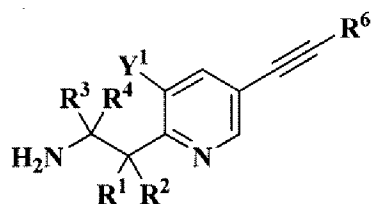


| No. | X ¹ | R ⁵ | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | R ⁶ | m. p. (°C) |
|--------|-----------------|------------------------------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|-------------|
| 15-001 | CF ₃ | c-Pr | CH ₃ | H | F | F | c-Pr | *1 |
| 15-002 | CF ₃ | Et | H | H | F | F | Ph-4-Cl | 100.0-103.0 |
| 15-003 | CF ₃ | CH ₂ OEt | H | H | F | F | Ph-4-Cl | 107.0-109.0 |
| 15-004 | CF ₃ | CH ₂ CN | H | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |
| 15-005 | CF ₃ | CH ₂ CH=CH ₂ | H | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |
| 15-006 | CF ₃ | CH ₂ C≡CH | H | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |
| 15-007 | CF ₃ | SCCl ₃ | H | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |
| 15-008 | CF ₃ | C(O)CH ₃ | H | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |
| 15-009 | CF ₃ | C(O)OCH ₃ | H | H | F | F | Ph-4-Cl | 99.0-100.0 |
| 15-010 | CF ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Ph-4-Cl | 148.0-149.0 |
| 15-011 | CF ₃ | CH ₂ Pr-c | H | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |
| 15-012 | CF ₃ | CH ₂ OCH ₃ | H | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |
| 15-013 | CF ₃ | c-Pr | CH ₃ | H | F | F | Ph-2-F | *1 |
| 15-014 | CF ₃ | c-Pr | CH ₃ | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |
| 15-015 | CF ₃ | c-Pr | CH ₃ | H | F | F | Ph-3-F-4-Cl | *1 |
| 15-016 | CF ₃ | i-Pr | H | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |
| 15-017 | CF ₃ | CH ₂ SCH ₃ | CH ₃ | H | F | F | Ph-4-Cl | *1 |

[0468]

[表18-1]

第 18 表



| No. | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|--------|-----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|--------------------------------------|-------------|
| 16-001 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 49.0-51.0 |
| 16-002 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F | *1 |
| 16-003 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 16-004 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 72.0-74.0 |
| 16-005 | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-F ₂ | 110.0-113.0 |
| 16-006 | H | H | F | F | Cl | D-2-2a | 68.0-70.0 |
| 16-007 | H | H | F | F | Cl | D-23-2a | 103.0-105.0 |
| 16-008 | H | H | F | F | Cl | D-23-3a | 113.0-115.0 |
| 16-009 | H | H | CH ₃ | F | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 16-010 | CH ₃ | H | F | F | Cl | c-Pr | *1 |
| 16-011 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | *1 |
| 16-012 | H | H | H | H | Cl | Ph-4-F | 116.0-119.0 |
| 16-013 | H | H | F | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 16-014 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-Cl | 66.5-68.0 |
| 16-015 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl | *1 |
| 16-016 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 85.0-88.0 |
| 16-017 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Br | 96.0-98.0 |
| 16-018 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ | *1 |
| 16-019 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CH ₃ | 51.0-53.0 |
| 16-020 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CH ₃ | 63.0-65.0 |
| 16-021 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Bu-t | 73.0-76.0 |
| 16-022 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ | *1 |
| 16-023 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ | *1 |
| 16-024 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-OCH ₃ | 84.0-86.0 |
| 16-025 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ | 83.0-87.0 |
| 16-026 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₃ | *1 |
| 16-027 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCHF ₂ | *1 |
| 16-028 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCF ₃ | *1 |
| 16-029 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCH ₃ | 104.0-108.0 |
| 16-030 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CH ₃ | 109.0-112.0 |
| 16-031 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CH ₃ | 136.0-138.0 |
| 16-032 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCF ₃ | 62.0-65.0 |
| 16-033 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-NO ₂ | 90.0-94.0 |
| 16-034 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CN | *1 |
| 16-035 | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 53.0-56.0 |
| 16-036 | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ | 84.0-87.0 |
| 16-037 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl-4-F | 73.0-76.0 |

[0469]

[表18-2]

| | | | | | | | |
|--------|-----------------|---|------------------------------------|-----------------|----|--------------------------------------|-------------|
| 16-038 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 78.0-81.0 |
| 16-039 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 70.0-73.0 |
| 16-040 | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 73.0-76.0 |
| 16-041 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | *1 |
| 16-042 | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 109.0-111.0 |
| 16-043 | H | H | F | F | Cl | D-1-2a | *1 |
| 16-044 | H | H | F | F | Cl | D-2-1a | *1 |
| 16-045 | H | H | F | F | Cl | (D-8-2b)-2-CH ₃ | 82.0-84.0 |
| 16-046 | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | 109.0-111.0 |
| 16-047 | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-Cl | 142.0-144.0 |
| 16-048 | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-2-F | 98.0-100.0 |
| 16-049 | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 16-050 | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | Ph-4-F | 60.0-62.0 |
| 16-051 | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 16-052 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 16-053 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₃ | *1 |
| 16-054 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CN | *1 |
| 16-055 | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 16-056 | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F | 85.0-88.0 |
| 16-057 | H | H | H | H | Cl | Ph-4-Cl | 60.0-63.0 |
| 16-058 | H | H | H | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | 103.0-106.0 |
| 16-059 | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 73.0-77.0 |
| 16-060 | H | H | F | H | Cl | Ph-4-Cl | *1 |
| 16-061 | H | H | F | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | *1 |
| 16-062 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 89.0-90.0 |
| 16-063 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-Cl | 69.0-71.0 |
| 16-064 | H | H | F | F | Cl | (D-1-2b)-2-CH ₃ | *1 |
| 16-065 | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-5-CH ₃ | *1 |
| 16-066 | H | H | F | F | Cl | (D-6-1a)-1-CH ₃ | *1 |
| 16-067 | H | H | F | F | Cl | D-23-1a | *1 |
| 16-068 | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-CF ₃ | 137.0-139.0 |
| 16-069 | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-3-F | 125.0-127.0 |
| 16-070 | H | H | F | F | Cl | D-25-1a | 102.0-104.0 |
| 16-071 | H | H | F | F | Cl | D-25-3a | 149.0-151.0 |
| 16-072 | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-2-F | *1 |
| 16-073 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F | *1 |
| 16-074 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | *1 |
| 16-075 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 69.0-71.0 |
| 16-076 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 72.0-74.0 |
| 16-077 | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | 84.0-86.0 |
| 16-078 | H | H | H | H | Cl | Ph-3-F | *1 |
| 16-079 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CF ₃ | 81.0-83.0 |
| 16-080 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CF ₃ | 124.0-125.0 |
| 16-081 | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-Cl ₂ | 100.0-101.0 |
| 16-082 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 73.0-75.0 |
| 16-083 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 96.5-97.5 |
| 16-084 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ -4-F | 74.0-76.0 |
| 16-085 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-3-CF ₃ | 95.0-96.0 |

[0470]

[表18-3]

| | | | | | | | |
|--------|-----------------|---|------------------------------------|---|-----------------|----------------------------------|-------------|
| 16-086 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 75.0-76.0 |
| 16-087 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 70.0-71.0 |
| 16-088 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-F | 89.0-90.0 |
| 16-089 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 95.5-97.5 |
| 16-090 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCH ₃ | 89.5-91.5 |
| 16-091 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCF ₃ | 40.0-41.0 |
| 16-092 | H | H | F | F | Cl | T-17 | 90.0-93.0 |
| 16-093 | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | 124.0-126.0 |
| 16-094 | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 105.0-107.0 |
| 16-095 | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | 100.0-104.0 |
| 16-096 | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 120.0-122.0 |
| 16-097 | H | H | F | F | Cl | 2-Naph | 84.0-85.0 |
| 16-098 | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-Cl | 123.0-126.0 |
| 16-099 | H | H | F | F | Cl | (D-23-1b)-3, 5-Cl ₂ | 108.0-110.0 |
| 16-100 | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-Cl | *1 |
| 16-101 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | *1 |
| 16-102 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | *1 |
| 16-103 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-F ₂ | 46.0-47.0 |
| 16-104 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 65.0-67.0 |
| 16-105 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 57.0-60.0 |
| 16-106 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | *1 |
| 16-107 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | *1 |
| 16-108 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | *1 |
| 16-109 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 64.0-68.0 |
| 16-110 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 81.0-83.0 |
| 16-111 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | *1 |
| 16-112 | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-Cl | 127.0-129.0 |
| 16-113 | H | H | F | F | CF ₃ | Ph-4-Cl | 107.0-108.0 |
| 16-114 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-31-a) | 129.0-130.0 |
| 16-115 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-32-a) | 114.0-116.0 |
| 16-116 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-34-a) | 176.0-178.0 |
| 16-117 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | 50.0-52.0 |
| 16-118 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | 60.0-62.0 |
| 16-119 | H | H | F | F | Cl | T-15 | *1 |
| 16-120 | H | H | F | F | Cl | T-22 | 82.0-86.0 |
| 16-121 | H | H | F | F | Cl | 1-Naph | 106.0-107.0 |
| 16-122 | H | H | F | F | Cl | T-27 | 109.0-111.0 |
| 16-123 | H | H | F | F | Cl | T-28 | 129.0-132.0 |
| 16-124 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | *1 |
| 16-125 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 76.0-80.0 |
| 16-126 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | *1 |
| 16-127 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-Cl ₂ | *1 |
| 16-128 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | *1 |
| 16-129 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | *1 |
| 16-130 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | *1 |
| 16-131 | CH ₃ | H | F | F | Cl | T-17 | 53.0-55.0 |
| 16-132 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | 68.0-71.0 |
| 16-133 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 76.0-79.0 |

[0471]

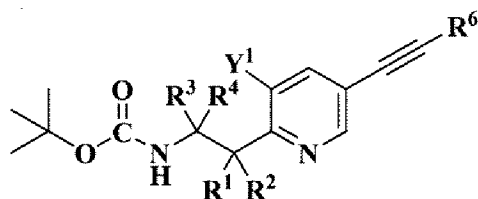
[表18-4]

| | | | | | | | |
|--------|----|---|---|---|----|---------|-------------|
| 16-134 | H | H | F | F | C1 | T-16 | 95.0-99.0 |
| 16-135 | H | H | F | F | C1 | T-25 | 91.0-93.0 |
| 16-136 | H | H | F | F | C1 | T-26 | 60.0-63.0 |
| 16-137 | H | H | F | F | C1 | T-40 | 129.0-133.0 |
| 16-138 | H | H | F | F | C1 | T-42 | 98.0-99.0 |
| 16-139 | H | H | F | F | C1 | T-44 | 102.0-105.0 |
| 16-140 | H | H | F | F | C1 | T-46 | 152.0-155.0 |
| 16-141 | H | H | F | F | C1 | T-51 | 136.0-139.0 |
| 16-142 | H | H | F | F | C1 | T-60 | 131.0-134.0 |
| 16-143 | H | H | F | F | C1 | D-23-2c | 93.0-96.0 |
| 16-144 | Et | H | F | F | C1 | Ph-4-C1 | *1 |

[0472]

[表19-1]

第 19 表



| No. | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|--------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--------------------------------------|-------------|
| 17-001 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 123.0-124.0 |
| 17-002 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F | 99.0-102.0 |
| 17-003 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-F | 107.0-108.0 |
| 17-004 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl | 123.0-126.0 |
| 17-005 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | 116.0-118.0 |
| 17-006 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ | 118.0-119.0 |
| 17-007 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ | 101.0-103.0 |
| 17-008 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 111.0-113.0 |
| 17-009 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ | 60.0-62.0 |
| 17-010 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₃ | 125.5-128.0 |
| 17-011 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CN | 134.0-136.0 |
| 17-012 | H | H | F | F | Cl | Ph-2,4-F ₂ | 108.0-109.5 |
| 17-013 | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4-F ₂ | 94.0-96.5 |
| 17-014 | H | H | F | F | Cl | Ph-3,5-F ₂ | 92.5-94.0 |
| 17-015 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 95.0-97.0 |
| 17-016 | H | H | F | F | Cl | D-2-2a | 109.0-111.0 |
| 17-017 | H | H | F | F | Cl | D-23-2a | 156.0-158.0 |
| 17-018 | H | H | F | F | Cl | D-23-3a | 99.0-101.0 |
| 17-019 | CH ₃ | H | F | F | Cl | c-Pr | *1 |
| 17-020 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | *1 |
| 17-021 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₃ | *1 |
| 17-022 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CN | *1 |
| 17-023 | H | H | H | H | Cl | Ph-4-F | 109.0-111.0 |
| 17-024 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-Cl | 133.0-134.0 |
| 17-025 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Br | 117.0-120.0 |
| 17-026 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ | 95.0-97.0 |
| 17-027 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CH ₃ | 111.0-112.0 |
| 17-028 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-CH ₃ | 108.0-110.0 |
| 17-029 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-Bu-t | *1 |
| 17-030 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-OCH ₃ | 119.0-120.0 |
| 17-031 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCHF ₂ | 121.0-123.0 |
| 17-032 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCF ₃ | 116.0-118.0 |
| 17-033 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCH ₃ | 101.0-103.0 |
| 17-034 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CH ₃ | 117.0-119.0 |
| 17-035 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CH ₃ | *1 |
| 17-036 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SCF ₃ | 104.0-106.0 |
| 17-037 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-NO ₂ | 158.0-159.0 |

[0473]

[表19-2]

| | | | | | | | |
|--------|-----------------|---|------------------------------------|-----------------|----|--------------------------------------|-------------|
| 17-038 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-Cl-4-F | 125.0-128.0 |
| 17-039 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 104.0-107.0 |
| 17-040 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 111.0-114.0 |
| 17-041 | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4-Cl ₂ | 118.0-121.0 |
| 17-042 | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4,5-F ₃ | 108.0-110.0 |
| 17-043 | H | H | F | F | Cl | D-1-2a | *1 |
| 17-044 | H | H | F | F | Cl | D-2-1a | 100.0-104.0 |
| 17-045 | H | H | F | F | Cl | (D-8-2b)-2-CH ₃ | *1 |
| 17-046 | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | *1 |
| 17-047 | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-Cl | 114.0-117.0 |
| 17-048 | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-2-F | 110.0-113.0 |
| 17-049 | H | H | F | F | Cl | (D-23-3b)-3-F | 112.0-114.0 |
| 17-050 | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 17-051 | H | H | CH ₃ | CH ₃ | Cl | Ph-4-F | 70.0-73.0 |
| 17-052 | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-F | 103.0-104.0 |
| 17-053 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-F | 117.0-119.0 |
| 17-054 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-4-CF ₃ | 99.0-101.0 |
| 17-055 | CH ₃ | H | OCH ₃ | H | Cl | Ph-4-F | *1 |
| 17-056 | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F | 129.0-129.5 |
| 17-057 | H | H | H | H | Cl | Ph-4-Cl | 134.0-138.0 |
| 17-058 | H | H | H | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | 132.0-134.0 |
| 17-059 | H | H | H | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 123.0-125.0 |
| 17-060 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 98.0-99.0 |
| 17-061 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 119.0-121.0 |
| 17-062 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 114.0-116.0 |
| 17-063 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-Cl | 143.0-145.0 |
| 17-064 | H | H | F | F | Cl | (D-1-2b)-2-CH ₃ | *1 |
| 17-065 | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-5-CH ₃ | *1 |
| 17-066 | H | H | F | F | Cl | (D-6-1a)-1-CH ₃ | *1 |
| 17-067 | H | H | F | F | Cl | D-23-1a | *1 |
| 17-068 | H | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-CF ₃ | 113.0-115.0 |
| 17-069 | H | H | F | F | Cl | D-25-1a | 119.0-121.0 |
| 17-070 | H | H | F | F | Cl | D-25-3a | 153.0-155.0 |
| 17-071 | H | H | CH ₃ | H | Cl | Ph-2-F | *1 |
| 17-072 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Si(CH ₃) ₃ | 88.0-90.0 |
| 17-073 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F | 108.0-110.0 |
| 17-074 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 127.0-129.0 |
| 17-075 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-Cl | 117.0-119.0 |
| 17-076 | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-F | 123.0-124.0 |
| 17-077 | H | H | H | H | Cl | Ph-3-F | *1 |
| 17-078 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-S(O)CF ₃ | 122.0-124.0 |
| 17-079 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-SO ₂ CF ₃ | 122.0-125.0 |
| 17-080 | H | H | F | F | Cl | Ph-3,4-Cl ₂ | 130.0-131.0 |
| 17-081 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-CF ₃ -4-F | 102.0-104.0 |
| 17-082 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-3-CF ₃ | 116.0-118.0 |
| 17-083 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 119.0-120.0 |
| 17-084 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 119.0-120.0 |
| 17-085 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-F | 121.5-122.5 |

[0474]

[表19-3]

| | | | | | | | |
|--------|-----------------|---|------------------------------------|---|-----------------|---|-------------|
| 17-086 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 119.0-121.0 |
| 17-087 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCH ₃ | 114.5-115.5 |
| 17-088 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCF ₃ | 115.0-117.0 |
| 17-089 | H | H | F | F | Cl | T-17 | 94.0-97.0 |
| 17-090 | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | 92.0-93.0 |
| 17-091 | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 130.0-132.0 |
| 17-092 | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | 123.0-125.0 |
| 17-093 | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 148.0-151.0 |
| 17-094 | H | H | F | F | Cl | 2-Naph | 96.0-98.0 |
| 17-095 | H | H | F | F | Cl | (D-2-2b)-2-CH ₃ -5-Cl | *1 |
| 17-096 | H | H | F | F | Cl | (D-23-1b)-3, 5-Cl ₂ | 108.0-110.0 |
| 17-097 | H | H | -CH ₂ CH ₂ - | | Cl | Ph-4-Cl | 142.0-143.0 |
| 17-098 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | *1 |
| 17-099 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-F ₂ | 93.0-96.0 |
| 17-100 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-F ₂ | 122.0-124.0 |
| 17-101 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 104.0-107.0 |
| 17-102 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CH ₃ | 129.0-131.0 |
| 17-103 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 109.0-111.0 |
| 17-104 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-CF ₃ | 95.0-98.0 |
| 17-105 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-OCH ₃ -4-Cl | 119.0-120.0 |
| 17-106 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 6-F ₃ | 123.0-125.0 |
| 17-107 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 4, 5-F ₃ | 132.0-134.0 |
| 17-108 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ -4-Cl | 118.0-121.0 |
| 17-109 | CH ₃ | H | F | F | Cl | (D-23-2b)-6-Cl | 138.0-139.0 |
| 17-110 | H | H | F | F | CF ₃ | Ph-4-Cl | 136.0-138.0 |
| 17-111 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OPen | 119.0-121.0 |
| 17-112 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-OCH ₂ CF ₃ | 132.0-136.0 |
| 17-113 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-31-a) | 114.0-116.0 |
| 17-114 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-32-a) | 164.0-166.0 |
| 17-115 | H | H | F | F | Cl | Ph-4-(D-34-a) | 108.0-111.0 |
| 17-116 | H | H | F | F | Cl | Ph-2, 6-F ₂ | 112.0-114.0 |
| 17-117 | H | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-(CF ₃) ₂ | 69.0-72.0 |
| 17-118 | H | H | F | F | Cl | Ph-2-F-4-OCHF ₂ | 122.0-123.0 |
| 17-119 | H | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCHF ₂ | 116.0-118.0 |
| 17-120 | H | H | F | F | Cl | T-15 | *1 |
| 17-121 | H | H | F | F | Cl | T-22 | 131.0-133.0 |
| 17-122 | H | H | F | F | Cl | 1-Naph | 118.0-119.0 |
| 17-123 | H | H | F | F | Cl | T-25 | 125.0-127.0 |
| 17-124 | H | H | F | F | Cl | T-26 | 108.0-109.0 |
| 17-125 | H | H | F | F | Cl | T-27 | 109.0-111.0 |
| 17-126 | H | H | F | F | Cl | T-28 | 129.0-132.0 |
| 17-127 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | 135.0-137.0 |
| 17-128 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-3, 4-Cl ₂ | 137.0-139.0 |
| 17-129 | CH ₃ | H | H | H | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-Cl | 105.0-107.0 |
| 17-130 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4-Cl ₂ | 123.0-125.0 |
| 17-131 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2-CH ₃ -4-F | 97.0-100.0 |
| 17-132 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-CF ₃ -4-F | 111.0-113.0 |
| 17-133 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3-F-4-OCF ₃ | 103.0-106.0 |

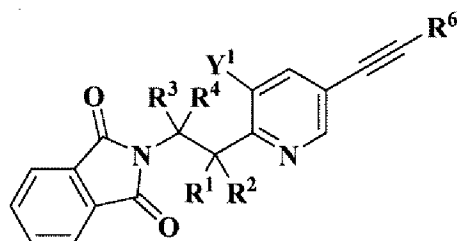
[0475]

[表19-4]

| | | | | | | | |
|--------|-----------------|---|---|---|----|------------------------------|-------------|
| 17-134 | CH ₃ | H | F | F | Cl | T-17 | 97.0-100.0 |
| 17-135 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-2, 4, 5-F ₃ | 124.0-127.0 |
| 17-136 | CH ₃ | H | F | F | Cl | Ph-3, 5-F ₂ -4-Cl | 123.0-124.0 |
| 17-137 | H | H | F | F | Cl | T-16 | 156.0-158.0 |
| 17-138 | H | H | F | F | Cl | T-40 | 172.0-174.0 |
| 17-139 | H | H | F | F | Cl | T-42 | 157.0-159.0 |
| 17-140 | H | H | F | F | Cl | T-44 | 121.0-123.0 |
| 17-141 | H | H | F | F | Cl | T-46 | 144.0-147.0 |
| 17-142 | H | H | F | F | Cl | T-51 | 178.0-179.0 |
| 17-143 | H | H | F | F | Cl | T-60 | 167.0-169.0 |
| 17-144 | H | H | F | F | Cl | D-23-2c | 143.0-145.0 |
| 17-145 | Et | H | F | F | Cl | Ph-4-Cl | *1 |

[0476] [表20]

第20表



| No. | R ³ | R ⁴ | R ¹ | R ² | Y ¹ | R ⁶ | m. p. (°C) |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------------|-------------|
| 18-001 | H | H | CH ₃ | F | Cl | Ph-4-F | 153.0-155.0 |
| 18-002 | H | H | F | H | Cl | Ph-4-F | 184.0-186.0 |
| 18-003 | H | H | F | H | Cl | Ph-2-F | 181.0-182.0 |
| 18-004 | H | H | F | H | Cl | Ph-4-Cl | 182.0-184.0 |
| 18-005 | H | H | F | H | Cl | Ph-4-CF ₃ | 171.0-173.0 |
| 18-006 | H | H | F | H | Cl | Ph-2-F-4-Cl | 153.0-157.0 |

第3表～第20表の化合物のうち、表中に融点の記載のない化合物のスペクトルデータを第21表に示す。

[0477]

[表21-1]

第 2 1 表

| No. | ¹ H NMR (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300MHz) |
|----------|--|
| 1-012 | δ 8.65-8.7 (m, 2H), 8.59 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.99 (d, J=2.0Hz, 1H), 7.65-7.7 (m, 1H), 7.5-7.6 (m, 3H), 7.4-7.45 (m, 2H), 6.44 (bs, 1H), 4.4-4.6 (m, 2H)。 |
| 1-015(+) | [α] _D ^{20.0} +6.38° (CHCl ₃ , c=0.0008), 99%e.e. |
| 1-015(-) | [α] _D ^{20.0} -6.64° (CHCl ₃ , c=0.0011), 99%e.e. |
| 1-018 | δ 8.52 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.93 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.4-7.7 (m, 6H), 7.0-7.15 (m, 3H), 1.76 (s, 6H)。 |
| 1-031 | δ 8.53 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.93 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.5-7.7 (m, 4H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.35-7.4 (m, 2H), 6.50 (t, J=6.3Hz, 1H), 4.46 (td, J=13.5, 6.3Hz, 2H), 1.33 (s, 9H)。 |
| 1-035 | δ 8.55 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.5-7.7 (m, 4H), 7.29 (t, J=7.8Hz, 1H), 7.14 (dt, J=7.8, 1.5Hz, 1H), 7.06 (dd, J=2.7, 1.5Hz, 1H), 6.96 (ddd, J=7.8, 2.7, 1.5Hz, 1H), 6.46 (t, J=6.3Hz, 1H), 4.47 (td, J=13.2, 6.3Hz, 2H), 3.84 (s, 3H)。 |
| 1-062 | δ 8.5-8.6 (m, 1H), 7.8-7.9 (m, 1H), 7.65-7.7 (m, 1H), 7.45-7.65 (m, 2H), 7.3-7.4 (m, 1H), 6.27 (d, J=9.9Hz, 1H), 5.2-5.45 (m, 1H), 1.70 (d, J=19.8Hz, 6H), 1.45 (d, J=6.8Hz, 3H)。 |
| 1-064 | δ 8.58 (d, J=1.7Hz, 1H), 8.0-8.1 (m, 2H), 7.93 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.8-7.9 (m, 2H), 7.5-7.8 (m, 2H), 6.9-7.0 (m, 2H), 6.36 (d, J=9.5Hz, 1H), 5.2-5.4 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 1.42 (d, J=7.2Hz, 3H)。 |
| 1-074 | δ 8.4-8.5 (m, 1H), 7.85-7.9 (m, 1H), 7.5-7.7 (m, 4H), 7.27 (d, J=1.8Hz, 1H), 6.50 (t, J=6.0Hz, 1H), 6.42 (d, J=1.8Hz, 1H), 4.4-4.5 (m, 2H), 2.44 (s, 3H)。 |
| 1-117 | δ 8.60 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.93 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.75-7.85 (m, 1H), 7.6-7.7 (m, 1H), 7.45-7.6 (m, 2H), 7.25-7.4 (m, 2H), 7.1-7.2 (m, 1H), 6.29 (d, J=8.9Hz, 1H), 5.2-5.45 (m, 1H), 1.47 (d, J=7.1Hz, 3H)。 |
| 1-140 | δ 8.80 (d, J=2.1Hz, 1H), 8.50 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.91 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.86 (dd, J=7.8, 2.1Hz, 1H), 7.5-7.7 (m, 5H), 6.47 (bs, 1H), 4.4-4.55 (m, 2H)。 |
| 2-001 | δ 8.73 (d, J=5.1Hz, 1H), 8.59 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.23 (t, J=6.0Hz, 1H), 8.17 (d, J=5.1Hz, 1H), 7.93 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.5-7.6 (m, 3H), 7.05-7.15 (m, 2H), 4.4-4.55 (m, 2H)。 |
| 2-002 | δ 8.65-8.7 (m, 1H), 8.55-8.6 (m, 1H), 8.4-8.5 (m, 1H), 8.1-8.25 (m, 1H), 7.85-7.9 (m, 1H), 7.75-7.8 (m, 1H), 7.4-7.5 (m, 2H), 7.3-7.4 (m, 2H), 5.15-5.45 (m, 1H), 1.49 (d, J=6.5Hz, 3H)。 |
| 2-015 | δ 8.64 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.42 (ddd, J=4.5, 1.5, 0.6Hz, 1H), 8.11 (bs, 1H), 7.80 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.78 (ddd, J=8.4, 1.5, 0.6Hz, 1H), 7.51 (td, J=7.2, 1.8Hz, 1H), 7.3-7.4 (m, 2H), 7.1-7.15 (m, 2H), 3.8-3.9 (m, 3H), 1.34 (d, J=6.6Hz, 3H)。 |
| 2-058 | δ 8.61 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.47 (dd, J=4.8, 1.8Hz, 1H), 8.15-8.2 (m, 1H), 7.93 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.78 (dd, J=8.4, 1.8Hz, 1H), 7.65-7.7 (m, 4H), 7.36 (dd, J=8.4, 1.8Hz, 1H), 5.25-5.4 (m, 1H), 1.50 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 2-084 | δ 8.74 (d, J=4.8Hz, 1H), 8.57 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.13 (d, J=8.4Hz, 1H), |

[0478]

[表21-2]

| | |
|-------|---|
| | 8.04 (d, J=9.9Hz, 1H), 7.91 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.56 (dd, J=8.4, 4.8Hz, 1H), 7.3-7.4 (m, 3H), 5.25-5.4 (m, 1H), 1.37 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 3-002 | δ 8.55-8.6 (m, 2H), 8.45-8.5 (m, 1H), 8.1-8.15 (m, 1H), 7.95-8.05 (m, 1H), 7.93 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.3-7.4 (m, 3H), 7.05-7.15 (m, 1H), 4.35-4.6 (m, 2H)。 |
| 3-018 | δ 8.80 (dd, J=4.8, 1.7Hz, 1H), 8.56 (d, J=1.7Hz, 1H), 8.06 (dd, J=7.8, 1.7Hz, 1H), 7.94 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.68 (dd, J=7.8, 4.8Hz, 1H), 7.5-7.6 (m, 2H), 7.05-7.15 (m, 3H), 6.9-7.0 (m, 1H), 4.50 (td, J=13.2, 6.3Hz, 2H)。 |
| 3-026 | δ 8.58 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.46 (dd, J=4.8, 2.1Hz, 1H), 8.12 (dd, J=7.5, 2.1Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.4-7.45 (m, 2H), 7.34 (dd, J=7.5, 4.8Hz, 1H), 7.32 (bs, 1H), 4.49 (td, J=13.5, 6.3Hz, 2H), 1.34 (s, 9H)。 |
| 3-051 | δ 8.51 (d, J=1.7Hz, 1H), 8.4-8.45 (m, 1H), 8.1-8.15 (m, 1H), 7.80 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.7-7.75 (m, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.3-7.35 (m, 1H), 7.0-7.1 (m, 2H), 3.92 (d, J=6.5Hz, 2H), 1.60 (s, 6H)。 |
| 3-059 | δ 8.7-8.75 (m, 1H), 8.61 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.97 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.8-7.85 (m, 1H), 7.65 (s, 4H), 7.45-7.5 (m, 1H), 6.86 (t, J=55.9Hz, 1H), 6.60 (d, J=9.5Hz, 1H), 5.2-5.45 (m, 1H), 1.50 (d, J=6.8Hz, 3H)。 |
| 3-062 | δ 8.67 and 8.60 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.45-8.5 and 8.35-8.45 (m, 1H), 8.09 and 7.76 (dd, J=8.0, 2.5Hz, 1H), 7.94 and 6.75 (d, J=8.0Hz, 1H), 7.85 and 7.82 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.45-7.6 (m, 2H), 7.2-7.4 (m, 1H), 7.0-7.15 (m, 2H), 4.97 and 4.84 (d, J=2.8Hz, 1H), 4.75-4.9 and 4.7-4.55 (m, 1H), 3.40 and 3.37 (s, 3H), 1.50 and 1.16 (d, J=6.7Hz, 3H)。 |
| 3-076 | δ 8.52 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.45-8.5 (m, 1H), 8.1-8.15 (m, 1H), 7.85-7.9 (m, 1H), 7.34 (dd, J=8.1, 4.8Hz, 1H), 7.30 (bs, 1H), 7.27 (d, J=1.8Hz, 1H), 6.42 (d, J=1.8Hz, 1H), 4.4-4.5 (m, 2H), 2.44 (s, 3H)。 |
| 3-175 | δ 8.61 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.45 (dd, J=4.8, 2.1Hz, 1H), 7.97 (dd, J=8.1, 2.1Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.81 (dd, J=6.9, 2.1Hz, 1H), 7.7-7.75 (m, 1H), 7.32 (dd, J=8.1, 4.8Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 1H), 7.01 (d, J=9.9Hz, 1H), 5.3-5.45 (m, 1H), 1.52 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 5-001 | δ 8.55-8.6 (m, 1H), 7.95-8.05 (m, 1H), 7.55-7.6 (m, 2H), 7.42 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.25-7.3 (m, 2H), 7.05-7.1 (m, 1H), 6.57 (d, J=2.1Hz, 1H), 4.43 (td, J=13.2, 6.6Hz, 2H)。 |
| 7-007 | δ 8.54 (d, J=2.0Hz, 1H), 7.79 (d, J=2.0Hz, 1H), 7.45-7.6 (m, 2H), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.15-7.25 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 1H), 3.4-3.7 (m, 2H), 3.05-3.35 (m, 2H)。 |
| 7-012 | δ 8.50 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.86 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.44 (d, J=5.5Hz, 1H), 7.22 (d, J=5.5Hz, 1H), 6.86 (d, J=9.2Hz, 1H), 5.15-5.35 (m, 1H), 1.74 (d, J=19.8Hz, 6H), 1.46 (d, J=6.8Hz, 3H)。 |
| 8-005 | δ 8.56 (s, 1H), 8.04 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.3-7.7 (m, 2H), 7.15-7.3 (m, 1H), 6.95-7.15 (m, 1H), 6.60 (d, J=9.8Hz, 1H), |

[0479]

[表21-3]

| | |
|--------|--|
| | 5.15-5.4 (m, 1H), 1.44 (d, J=6.7Hz, 3H)。 |
| 9-003 | δ 8.41 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.73 (d, J=1.7Hz, 1H), 6.8-6.9 (m, 1H), 6.81 (t, J=54.0Hz, 1H), 5.15-5.35 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 1.45-1.55 (m, 1H), 1.43 (d, J=6.0Hz, 3H), 0.9-1.0 (m, 2H), 0.8-0.9 (m, 2H)。 |
| 9-004 | δ 8.45-8.6 (m, 1H), 7.75-7.85 (m, 2H), 7.4-7.7 (m, 3H), 7.0-7.1 (m, 2H), 6.7-6.9 (m, 1H), 4.6-4.75 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.05-3.3 (m, 2H), 1.25-1.3 (m, 3H)。 |
| 9-005 | δ 8.57 (d, J=2.0Hz, 1H), 7.8-7.85 (m, 2H), 7.45-7.55 (m, 1H), 7.3-7.4 (m, 1H), 7.1-7.2 (m, 2H), 6.95-7.05 (m, 1H), 6.90 (t, J=53.9Hz, 1H), 4.6-4.75 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.1-3.3 (m, 2H), 1.29 (d, J=6.8Hz, 3H)。 |
| 9-007 | δ 8.62 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.97 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.75-7.85 (m, 4H), 7.05-7.1 (m, 1H), 6.77 (t, J=54.6Hz, 1H), 4.43 (td, J=12.9, 6.0Hz, 2H), 3.92 (s, 3H)。 |
| 9-009 | δ 8.57 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.80 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.4-7.45 (m, 1H), 7.15-7.2 (m, 2H), 6.95-7.0 (m, 1H), 6.89 (t, J=54.6Hz, 1H), 4.65-4.75 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.29 (dd, J=14.4, 6.9Hz, 1H), 3.17 (dd, J=14.4, 5.4Hz, 1H), 1.30 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 9-010 | δ 8.62 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.65-7.7 (m, 1H), 7.4-7.45 (m, 2H), 6.80 (t, J=54.6Hz, 1H), 6.85-6.9 (m, 1H), 5.25-5.35 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 1.46 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 9-013 | δ 8.86 (d, J=1.8Hz, 1H), 8.25 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.5-7.55 (m, 2H), 7.35-7.4 (m, 2H), 6.95-7.0 (m, 1H), 6.74 (t, J=54.6Hz, 1H), 4.44 (td, J=13.2, 6.0Hz, 2H), 3.91 (s, 3H)。 |
| 9-014 | δ 8.60 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.81 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.6-7.65 (m, 4H), 6.97 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.88 (t, J=54.6Hz, 1H), 4.65-4.75 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.26 (dd, J=14.4, 7.2Hz, 1H), 3.18 (dd, J=14.4, 5.4Hz, 1H), 1.31 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 9-018 | δ 8.53 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.77 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.40 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.25 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.17 (dd, J=8.1, 2.1Hz, 1H), 6.99 (d, J=7.8Hz, 1H), 6.89 (t, J=54.6Hz, 1H), 4.65-4.75 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.26 (dd, J=14.7, 7.2Hz, 1H), 3.16 (dd, J=14.7, 5.7Hz, 1H), 2.48 (s, 3H), 1.30 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 9-020 | δ 8.59 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.94 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.3-7.4 (m, 1H), 7.0-7.1 (m, 1H), 6.73 (d, J=9.6Hz, 1H), 5.25-5.3 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.46 (d, J=7.2Hz, 3H)。 |
| 10-001 | δ 8.60 (d, J=2.0Hz, 1H), 7.93 (d, J=2.0Hz, 1H), 7.5-7.65 (m, 3H), 7.05-7.15 (m, 2H), 4.40 (td, J=13.5, 6.5Hz, 2H), 2.53 (s, 3H)。 |
| 11-011 | δ 8.60 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.96 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.9-7.95 (m, 1H), 7.4-7.5 (m, 1H), 7.15-7.25 (m, 2H), 7.03 (d, J=9.9Hz, 1H), 5.15-5.4 (m, 1H), 1.49 (d, J=6.8Hz, 3H)。 |
| 14-019 | δ 8.56 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.93 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.3-7.45 (m, 3H), 6.9-7.0 (m, 2H), 6.65 (t, J=6.3Hz, 1H), 4.47 (td, J=13.5, 6.3Hz, 2H), 1.34 (s, 9H)。 |

[0480]

[表21-4]

| | |
|--------|--|
| 14-046 | δ 8.45-8.5 (m, 1H), 7.75-7.8 (m, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.25-7.35 (m, 1H), 6.95-7.15 (m, 3H), 6.85-6.95 (m, 2H), 3.90 (d, J=6.5Hz, 2H), 1.59 (s, 6H)。 |
| 15-004 | δ 8.62 and 8.48 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.95 and 7.86 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.35-7.8 (m, 8H), 4.45-5.0 (m, 2H), 4.2-4.35 (m, 2H)。 |
| 15-005 | δ 8.63 and 8.48 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.91 and 7.82 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.65-7.7 (m, 1H), 7.45-7.6 (m, 4H), 7.25-7.4 (m, 3H), 5.6-5.9 (m, 1H), 5.15-5.35 (m, 2H), 4.65-5.0 (m, 1H), 3.85-4.5 (m, 3H)。 |
| 15-006 | δ 8.63 and 8.49 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.93 and 7.83 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.65-7.75 (m, 1H), 7.45-7.65 (m, 4H), 7.35-7.4 (m, 3H), 4.7-5.15 (m, 2H), 4.0-4.4 (m, 2H), 2.3-2.35 (m, 1H)。 |
| 15-007 | δ 8.59 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.7-7.75 (m, 1H), 7.6-7.65 (m, 3H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.35-7.4 (m, 2H), 4.7-4.75 (m, 1H), 3.8-4.0 (m, 1H)。 |
| 15-008 | δ 8.56 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.90 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.7-7.75 (m, 1H), 7.55-7.7 (m, 3H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.35-7.4 (m, 2H), 4.80 (t, J=13.8Hz, 2H), 2.38 and 2.28 (s, 3H)。 |
| 15-011 | δ 8.62 and 8.48 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.91 and 7.82 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.3-7.7 (m, 8H), 4.9-5.05 and 4.5-4.65 (m, 2H), 4.0-4.4 (m, 1H), 3.2-3.35 and 3.05-3.2 (m, 1H), 1.15-1.3 and 0.8-0.95 (m, 1H), 0.05-0.65 (m, 4H)。 |
| 15-012 | δ 8.61 and 8.48 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.92 and 7.82 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.3-7.75 (m, 8H), 4.5-4.72 (m, 4H), 3.47 and 3.16 (s, 3H)。 |
| 15-013 | δ 8.69 and 8.63 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.99 and 7.93 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.6-7.65 (m, 1H), 7.35-7.55 (m, 4H), 7.1-7.2 (m, 2H), 6.95-7.0 (m, 1H), 5.95-6.05 (m, 1H), 2.5-2.6 (m, 1H), 1.67 and 1.59 (d, J=6.6Hz, 3H), 0.4-0.7 (m, 4H)。 |
| 15-014 | δ 8.6-8.65 (m, 1H), 7.85-7.9 (m, 1H), 7.6-7.65 (m, 1H), 7.45-7.5 (m, 4H), 7.35-7.4 (m, 2H), 6.95-7.0 (m, 1H), 5.95-6.05 (m, 1H), 2.5-2.6 (m, 1H), 1.67 and 1.58 (d, J=7.2Hz, 3H), 0.4-0.7 (m, 4H)。 |
| 15-015 | δ 8.66 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.90 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.6-7.65 (m, 1H), 7.3-7.5 (m, 5H), 6.95-7.0 (m, 1H), 5.95-6.05 (m, 1H), 2.55-2.6 (m, 1H), 1.68 and 1.58 (d, J=7.8Hz, 3H), 0.4-0.7 (m, 4H)。 |
| 15-016 | δ 8.60 and 8.45 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.89 and 7.80 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.45-7.7 (m, 6H), 7.3-7.4 (m, 2H), 4.8-4.9 (m, 1H), 3.7-4.25 (m, 2H), 1.23 and 1.20 (d, J=6.9Hz, 6H)。 |
| 15-017 | δ 8.4-8.7 (m, 1H), 7.8-7.9 (m, 1H), 7.35-7.75 (m, 8H), 4.4-5.3 (m, 3H), 2.45 and 2.25 (s, 3H), 1.35-1.8 (m, 3H)。 |
| 16-002 | δ 8.65-8.9 (m, 1H), 7.85-8.05 (m, 1H), 7.3-7.45 (m, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H), 7.0-7.15 (m, 1H), 3.4-3.6 (m, 2H), 1.59 (bs, 2H)。 |
| 16-011 | δ 8.62 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.91 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.35-7.4 (m, 2H), 3.75-4.00 (m, 1H), 1.60 (bs, 2H), 1.24 (d, J=6.8Hz, 3H)。 |
| 16-015 | δ 8.59 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.25-7.55 (m, 4H), 3.52 (t, J=14.0Hz, 2H), 1.57 (bs, 2H)。 |
| 16-018 | δ 8.6-8.65 (m, 1H), 7.9-7.95 (m, 1H), 7.2-7.35 (m, 4H), 3.45-3.6 (m, 2H), 2.52 (s, 3H), 1.53 (bs, 2H)。 |
| 16-022 | δ 8.62 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.93 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.65-7.8 (m, 2H), |

[0481]

[表21-5]

| | |
|--------|--|
| | 7.45-7.65 (m, 2H), 3.3-3.8 (m, 2H), 1.60 (bs, 2H)。 |
| 16-023 | δ 8.62 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.6-7.8 (m, 2H), 7.5-7.6 (m, 2H), 3.4-3.7 (m, 2H), 1.60 (bs, 2H)。 |
| 16-026 | δ 8.55-8.6 (m, 1H), 7.9-7.95 (m, 1H), 7.45-7.5 (m, 2H), 6.9-6.95 (m, 2H), 4.3-4.4 (m, 2H), 3.84 (s, 3H)。 |
| 16-027 | δ 8.60 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.55-7.6 (m, 2H), 7.1-7.15 (m, 2H), 6.56 (t, J=73.8Hz, 1H), 3.52 (t, J=13.8Hz, 2H), 1.53 (bs, 2H)。 |
| 16-028 | δ 8.55-8.6 (m, 1H), 7.9-8.0 (m, 1H), 7.55-7.6 (m, 2H), 7.25-7.3 (m, 2H), 3.45-3.6 (m, 2H), 1.53 (bs, 2H)。 |
| 16-034 | δ 8.62 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.6-7.75 (m, 4H), 3.4-3.7 (m, 2H), 1.60 (bs, 2H)。 |
| 16-041 | δ 8.60 and 8.57 (d, J=2.1Hz, 1H), 8.00 and 7.94 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.3-7.45 (m, 3H), 3.45-3.6 (m, 2H), 1.55 (bs, 2H)。 |
| 16-043 | δ 8.56 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.89 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.6-7.75 (m, 1H), 7.45 (t, J=1.8Hz, 1H), 6.5-6.55 (m, 1H), 3.51 (t, J=13.8Hz, 2H), 1.55 (bs, 2H)。 |
| 16-044 | δ 8.58 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.91 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.40 (dd, J=5.1, 1.2Hz, 1H), 7.38 (dd, J=3.6, 1.2Hz, 1H), 7.06 (dd, J=5.1, 3.6Hz, 1H), 3.52 (t, J=14.1Hz, 2H), 1.55-1.6 (m, 2H)。 |
| 16-053 | δ 8.4-8.45 (m, 1H), 8.00 (d, J=9.0Hz, 2H), 7.7-7.8 (m, 1H), 7.00 (d, J=9.0Hz, 2H), 4.25-4.3 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 1.63 (bs, 2H), 1.25 (d, J=6.6Hz, 3H)。 |
| 16-054 | δ 8.65 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.6-7.75 (m, 4H), 3.75-3.95 (m, 1H), 1.61 (bs, 2H), 1.25 (d, J=6.6Hz, 3H)。 |
| 16-060 | δ 8.6-8.65 (m, 1H), 7.8-7.85 (m, 1H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.35-7.4 (m, 2H), 5.85 (ddd, J=48.0, 6.9, 4.5Hz, 1H), 3.2-3.45 (m, 2H), 1.57 (bs, 2H)。 |
| 16-061 | δ 8.69 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.87 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.45-7.5 (m, 1H), 7.15-7.2 (m, 2H), 5.86 (ddd, J=48.0, 6.9, 4.5Hz, 1H), 3.2-3.4 (m, 2H), 1.56 (bs, 2H)。 |
| 16-064 | δ 8.5-8.55 (m, 1H), 7.85-7.9 (m, 1H), 7.31 (d, J=1.8Hz, 1H), 6.43 (d, J=1.8Hz, 1H), 3.51 (t, J=14.1Hz, 2H), 2.45 (s, 3H), 1.55 (bs, 2H)。 |
| 16-065 | δ 8.55 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.88 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.38 (d, J=1.5Hz, 1H), 6.85-6.9 (m, 1H), 3.51 (t, J=14.1Hz, 2H), 2.49 (d, J=1.2Hz, 3H), 1.55 (bs, 2H)。 |
| 16-066 | δ 8.60 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.38 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.51 (d, J=2.4Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.51 (t, J=14.1Hz, 2H), 1.54 (bs, 2H)。 |
| 16-067 | δ 8.65-8.7 (m, 2H), 8.00 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.75 (td, J=7.8, 1.5Hz, 1H), 7.55-7.6 (m, 1H), 7.33 (ddd, J=7.8, 4.8, 1.5Hz, 1H), 3.52 (t, J=14.1Hz, 2H), 1.57 (bs, 2H)。 |
| 16-072 | δ 8.6-8.65 (m, 1H), 7.81 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.52 (td, J=7.2, 1.8Hz, 1H), 7.3-7.4 (m, 1H), 7.1-7.15 (m, 2H), 3.45-3.6 (m, 1H), 2.9-3.0 (m, 2H), 1.63 (bs, 2H), 1.27 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 16-073 | δ 8.66 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.54 (td, J=7.2, 1.8Hz, 1H), 7.35-7.45 (m, 1H), 7.1-7.3 (m, 2H), 3.75-3.95 (m, 1H), 1.57 (bs, 2H), 1.25 (d, J=6.6Hz, 3H)。 |

[0482]

[表21-6]

| | |
|--------|---|
| 16-074 | δ 8.66 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.65-7.7 (m, 4H), 3.8-3.95 (m, 1H), 1.56 (bs, 2H), 1.25 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 16-078 | δ 8.55 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.79 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.3-7.4 (m, 2H), 7.2-7.3 (m, 1H), 7.05-7.1 (m, 1H), 3.05-3.2 (m, 4H)。 |
| 16-100 | δ 8.55-8.6 (m, 1H), 7.80 (d, J=2.4Hz, 1H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.3-7.4 (m, 2H), 2.95-3.05 (m, 2H), 1.0-1.05 (m, 4H)。 |
| 16-101 | δ 8.58 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.80 (d, J=1.2Hz, 1H), 7.4-7.5 (m, 1H), 7.15-7.2 (m, 2H), 3.5-3.55 (m, 1H), 2.9-3.1 (m, 2H), 1.94 (bs, 2H), 1.22 (d, J=6.0Hz, 3H)。 |
| 16-102 | δ 8.64 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.93 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.45-7.6 (m, 1H), 6.85-6.95 (m, 2H), 3.89 (bs, 1H), 1.15-1.3 (m, 5H)。 |
| 16-106 | δ 8.62 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.90 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.4-7.45 (m, 1H), 7.25-7.3 (m, 1H), 7.15-7.2 (m, 1H), 3.8-3.9 (m, 1H), 2.49 (s, 3H), 1.57 (bs, 2H), 1.25 (d, J=6.0Hz, 3H)。 |
| 16-107 | δ 8.68 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.97 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.6-7.7 (m, 1H), 7.4-7.5 (m, 2H), 3.8-3.9 (m, 1H), 1.59 (bs, 2H), 1.25 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 16-108 | δ 8.63 (d, J=0.9Hz, 1H), 7.92 (d, J=0.9Hz, 1H), 7.35-7.4 (m, 1H), 7.1-7.15 (m, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.8-3.9 (m, 1H), 1.56 (bs, 2H), 1.25 (d, J=7.2Hz, 3H)。 |
| 16-111 | δ 8.66 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.96 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.0-7.05 (m, 2H), 3.8-3.95 (m, 1H), 1.67 (bs, 2H), 1.25 (d, J=6.0Hz, 3H)。 |
| 16-119 | δ 8.57 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.90 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.33 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.23 (d, J=8.1Hz, 1H), 3.52 (t, J=14.1Hz, 2H), 2.9-3.0 (m, 4H), 2.0-2.2 (m, 2H), 1.59 (bs, 2H)。 |
| 16-124 | δ 8.55 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.86 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.6-7.65 (m, 4H), 3.8-3.85 (m, 1H), 3.25-3.3 (m, 2H), 1.52 (d, J=6.6Hz, 3H)。 |
| 16-126 | δ 8.55-8.6 (m, 1H), 7.95-8.0 (m, 1H), 7.42 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.26 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.18 (dd, J=8.1, 2.1Hz, 1H), 3.6-3.65 (m, 1H), 3.0-3.15 (m, 4H), 2.48 (s, 3H), 1.32 (d, J=6.3Hz, 3H)。 |
| 16-127 | δ 8.65-8.7 (m, 1H), 7.9-7.95 (m, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 7.25-7.3 (m, 1H), 3.8-3.9 (m, 1H), 1.54 (bs, 2H), 1.25 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 16-128 | δ 8.62 (d, J=1.2Hz, 1H), 7.90 (d, J=1.2Hz, 1H), 7.49 (dd, J=8.4, 5.7Hz, 1H), 6.98 (dd, J=9.3, 2.4Hz, 1H), 6.92 (td, J=8.4, 2.4Hz, 1H), 3.8-3.9 (m, 1H), 2.51 (s, 3H), 1.55 (bs, 2H), 1.25 (d, J=7.2Hz, 3H)。 |
| 16-129 | δ 8.63 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.8-7.85 (m, 1H), 7.7-7.75 (m, 1H), 7.2-7.3 (m, 1H), 3.8-3.9 (m, 1H), 1.54 (bs, 2H), 1.25 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 16-130 | δ 8.6-8.65 (m, 1H), 7.9-8.0 (m, 1H), 7.3-7.4 (m, 3H), 3.8-3.9 (m, 1H), 1.79 (bs, 2H), 1.26 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 16-144 | δ 8.62 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.90 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.35-7.4 (m, 2H), 3.45-3.6 (m, 1H), 1.7-1.8 (m, 1H), 1.48 (bs, 2H), 1.4-1.5 (m, 1H), 1.06 (t, J=7.2Hz, 3H)。 |
| 17-020 | δ 8.60 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.88 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.65-7.75 (m, 1H), 7.4-7.55 (m, 2H), 7.3-7.4 (m, 2H), 4.6-4.85 (m, 1H), 1.36 (d, J=6.5Hz, 3H), 1.90 (s, 9H)。 |

[0483]

[表21-7]

| | |
|--------|---|
| 17-021 | δ 8.55-8.6 (m, 1H), 7.85-7.9 (m, 1H), 7.6-7.75 (m, 1H), 7.45-7.55 (m, 2H), 6.85-6.95 (m, 2H), 4.55-4.85 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 1.36 (d, J=6.4Hz, 3H), 1.31 (s, 9H)。 |
| 17-022 | δ 8.63 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.6-7.7 (m, 5H), 4.6-4.9 (m, 1H), 1.37 (d, J=6.4Hz, 3H), 1.30 (s, 9H)。 |
| 17-029 | δ 8.57 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.91 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.35-7.4 (m, 2H), 5.12 (t, J=6.3Hz, 1H), 4.09 (td, J=13.2, 6.3Hz, 2H), 1.41 (s, 9H), 1.34 (s, 9H)。 |
| 17-035 | δ 8.62 (d, J=1.2Hz, 1H), 7.95-8.0 (m, 3H), 7.7-7.75 (m, 2H), 5.08 (t, J=6.3Hz, 1H), 4.10 (td, J=13.5, 6.3Hz, 2H), 3.09 (s, 3H), 1.41 (s, 9H)。 |
| 17-043 | δ 8.54 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.88 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.76 (dd, J=1.8, 0.6Hz, 1H), 7.45 (t, J=1.8Hz, 1H), 6.55 (dd, J=1.8, 1.6Hz, 1H), 5.10 (bs, 1H), 4.05-4.15 (m, 2H), 1.41 (s, 9H)。 |
| 17-045 | δ 8.60 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.94 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 5.09 (bs, 1H), 4.05-4.15 (m, 2H), 2.76 (s, 3H), 1.40 (s, 9H)。 |
| 17-064 | δ 8.53 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.86 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.27 (d, J=1.8Hz, 1H), 6.43 (d, J=1.8Hz, 1H), 5.10 (bs, 1H), 4.08 (td, J=13.2, 6.6Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 1.41 (s, 9H)。 |
| 17-065 | δ 8.53 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.87 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.37 (d, J=1.2Hz, 1H), 6.85-6.9 (m, 1H), 5.09 (bs, 1H), 4.08 (td, J=13.8, 7.2Hz, 2H), 2.49 (d, J=0.9Hz, 3H), 1.41 (s, 9H)。 |
| 17-066 | δ 8.59 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.39 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.52 (d, J=2.4Hz, 1H), 5.09 (bs, 1H), 4.05-4.15 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 1.41 (s, 9H)。 |
| 17-067 | δ 8.65-8.7 (m, 2H), 7.99 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.74 (td, J=7.5, 1.8Hz, 1H), 7.55-7.6 (m, 1H), 7.33 (ddd, J=7.5, 5.1, 1.2Hz, 1H), 5.09 (bs, 1H), 4.09 (td, J=13.8, 6.9Hz, 2H), 1.40 (s, 9H)。 |
| 17-071 | δ 8.59 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.80 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.52 (td, J=7.2, 1.8Hz, 1H), 7.35-7.4 (m, 1H), 7.1-7.15 (m, 2H), 4.90 (bs, 1H), 3.65-3.7 (m, 1H), 3.5-3.55 (m, 2H), 1.42 (s, 9H), 1.24 (d, J=6.6Hz, 3H)。 |
| 17-077 | δ 8.56 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.78 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.3-7.4 (m, 2H), 7.2-7.25 (m, 1H), 7.05-7.1 (m, 1H), 5.15 (bs, 1H), 3.55-3.6 (m, 2H), 3.05-3.15 (m, 2H), 1.43 (s, 9H)。 |
| 17-095 | δ 8.53 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.87 (d, J=1.8Hz, 1H), 6.86 (s, 1H), 5.10 (t, J=6.3Hz, 1H), 4.08 (td, J=13.5, 6.3Hz, 2H), 2.52 (s, 3H), 1.41 (s, 9H)。 |
| 17-098 | δ 8.57 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.79 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.4-7.5 (m, 1H), 7.15-7.2 (m, 2H), 4.95-5.0 (m, 1H), 4.15-4.25 (m, 1H), 3.05-3.1 (m, 2H), 1.38 (s, 9H), 1.22 (d, J=6.9Hz, 3H)。 |
| 17-120 | δ 8.56 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.90 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.34 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.24 (d, J=8.1Hz, 1H), 5.11 (t, J=6.9Hz, 1H), 4.09 (td, J=13.5, 6.9Hz, 2H), 2.9-3.0 (m, 4H), 2.0-2.15 (m, 2H), 1.41 (s, 9H)。 |
| 17-145 | δ 8.60 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.89 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.45-7.5 (m, 2H), 7.35-7.4 (m, 2H), 4.79 (d, J=10.5Hz, 1H), 4.5-4.6 (m, 1H), |

[0484]

[表21-8]

1.85-1.95 (m, 1H), 1.5-1.65 (m, 1H), 1.32 (s, 9H),
1.04 (t, J=7.8Hz, 3H)。

[0485] [試験例]

次に、本発明化合物の有害生物防除剤としての有用性について、以下の試験例により具体的に説明するが、本発明はこれらのみ限定されるものではない。

試験薬液Aの調製；本発明化合物を乳化白試料（ソルポール（登録商標）3005XL（東邦化学工業社製）：N-メチルピロリドン：ソルベツソ（登録商標）200（エクソンモービル製）＝1：5：2混合物）中に溶解し、20重量％濃度の乳剤を調製した。この薬液を所定の濃度に希釈し、以下の試験例1～8にて供試した。

試験薬液Bの調製；本発明化合物をジメチルスルホキシド中に溶解し、1重量％濃度の溶液を調製した。この薬液を所定の濃度に希釈し、以下の試験例9～試験例13及び比較試験にて供試した。

[0486] 試験例1 キュウリうどんこ病予防効果試験

90cm³のプラスチックポットにキュウリ（品種：相模半白）を植え、子葉期に本発明化合物の試験薬液Aを、蒸留水を加えて500ppm濃度に希釈し、ポット当たり5ml散布処理した。風乾後、キュウリを空調温室（20℃）に置き、キュウリうどんこ病菌（*Erysiphe polygoni*、Synonym；*Erysiphe betae*）の分生孢子懸濁液を噴霧接種した。同温度にて9日間置いた後、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

[0487] 防除価＝〔1－（処理区病斑面積率／無処理区病斑面積率）〕×100

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が70％以上の防除価を示した。

本発明化合物：No. 1-002, 1-005～1-007, 1-011, 1-012, 1-016, 1-019, 1-022, 1-023, 1-031, 1-038, 1-042, 1-044～1-046, 1-048～1-052, 1-059～1-063, 1-066～1-

068, 1-069*, 1-070, 1-073, 1-074, 1-086, 1-090, 1-091, 1-104, 1-105, 1-108, 1-109, 1-114, 1-116, 1-121, 1-124, 1-142, 1-144, 1-147, 1-148, 2-002, 2-008, 2-011, 2-016, 2-018, 2-054~2-056, 2-058, 2-059, 2-067, 2-084, 2-086, 3-002*, 3-010, 3-012, 3-014, 3-025, 3-036, 3-037, 3-043, 3-051, 3-053, 3-059, 3-062~3-067, 3-084, 3-085, 3-088, 3-089, 3-095, 3-104, 3-128, 3-135, 3-142, 3-146~3-148, 3-150, 3-156, 4-008, 4-009, 7-004, 7-005*, 7-006*, 7-007, 7-009, 7-010, 7-012, 7-013, 7-019, 7-021, 8-001*, 8-002, 8-004, 8-005, 9-002~9-006, 9-008~9-011, 9-014, 9-018, 9-019, 11-001, 12-001, 15-001。

尚、上記*印は100ppm濃度の薬液を用いて試験を実施したことを表す。

[0488] 試験例2 キュウリ灰色かび病予防効果試験（孢子接種）

90cm³のプラスチックポットにキュウリ（品種：相模半白）を植え、子葉期に本発明化合物の試験薬液Aを、蒸留水を加えて500ppm濃度に希釈し、ポット当たり5ml散布処理した。風乾後、処理葉を切り取り、プラスチック容器に入れた。キュウリ灰色かび病菌（*Botrytis cinerea*）の分生孢子懸濁液と溶解させたPDA培地を1：1の割合で混合し、上記の処理葉に30μlずつ滴下接種した。接種後、20℃、多湿下に3日間置いた後、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が70%以上の防除価を示した。

本発明化合物：No. 1-002~1-004, 1-006, 1-007, 1-009, 1-011, 1-012, 1-015, 1-016, 1-019, 1-023, 1-027~1-031, 1-033, 1-034, 1-036~1-038, 1-042, 1-045~1-052, 1-054~1-057, 1-061~1-063, 1-066~1-068, 1-069*, 1-070, 1-071, 1-073~1-075, 1-083, 1-086~1-088, 1-090, 1-091, 1-093, 1-094, 1-097, 1-104~1-106, 1-108~1-113, 1-115~1-117, 1-119~1-121, 1-123~1-125, 1-128, 1-136, 1-137, 1-140, 1-142~1-144, 1-146~1-149, 2-002, 2-007, 2-008, 2-010, 2-011, 2-016~2-020, 2-031~2-033, 2-044, 2-045, 2-055~2-067, 2-069~2-072, 2-081~2-088,

3-002*, 3-003, 3-004, 3-007, 3-009~3-012, 3-014, 3-015, 3-018, 3-021, 3-023, 3-025, 3-026, 3-029~3-033, 3-035~3-045, 3-047, 3-049, 3-050, 3-053~3-055, 3-058, 3-059, 3-062~3-068, 3-070, 3-071, 3-074, 3-076, 3-078, 3-084, 3-085, 3-088~3-096, 3-098~3-107, 3-109~3-111, 3-117, 3-118, 3-121~3-124, 3-126, 3-128~3-142, 3-144~3-153, 3-155~3-157, 3-164~3-167, 3-170~3-172, 3-174~3-181, 3-188, 4-002~4-009, 6-001, 7-001, 7-004, 7-006*, 7-007, 7-010, 7-012, 7-013, 7-018, 7-019, 7-021, 7-022, 8-001*, 8-002, 8-003*, 8-004, 8-005, 9-001*, 9-002~9-020, 12-004, 14-038。

尚、上記*印は100ppm濃度の薬液を用いて試験を実施したことを表す。

[0489] 試験例3 キュウリ灰色かび病予防効果試験（菌糸接種）

90cm³のプラスチックポットにキュウリ（品種：相模半白）を植え、子葉期に本発明化合物の試験薬液Aを、蒸留水を加えて500ppm濃度に希釈し、ポット当たり5ml散布処理した。1日後、ポットをプラスチックコンテナに入れ、予めPDA培地で培養したキュウリ灰色かび病菌（*Botrytis cinerea*）の含菌寒天片（直径5mm）を薬剤処理したキュウリの子葉に接種した。接種後、プラスチックコンテナをビニールで覆って加湿し、20℃にて2日間置いた。その後、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が70%以上の防除価を示した。

本発明化合物：No. 1-002, 1-003, 1-006, 1-007, 1-009, 1-012, 1-015, 1-016, 1-017*, 1-019, 1-038, 1-042, 1-044~1-046, 1-049~1-052, 1-062, 1-063, 1-067, 1-068, 1-070, 1-071, 1-073, 1-074, 1-076, 1-081, 1-089, 1-090, 1-091, 1-094, 1-097, 1-105, 1-106, 1-108, 1-109, 1-116, 1-117, 1-124, 1-128, 1-143, 1-144, 1-147, 1-148, 2-002, 2-007, 2-016, 2-018~2-020, 2-056~2-059, 2-062, 2-065~2-067, 2-081, 2-082, 2-084, 2-086~2-088, 3-003, 3-004, 3-006, 3-007, 3-010~3-012, 3-014

, 3-025, 3-026, 3-030, 3-031, 3-035~3-038, 3-040~3-044, 3-053, 3-054, 3-058, 3-059, 3-062~3-067, 3-070, 3-074, 3-084, 3-085, 3-088, 3-089, 3-091, 3-093~3-095, 3-102~3-104, 3-106, 3-117, 3-118, 3-121, 3-130, 3-134, 3-135, 3-140~3-142, 3-146, 3-147, 3-150, 3-156, 3-167, 3-172, 3-175, 3-179, 3-181, 4-003~4-009, 6-001, 7-004, 7-006*, 7-010, 7-012, 7-015, 7-021, 7-022, 8-001*, 8-002, 8-003*, 8-004, 8-005, 9-001*, 9-002~9-007, 9-009~9-011, 9-014, 9-016, 9-018~9-020, 12-001。

尚、上記*印は100ppm濃度の薬液を用いて試験を実施したことを表す。

[0490] 試験例4 キュウリ菌核病予防効果試験

90cm³のプラスチックポットにキュウリ（品種：相模半白）を植え、子葉期に本発明化合物の試験薬液Aを、蒸留水を加えて500ppm濃度に希釈し、ポット当たり5ml散布処理した。風乾後、ポットをプラスチックコンテナに入れ、予めPDA培地で培養したキュウリ菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）の含菌寒天片（直径5mm）を薬剤処理したキュウリの子葉に接種した。接種後、プラスチックコンテナをビニールで覆い加湿し、20℃にて2日間置いた後、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が70%以上の防除価を示した。

本発明化合物：No. 1-001~1-007, 1-009~1-012, 1-015, 1-016, 1-017*, 1-019, 1-021~1-023, 1-025~1-031, 1-033, 1-034, 1-036~1-038, 1-042~1-057, 1-059~1-063, 1-066~1-068, 1-069*, 1-070~1-083, 1-086~1-095, 1-097, 1-099, 1-102~1-106, 1-108~1-126, 1-128, 1-131, 1-133~1-137, 1-139, 1-140, 1-142~1-150, 1-152, 1-153, 2-002, 2-007~2-012, 2-014, 2-016~2-020, 2-022, 2-025, 2-027, 2-028, 2-031~2-033, 2-035, 2-037, 2-038, 2-040, 2-042~2-048, 2-050, 2-054~2-067, 2-069~2-072, 2-075~2-077, 2-081~2-088, 2-090~2-092, 3-001, 3-

002*, 3-003, 3-004, 3-006, 3-007, 3-009~3-012, 3-014, 3-015, 3-018~3-033, 3-035~3-050, 3-052~3-056, 3-058, 3-059, 3-061~3-072, 3-074~3-076, 3-078, 3-079, 3-084~3-086, 3-088~3-096, 3-098~3-107, 3-109~3-113, 3-116~3-119, 3-121~3-158, 3-160, 3-161, 3-164~3-167, 3-170~3-181, 3-184~3-186, 3-188, 4-001*, 4-002~4-009, 5-001, 6-001~6-003, 7-001, 7-003, 7-004, 7-006*, 7-007, 7-009~7-016, 7-018, 7-019, 7-021, 7-022, 8-001*, 8-002, 8-003*, 8-004, 8-005, 9-001*, 9-002~9-020, 12-001, 12-002, 12-004~12-007, 13-001, 14-002, 14-007, 14-009, 14-012, 14-032, 14-037, 14-038, 14-041, 15-001。

尚、上記*印は100ppm濃度の薬液を用いて試験を実施したことを表す。

[0491] 試験例5 キュウリ炭疽病予防効果試験

90cm³のプラスチックポットにキュウリ（品種：相模半白）を植え、子葉期に本発明化合物の試験薬液Aを、蒸留水を加えて500ppm濃度に希釈し、ポット当たり5ml散布処理した。1日後、キュウリ炭疽病菌（*Colletotrichum lagenarium*, Synonym; *Colletotrichum orbiculare*）の分生孢子懸濁液を噴霧接種し、温度25℃、湿度100%RHの接種箱内に2日間置いた。その後、空調温室（23℃）に置き、同温度にて7日間置いた。その後、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が70%以上の防除価を示した。

本発明化合物：No. 1-054, 1-066, 1-067, 1-070, 1-084, 1-090~1-092, 1-109, 1-113, 1-115, 1-129, 1-138, 1-139, 1-145, 2-006, 2-007, 2-011, 2-032, 2-058, 2-059, 2-072, 2-073, 2-080, 3-002*, 3-024, 3-030, 3-048, 3-053, 3-059, 3-065, 3-081, 3-083, 3-095, 3-117, 3-130, 3-134, 3-135, 3-138~3-140, 3-142, 3-143, 3-170, 3-172, 3-174, 4-002, 4-004, 4-006, 4-007, 7-013, 7-018, 8-004, 8-005, 9-005, 9-009, 9-014, 9-018, 12-006, 13-003, 14-007, 14-011, 14-027, 15-007。

尚、上記*印は100ppm濃度の薬液を用いて試験を実施したことを表す。

。

[0492] 試験例 6 コムギうどんこ病予防効果試験

1. 3葉期のコムギ（品種：農林61号）を植えた90cm³のプラスチックポットに、本発明化合物の試験薬液Aを、蒸留水を加えて500ppm濃度に希釈し、ポット当たり5ml散布処理した。散布1日後、空調温室（20℃）にポットを置き、コムギうどんこ病菌（*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*）の分生胞子をコムギに接種した。その後7日間保持し、形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が70%以上の防除価を示した。

本発明化合物：No. 1-001, 1-002, 1-004~1-007, 1-009, 1-011, 1-013, 1-015, 1-016, 1-017*, 1-019, 1-021~1-023, 1-025, 1-027, 1-028, 1-030, 1-031, 1-034, 1-036~1-039, 1-042, 1-044~1-054, 1-056~1-063, 1-066~1-068, 1-069*, 1-070~1-074, 1-076, 1-079~1-081, 1-086, 1-087, 1-089, 1-091, 1-093~1-097, 1-099, 1-104~1-106, 1-108~1-112, 1-114~1-117, 1-119~1-125, 1-131, 1-135~1-137, 1-140, 1-143~1-149, 2-002, 2-003, 2-005, 2-007~2-011, 2-015~2-020, 2-031, 2-032, 2-042, 2-044, 2-045, 2-054~2-063, 2-065~2-067, 2-069~2-071, 2-082, 2-084~2-088, 3-002*, 3-003, 3-004, 3-006, 3-007, 3-010~3-012, 3-014, 3-020, 3-025, 3-026, 3-028, 3-030, 3-031, 3-035~3-043, 3-045, 3-049, 3-050, 3-052~3-055, 3-058, 3-059, 3-062~3-068, 3-070, 3-074, 3-075, 3-078, 3-084, 3-085, 3-088, 3-089, 3-091~3-095, 3-104, 3-106, 3-107, 3-109, 3-117, 3-126, 3-128, 3-130~3-133, 3-135~3-138, 3-140~3-143, 3-146~3-148, 3-150, 3-151, 3-153, 3-156, 3-157, 3-167, 3-169, 3-172, 3-177~3-181, 4-001*, 4-002~4-004, 4-006~4-009, 6-002, 7-001, 7-004, 7-006*, 7-007, 7-009, 7-010, 7-012~7-015, 7-018, 7-019, 7-021, 7-022, 8-002, 8-003*, 8-004, 8-005, 9-002~9-006, 9-008~9-012, 9-014~9-020, 12-001, 12-002, 14-009, 14-013, 14-014, 14-023, 14-032, 15-001, 15-007。

尚、上記*印は100ppm濃度の薬液を用いて試験を実施したことを表す。

[0493] 試験例7 コムギふ枯病予防効果試験

1.3葉期のコムギ（品種：ハルユタカ）を植えた90cm³のプラスチックポットに、本発明化合物の試験薬液Aを、蒸留水を加えて500ppm濃度に希釈し、ポット当たり5ml散布処理した。散布1日後、コムギふ枯病菌（*Phaeosphaeria nodorum*, Synonym; *Septoria nodorum*）の分生孢子懸濁液をコムギに噴霧接種し、温度20℃、湿度100%RHの接種箱内に2日間入れた。その後、空調温室（20℃）に置き、6日間保持した。形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が70%以上の防除価を示した。

本発明化合物：No. 1-002, 1-004, 1-006, 1-007, 1-009, 1-010, 1-012, 1-015, 1-017*, 1-031, 1-042, 1-045, 1-049~1-052, 1-057, 1-060, 1-062, 1-063, 1-066, 1-073, 1-074, 1-087, 1-124, 1-144, 1-146, 1-148, 1-149, 2-002, 2-007, 2-015, 2-016, 2-018, 2-020, 2-056, 2-085, 3-002*, 3-006, 3-010~3-012, 3-014, 3-025, 3-026, 3-036, 3-040~3-044, 3-051, 3-053, 3-054, 3-059, 3-062, 3-070, 3-084, 3-085, 3-088, 3-089, 3-095, 3-135, 3-138, 3-156, 3-170, 3-181, 7-001, 7-006*, 7-010, 7-012, 7-013, 8-003*, 8-004, 8-005, 9-001*, 9-002~9-006, 9-008~9-010, 9-014, 9-018, 9-020, 14-003, 14-009, 15-001。

尚、上記*印は100ppm濃度の薬液を用いて試験を実施したことを表す。

[0494] 試験例8 コムギ赤さび病予防効果試験

1.3葉期のコムギ（品種：農林61号）を植えた90cm³のプラスチックポットに、本発明化合物の試験薬液Aを、蒸留水を加えて500ppm濃度に希釈し、ポット当たり5ml散布処理した。散布1日後、コムギ赤さび病菌（*Puccinia recondita*）の孢子懸濁液をコムギに噴霧接種し、温度20

℃、湿度100%RHの接種箱内に1日間入れた。その後、空調温室（20℃）に置き、8日間保持した。形成された病斑の接種葉に占める割合を測定し、試験例1と同様の計算式から防除価を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が70%以上の防除価を示した。

本発明化合物：No. 3-053, 3-059, 3-083, 3-172, 4-004, 8-005, 9-003, 9-004, 9-009, 9-014, 9-016, 9-018, 9-020。

[0495] 試験例9 黒かび病菌に対する抗菌活性試験

96ウェルプレートにポテト・デキストロース 1%寒天培地を60μlずつ分注した後、黒かび病菌(*Aspergillus niger*)の孢子を含む滅菌水（孢子10個/3μl）を、各ウェル当たり30μlずつ加えた。この上から、本発明化合物の試験薬液Bを、蒸留水を加えて100ppm濃度に希釈し、各ウェル当たり10μlずつ添加し、暗黒条件下、25℃にて静置した。薬剤添加2日後の菌叢面積率（%）を判定し、無処理区に対するefficacy（%）を下式により算出した。

$$\text{efficacy (\%)} = [1 - (\text{処理区菌叢面積率} / \text{無処理区菌叢面積率})] \times 100$$

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が50%以上のefficacy（%）を示した。

[0496] 本発明化合物：No. 1-002, 1-003, 1-006, 1-007, 1-009, 1-011~1-017, 1-019, 1-020, 1-022, 1-023, 1-025~1-028, 1-031, 1-033~1-035, 1-037~1-039, 1-042, 1-045~1-063, 1-065~1-071, 1-073, 1-074, 1-076, 1-079~1-081, 1-083, 1-086~1-098, 1-100, 1-104~1-109, 1-112~1-125, 1-127, 1-128, 1-132, 1-134, 1-136, 1-137, 1-141~1-149, 2-001, 2-002, 2-005, 2-007~2-012, 2-014~2-023, 2-025, 2-027~2-029, 2-031, 2-032, 2-034, 2-038, 2-040, 2-044, 2-045, 2-047, 2-049~2-051, 2-053~2-070, 2-078, 2-081~2-088, 2-092, 3-001~3-004, 3-006, 3-007, 3-009~3-018, 3-021~3-023, 3-026~3-033, 3-035~3-045, 3-047~3-071, 3-073~3-

-078, 3-081~3-107, 3-109~3-113, 3-115~3-118, 3-121, 3-123, 3-125~3-131, 3-133~3-157, 3-167, 3-172~3-181, 3-185, 4-001~4-009, 5-001, 6-001, 6-002, 7-002~7-004, 7-006, 7-007, 7-010, 7-012, 7-013, 7-017~7-022, 8-001~8-005, 9-001, 9-003~9-013, 9-015~9-020, 12-001, 12-004, 12-005, 13-001, 13-002, 14-002, 14-009, 14-048, 14-049。

[0497] 試験例10 サツマイモネコブセンチュウに対する殺虫試験

96ウェルプレートにポテト・デキストロース 1%寒天培地を60 μ lずつ分注した後、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) の卵を含む滅菌水 (卵10個/3 μ l) を、各ウェル当たり30 μ lずつ加えた。この上から、本発明化合物の試験薬液Bを、蒸留水を加えて100ppm濃度に希釈し、各ウェル当たり10 μ lずつ添加し、暗黒条件下、25 $^{\circ}$ Cにて静置した。薬剤添加4日後の未孵化卵数及び不活動幼虫数を計測し、無処理区に対するefficacy (%) を下式により算出した。

efficacy (%) = [(処理区未孵化卵数 + 不活動幼虫数) / 無処理区活動幼虫数] \times 100

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が50%以上のefficacy (%) を示した。

[0498] 本発明化合物 : No. 1-002~1-004, 1-006, 1-007, 1-009, 1-011, 1-013~1-023, 1-025~1-031, 1-034~1-039, 1-042, 1-044~1-056, 1-058~1-063, 1-065, 1-066, 1-068~1-076, 1-080, 1-086, 1-087, 1-089~1-092, 1-094~1-100, 1-103~1-112, 1-114~1-119, 1-121~1-126, 1-128, 1-132, 1-134~1-138, 1-140~1-149, 1-152~1-155, 1-159, 2-001~2-003, 2-005, 2-007~2-011, 2-013, 2-014, 2-016~2-019, 2-021, 2-022, 2-025, 2-027~2-032, 2-041~2-045, 2-047, 2-050, 2-051, 2-054, 2-055, 2-057~2-060, 2-062~2-071, 2-076, 2-077, 2-082~2-088, 2-090, 2-092, 3-001~3-004, 3-006, 3-007, 3-009~3-015, 3-018, 3-020~3-026, 3-028, 3-029, 3-031~3-033, 3-035~3-048, 3-050~3-059, 3-061, 3-062, 3-064~3-071, 3-073~3-078, 3-084, 3-086~3-089, 3-091~3-096, 3-098~3-102, 3-104~3-107, 3-109~3-114, 3-116~3-119, 3-122, 3-124~3-131, 3-134~3-150, 3-153~3-158,

3-164~3-167, 3-170, 3-172~3-181, 3-185, 3-186, 3-190, 4-004, 4-007, 4-009, 4-013, 5-001, 6-001, 7-001~7-010, 7-012, 7-013, 7-017, 7-018, 7-020~7-022, 8-001~8-004, 9-003, 14-001~14-003, 14-007~14-014, 14-016~14-025, 14-028, 14-030, 14-032~14-042, 14-046, 14-048, 14-049。

[0499] 試験例 1 1 サツマイモネコブセンチュウに対する防除効果試験

1セルあたり10gの土壌を充填したセルトレイ植えのハウセンカ苗（発芽後約2週間）の株元に、本発明化合物の試験薬液Bを、蒸留水を加えて100ppm濃度に希釈し、1株当たり1mlずつ処理した。処理1時間後にサツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) の2L幼虫を含む水（2L幼虫100頭/1ml）を、各セル当たり1ml、株元に接種した。その後、温室内で3週間保持し、根部に形成された根こぶの着生程度を下記の発病指数及び発病度に従って判定し、無処理区に対するefficacy (%) を下式により算出した。

〈発病指数〉 0 : こぶが認められない。 1 : 根系一部にこぶが認められる。

2 : 根系の全体にこぶが認められる。 3 : 大きなこぶが認められる。

4 : 根系全体に大きなこぶが認められる。

〔発病度〕 = $[\sum (\text{発病指数} \times \text{指数別発病株数}) / (4 \times \text{調査株数})] \times 100$

efficacy (%) = $[1 - (\text{処理区発病度} / \text{無処理区発病度})] \times 100$

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が50%以上のefficacy (%) を示した。

[0500] 本発明化合物 : No. 1-002~1-004, 1-006, 1-007, 1-009, 1-013~1-017, 1-019~1-023, 1-025, 1-027, 1-028, 1-031, 1-034~1-036, 1-038, 1-044~1-047, 1-049~1-052, 1-056, 1-058, 1-060, 1-062, 1-095, 1-096, 1-098~1-103, 1-114~1-118, 1-125, 2-001, 2-002, 2-021~2-024, 2-027, 2-028, 2-031, 2-032, 2-034, 2-037, 2-039, 2-041, 2-055, 2-059~2-064, 3-002~3-004, 3-006, 3-007, 3-009~3-014, 3-01

6, 3-017, 3-020, 3-021, 3-024~3-029, 3-031, 3-036~3-039, 3-041~3-043, 3-048, 3-050~3-052, 3-054, 3-061, 3-071, 3-096, 3-098~3-100, 3-104~3-106, 3-108, 3-110, 3-111, 3-114, 3-116~3-118, 3-120~3-122, 3-124, 3-125, 3-139~3-148, 4-001, 4-003, 4-007, 4-009, 6-001, 7-001~7-004, 7-006, 7-008, 7-010, 7-012, 7-018~7-020, 7-022, 8-001~8-005, 9-003, 12-002, 14-002, 14-003, 14-005, 14-007, 14-008~14-014, 14-016~14-020, 14-022, 14-024, 14-030, 14-032, 14-035~14-039, 14-046。

[0501] 試験例 1 2 捻転胃虫に対する殺虫試験

96 ウェルプレートにポテト・デキストロース 1%寒天培地を60 μ lずつ分注した後、捻転胃虫(*Haemonchus contortus*)の卵を含む滅菌水(卵10個/3 μ l)を、各ウェル当たり30 μ lずつ加えた。この上から、本発明化合物の試験薬液Bを、蒸留水を加えて100 ppm濃度に希釈し、各ウェル当たり10 μ lずつ添加し、暗黒条件下、25℃にて静置した。薬剤添加4日後の未孵化卵数および不活動幼虫数を計測し、試験例10と同様の計算式から無処理区に対するefficacy (%)を算出した。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が50%以上のefficacy (%)を示した。

[0502] 本発明化合物 : No. 1-001~1-010, 1-012~1-015, 1-015(+), 1-015(-), 1-016~1-081, 1-083~1-134, 1-136~1-150, 1-152~1-155, 1-157~1-159, 2-001~2-066, 2-068~2-072, 2-074~2-081, 2-083~2-095, 3-001~3-027, 3-029~3-079, 3-083~3-159, 3-161~3-165, 3-167~3-182, 3-184~3-186, 3-188~3-190, 4-001, 4-002, 4-004~4-009, 4-011, 4-013, 5-001, 6-001, 7-001~7-022, 8-001~8-005, 9-001~9-003, 9-005~9-016, 9-018~9-020, 11-001, 12-003~12-005, 14-001~14-028, 14-030~14-053, 15-001~15-010。

[0503] 試験例 1 3 ダイズシストセンチュウに対する殺虫試験

96 ウェルプレートに1%寒天培地を60 μ lずつ分注した後、ダイズシストセンチュウ(*Heterodera glycines*)の卵を含む滅菌水(卵10個/3 μ l)を、各ウェル当たり30 μ lずつ加えた。この上から、本発明化合物の試験薬液

Bを、蒸留水を加えて100 ppm濃度に希釈し、各ウェル当たり10 μlずつ添加し、暗黒条件下、25℃にて静置した。薬剤添加4日後の未孵化卵数および不活動幼虫数を計測し、試験例10と同様の計算式から無処理区に対するefficacy (%)を算出した。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が50%以上のefficacy (%)を示した。

[0504] 本発明化合物：No. 1-002, 1-053, 1-069~1-072, 1-074, 1-091, 1-092, 1-094~1-112, 1-114~1-116, 1-118, 1-119, 1-121, 1-123~1-125, 1-127, 1-128, 1-132, 1-134~1-137, 1-140~1-147, 1-149, 1-150, 1-152~1-155, 1-159, 2-010, 2-011, 2-016, 2-021~2-023, 2-025, 2-027~2-035, 2-037, 2-039, 2-040, 2-042~2-050, 2-054~2-071, 2-076, 2-078, 2-081~2-088, 2-090~2-092, 3-002, 3-044, 3-066~3-068, 3-070, 3-071, 3-076, 3-077, 3-087, 3-088, 3-095, 3-096, 3-098, 3-100~3-102, 3-104~3-107, 3-110~3-114, 3-116~3-122, 3-124, 3-126, 3-128~3-131, 3-133~3-158, 3-161, 3-164, 3-167, 3-172~3-181, 3-185, 3-186, 3-189, 4-007~4-009, 4-011, 4-013, 7-018~7-021, 8-004, 8-005, 9-011, 9-020, 14-002, 14-040, 15-013。

[0505] 試験例14 捻転胃虫に対する殺虫試験（比較試験）

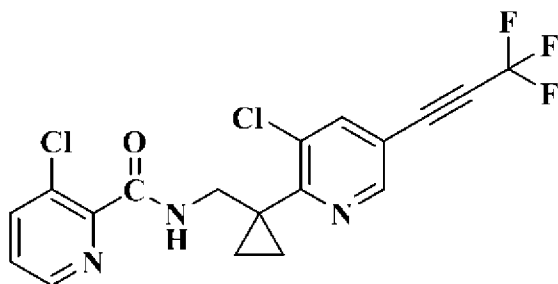
96ウェルプレートにポテト・デキストロース 1%寒天培地を60 μlずつ分注した後、捻転胃虫(*Haemonchus contortus*)の卵を含む滅菌水（卵10個/3 μl）を、各ウェル当たり30 μlずつ加えた。この上から、本発明化合物及び比較化合物の試験薬液Bを、蒸留水を加えて各々の所定濃度に希釈し、各ウェル当たり10 μlずつ添加し、暗黒条件下、25℃にて静置した。薬剤添加4日後の未孵化卵数および不活動幼虫数を計測し、試験例10と同様の計算式から無処理区に対するefficacy (%)を算出した。

[0506] 各供試化合物の各所定濃度におけるefficacy (%)を第22表及び第23表に示す。

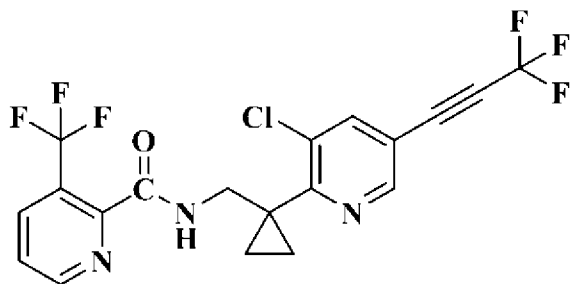
第22表

| 供試化合物 | 濃度 (ppm) | | | | |
|------------------|----------|-----|-----|-----|------|
| | 10 | 3 | 0.3 | 0.1 | 0.03 |
| 本発明化合物 No. 2-052 | 100 | 100 | 70 | 0 | 0 |
| 比較化合物 A | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 本発明化合物 No. 2-054 | 100 | 100 | 90 | 80 | 0 |
| 比較化合物 B | 100 | 0 | 0 | 0 | 0 |

比較化合物 A : 国際公開第 2014-173921 号明細書、化合物 X.8
[化41]



比較化合物 B : 国際公開第 2014-173921 号明細書、化合物 X.7
[化42]



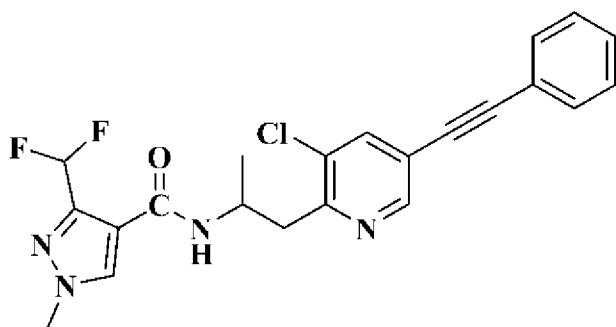
[0507] 第 2 3 表

| 供試化合物 | 濃度 (ppm) | | | | | |
|------------------|----------|----|-----|-----|-----|-----|
| | 10 | 5 | 2.5 | 1.3 | 0.6 | 0.3 |
| 本発明化合物 No. 9-005 | 100 | 90 | 100 | 100 | 100 | 0 |

| | | | | | | |
|------------------|-----|----|-----|-----|----|---|
| 本発明化合物 No. 9-006 | 100 | 90 | 100 | 100 | 90 | 0 |
| 比較化合物 C | 100 | 80 | 0 | 0 | 0 | 0 |

比較化合物 C : 国際公開第 2015-125824 号明細書、化合物 8-027

[化43]



産業上の利用可能性

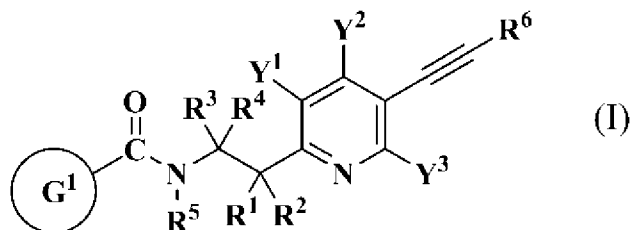
[0508] 本発明に係るアルキニルピリジン置換アミド化合物は、優れた有害生物防除活性、特に殺菌・殺線虫活性を示し、且つ、ホ乳動物、魚類及び有用昆虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物である。

なお、2016年6月29日に出願された日本特許出願2016-129158号、2016年10月6日に出願された日本特許出願2016-197920号、2017年1月17日に出願された日本特許出願2017-006154号、及び2017年4月21日に出願された日本特許出願2017-084394号の明細書、特許請求の範囲、及び要約書の全内容をここに引用し、本発明の明細書の開示として、取り入れるものである。

請求の範囲

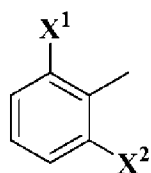
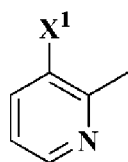
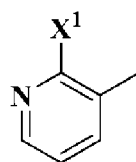
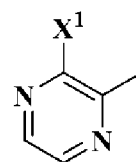
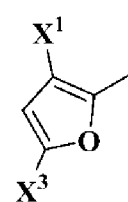
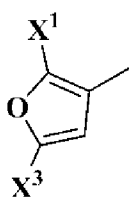
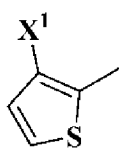
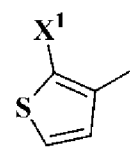
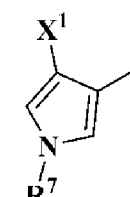
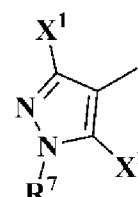
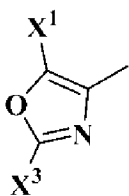
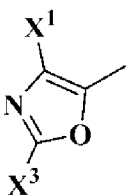
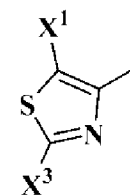
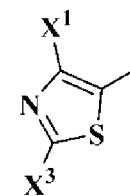
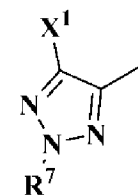
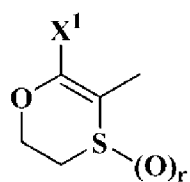
[請求項1] 式 (I) で表されるアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[化1]



[式中、G¹は、G¹-1~G¹-16で表される構造を表し、

[化2]

G¹-1G¹-2G¹-3G¹-4G¹-5G¹-6G¹-7G¹-8G¹-9G¹-10G¹-11G¹-12G¹-13G¹-14G¹-15G¹-16

X¹は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₄アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃ハロアルコキシ、C₁~C₃アルキルチオ、C₁~C₃アルキルスルフィニル、C₁~C₃アルキルスルホニル、C₁~C₃ハロアルキルチオ又はC₁~C₃ハロアルキルスルホニルを表し、

X²は、水素原子又はハロゲン原子を表し、ただし、G¹がG¹⁻¹⁰で表される構造であり、且つX¹がジハロメチルを表す場合には、X²は水素原子を表し、

X³は、水素原子又はC₁~C₄アルキルを表し、

Y¹は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ、C₁~C₄アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃ハロアルコキシ又はC₁~C₃アルキルチオを表し、

Y²及びY³は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子又はメチルを表し、

R¹は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、フェニル(C₁~C₄)アルキル、(Z)_mによって置換されたフェニル(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₃~C₆アルケニルオキシ、C₃~C₆ハロアルケニルオキシ、C₃~C₆アルキニルオキシ、C₃~C₆ハロアルキニルオキシ、シアノ(C₁~C₄)アルコキシ、フェニル(C₁~C₄)アルコキシ、(Z)_mによって置換されたフェニル(C₁~C₄)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルコキシアミノ、-C(O)NH₂又は-C(S)NH₂を表し、

R²は、水素原子、ハロゲン原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

ここで、R¹とR²とは一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、R¹及びR²が結合する炭素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このとき前記アルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒

素原子を1～2個含んでもよく、且つC₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、オキソ又はチオキソによって任意に置換されていてもよいことを表すか、R¹とR²とが一緒になってC₁～C₆アルキリデン、C₁～C₆ハロアルキリデン又はC₁～C₄アルコキシ(C₁～C₂)アルキリデンを形成することを表し、

R³は、水素原子、C₁～C₆アルキル又はC₁～C₆ハロアルキルを表し、

、

R⁴は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、

ここで、R³とR⁴とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R³及びR⁴が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成してもよく、

R⁵は、水素原子、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、R⁸によって置換された(C₁～C₂)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₂～C₄アルケニル、C₃～C₄アルキニル、-OH、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄ハロアルキルチオ、-C(O)R⁹又はC₁～C₄アルコキシカルボニルを表し、

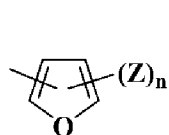
R⁶は、C₃～C₆シクロアルキル(C₃～C₆)シクロアルキル、フェニル(C₃～C₆)シクロアルキル、(Z)_mによって置換されたフェニル又はD-1～D-29を表し、

R¹がフッ素原子、C₁～C₆アルキル又はC₁～C₆アルコキシを表し、R²がフッ素原子又はC₁～C₆アルキルを表し、R³がC₁～C₆アルキル又はC₁～C₆ハロアルキルを表し、且つR⁴が水素原子又はC₁～C₆アルキルを表す場合には、R⁶は水素原子、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、R¹⁰によって任意に置換された(C₁～C₄)アルキル、C₃～C₁₀シクロアルキル、C₃～C₁₀ハロシクロアルキル、ヒドロキシ(C₃～C₆)シクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ(C₃～C₆)シクロアルキル、C₄～C₁₀シクロアルケニル、C₄～C₁₀ハロシクロアルケニル、トリ(C₁～C₄アルキル)シリル、フェニルジメチルシリル、-C(R¹¹)

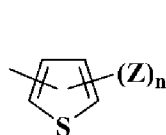
=NOR¹²又はフェニルを表してもよく、

D-1～D-29は、それぞれ下記の構造式で表される芳香族複素環を表し、

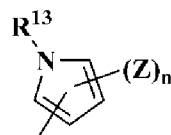
[化3]



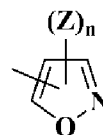
D-1



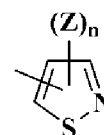
D-2



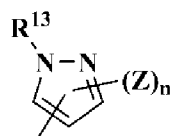
D-3



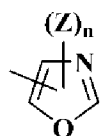
D-4



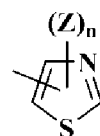
D-5



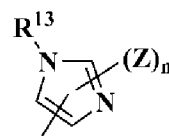
D-6



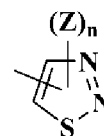
D-7



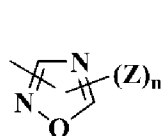
D-8



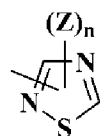
D-9



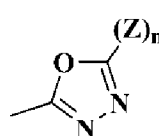
D-10



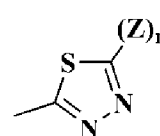
D-11



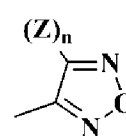
D-12



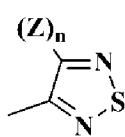
D-13



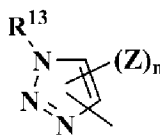
D-14



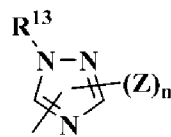
D-15



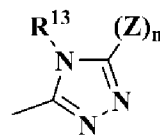
D-16



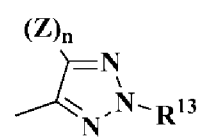
D-17



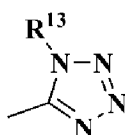
D-18



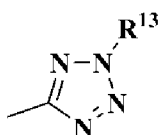
D-19



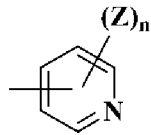
D-20



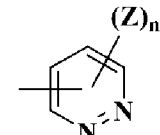
D-21



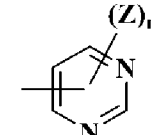
D-22



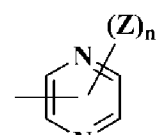
D-23



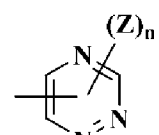
D-24



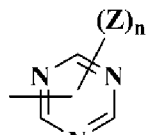
D-25



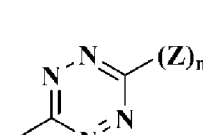
D-26



D-27



D-28

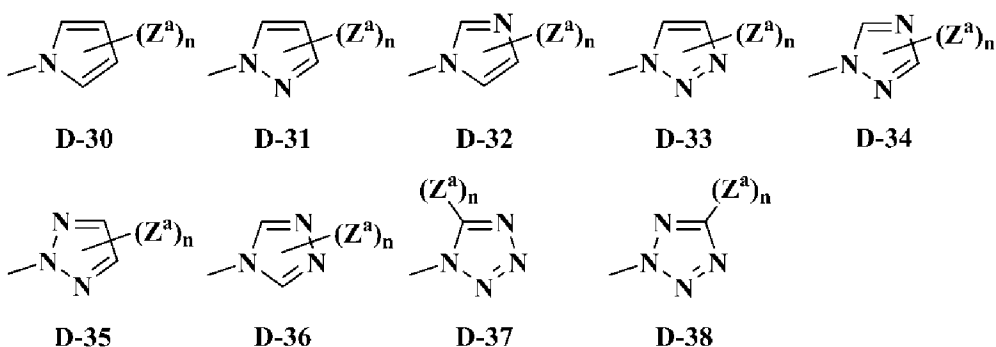


D-29

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、シアノ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルホニル($C_1\sim C_4$)アルキル、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、ジ($C_1\sim C_4$ アルキル)アミノ、フェニル又はD-30~D-38を表し、m又はnが2以上を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S(O)_r-$ 、 $-CH_2S(O)_rCH_2-$ 、 $-SCH_2S-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2S(O)_r-$ 、 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-SCH_2CH_2S-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-SO_2CH=CH-$ 、 $-N(R^{13})CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、 $-N(R^{13})CH=N-$ 、 $-ON=CH-$ 、 $-SN=CH-$ 、 $-SO_2N=CH-$ 、 $-N(R^{13})N=CH-$ 、 $-ON=N-$ 、 $-SN=N-$ 、 $-N(R^{13})N=N-$ 、 $=NOCH=$ 、 $=NSCH=$ 、 $=NN(R^{13})CH=$ 、 $=NON=$ 、 $=NSN=$ 、 $=NN(R^{13})N=$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 、 $-N=CHCH=CH-$ 、 $-CH=NCH=CH-$ 、 $-N=NCH=CH-$ 、 $-N=CHN=CH-$ 、 $-N=CHCH=N-$ 、 $-CH=NN=CH-$ 又は $-N=NCH=N-$ を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、シアノ、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシ又は $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオによって任意に置換されていてもよく、

D-30～D-38は、それぞれ下記の構造式で表される芳香族複素環を表し、

[化4]



Z^a は、ハロゲン原子、シアノ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メトキシ又はトリフルオロメチルスルホニルを表し、 n が2以上を表す場合には、各々の Z^a は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^7 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、

R^8 は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OR^{14}$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)NH_2$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、

R^9 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシメチル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は $C_2 \sim C_4$ アルケニルを表し、

R^{10} は、シアノ、 $-OR^{15}$ 、 $-S(O)_2R^{16}$ 又は $-N(R^{18})R^{17}$ を表し、

R^{11} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{12} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルメチル、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキルメチル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

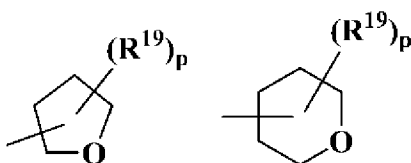
R^{15} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C$

C_4 アルコキシ($C_1\sim C_2$)アルキル、E-1、E-2、 $C_3\sim C_4$ アルケニル、 $C_3\sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_4$ アルキニル、 $C_3\sim C_4$ ハロアルキニル、フェニル又は(Z)_mによって置換されたフェニルを表し、

E-1及びE-2は、それぞれ下記の構造式で表される飽和複素環を表し、

、

[化5]



E-1

E-2

R^{16} は、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ($C_1\sim C_2$)アルキル、 $C_3\sim C_4$ アルケニル、 $C_3\sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_4$ アルキニル、 $C_3\sim C_4$ ハロアルキニル、フェニル又は(Z)_mによって置換されたフェニルを表し、

R^{17} 及び R^{18} は、各々独立して水素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ($C_1\sim C_2$)アルキル、 $C_3\sim C_4$ アルケニル、 $C_3\sim C_4$ アルキニル、フェニル又は(Z)_mによって置換されたフェニルを表すか、

或いは、 R^{17} と R^{18} とが一緒になって $C_2\sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{17} 及び R^{18} が結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このとき前記アルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を1個含んでもよく、且つ $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、オキソ又はチオキソによって任意に置換されていてもよく、

R^{19} は、 $C_1\sim C_4$ アルキルを表し、pが2を表す場合には、各々の R^{19} は互いに同一であっても、または互いに相異なってもよく、

mは、1、2、3、4又は5を表し、

nは、0、1、2、3又は4を表し、

pは、0、1又は2を表し、

rは、0、1又は2を表す。]

[請求項2]

G¹は、G¹-1、G¹-2、G¹-3、G¹-4、G¹-5、G¹-6、G¹-7、G¹-8、G¹-9、G¹-10、G¹-11、G¹-12、G¹-14又はG¹-16で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子、ニトロ、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、メチルチオ、メチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル又はトリフルオロメチルスルホニルを表し、

X²は、水素原子、フッ素原子又は塩素原子を表し、ただし、G¹がG¹-10で表される構造を表し、且つX¹がジフルオロメチルを表す場合には、X²は水素原子を表し、

X³は、メチルを表し、

Y¹は、ハロゲン原子、メチル、トリフルオロメチル又はメトキシを表し、

Y²は、水素原子又はメチルを表し、

Y³は、水素原子を表し、

R¹は、水素原子、フッ素原子、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、ベンジル、(Z)_mによって置換されたフェニルメチル、シクロプロピル、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃ハロアルコキシ、C₃~C₄アルケニルオキシ、C₃~C₄アルキニルオキシ、シアノメトキシ、ベンジルオキシ、(Z)_mによって置換されたフェニルメトキシ、C₁~C₃アルキルチオ又はC₁~C₃ハロアルキルチオを表し、

R²は、水素原子、フッ素原子又はC₁~C₃アルキルを表し、

ここで、R¹とR²とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R¹及びR²が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、R¹とR²とは一緒になってC₁~C₂アルキリデン又はC₁~C₂ハロアルキリデンを形成することを表してもよく、

R³は、水素原子、C₁~C₃アルキル又はC₁~C₃ハロアルキルを表し、

R⁴は、水素原子又はC₁~C₃アルキルを表し、

ここで、R³とR⁴とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R³及びR⁴が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R⁵は、水素原子、C₁~C₄アルキル、R⁸によって置換された(C₁~C₂)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₂~C₄アルケニル、C₃~C₄アルキニル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄ハロアルキルチオ、-C(O)R⁹又はC₁~C₄アルコキシカルボニルを表し、

R⁶は、(Z)_mによって置換されたフェニル、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23、D-24、D-25又はD-26を表し、

さらに、R¹がフッ素原子又はC₁~C₃アルキル表し、R²がフッ素原子又はメチルを表し、R³がメチル又はエチルを表し、且つR⁴が水素原子又はメチルを表す場合には、R⁶は水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、R¹⁰によって任意に置換された(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₃~C₆ハロシクロアルキル、ヒドロキシ(C₃~C₆)シクロアルキル、C₁~C₂アルコキシ(C₃~C₆)シクロアルキル、C₄~C₆シクロアルケニル、トリ(C₁~C₄アルキル)シリル、-C(R¹¹)=NOR¹²又はフェニルを表してもよく、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、-SF₅、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルキルチオ、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルホニル、C₁~C₄ハロアルキルチオ、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、D-31~D-35又はD-37を表し、m又はnが2以上を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S(O)_r-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH=CH-, -SCH=CH-, -N(R¹³)CH=CH-, -OCH=N-,

-SCH=N-, -N(R¹³)CH=N-, -ON=CH-, -SN=CH-, -N(R¹³)N=CH-, -SN=N-,
 -N(R¹³)N=N-, =NN(R¹³)CH=, =NON=, =NSN=, -CH=CHCH=CH-, -N=CH
 CH=CH-, -CH=NCH=CH-, -N=NCH=CH-, -N=CHN=CH-, -N=CHCH=N-, -CH=N
 N=CH-又は-N=NCH=N-を形成することにより、それぞれのZが結合する
 炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を
 形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、シアノ
 、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル又はメトキシによ
 って任意に置換されていてもよく、

Z^aは、ハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルを表し、

R⁷は、メチル又はエチルを表し、

R⁸は、シアノ、C₃~C₆シクロアルキル、-OR¹⁴、C₁~C₄アルキルチ
 オ、-C(O)NH₂又は-C(S)NH₂を表し、

R⁹は、C₁~C₄アルキル又はC₃~C₄シクロアルキルを表し、

R¹⁰は、-OR¹⁵又は-S(O)_rR¹⁶を表し、

R¹¹は、水素原子又はメチルを表し、

R¹²は、メチル又はエチルを表し、

R¹³は、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₃~C₄シクロア
 ルキルメチル又はC₃~C₄シクロアルキルを表し、

R¹⁴は、C₁~C₄アルキル又はC₂~C₄ハロアルキルを表し、

R¹⁵は、水素原子、メチル、エチル又はC₁~C₂ハロアルキルを表し
 、

R¹⁶は、メチル、エチル又はC₁~C₂ハロアルキルを表す、

請求項1に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オ
 キシド又はそれらの塩。

[請求項3]

G¹は、G¹⁻¹、G¹⁻²、G¹⁻³、G¹⁻⁴、G¹⁻⁵、G¹⁻⁶、G¹⁻⁷、G¹⁻⁸、G¹⁻¹
 0、G¹⁻¹¹、G¹⁻¹²、G¹⁻¹⁴又はG¹⁻¹⁶で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子、ニトロ、メチル、ジフルオロメチル、トリフ
 ルオロメチル、メトキシ、メチルチオ、メチルスルホニル又はジフル

オロメチルスルホニルを表し、

X^2 は、水素原子又はフッ素原子を表し、ただし、 G^1 が G^1-10 で表される構造を表し、且つ X^1 がジフルオロメチルを表す場合には、 X^2 は水素原子を表し、

Y^1 は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、

Y^2 は、水素原子を表し、

R^1 は、水素原子、フッ素原子、メチル又はメトキシを表し、

R^2 は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^1 と R^2 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R^3 は、水素原子、メチル又はエチルを表し、

R^4 は、水素原子又はメチルを表し、

ここで、 R^3 と R^4 とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^3 及び R^4 が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R^5 は、水素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 R^8 によって置換された($C_1\sim C_2$)アルキル、シクロプロピル、 $C_2\sim C_4$ アルケニル、 $C_3\sim C_4$ アルキニル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $-C(O)R^9$ 又は $C_1\sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^6 は、 $(Z)_m$ によって置換されたフェニル、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23又はD-25を表し、

さらに、 R^1 がフッ素原子を表し、 R^2 がフッ素原子を表し、 R^3 がメチルを表し、且つ R^4 が水素原子又はメチルを表す場合には、 R^6 は $C_1\sim C_4$ ハロアルキル又は $C_3\sim C_6$ シクロアルキルを表してもよく、

Z は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_1\sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホ

ニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、 m 又は n が2以上を表す場合には、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの Z が隣接する場合には、隣接する2つの Z は $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^{13})CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、 $-N(R^{13})CH=N-$ 、 $-ON=CH-$ 、 $-SN=CH-$ 、 $-N(R^{13})N=CH-$ 、 $-N(R^{13})N=N-$ 、 $=NN(R^{13})CH=$ 、 $=NON=$ 、 $=NSN=$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、それぞれの Z が結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、

R^7 は、メチルを表し、

R^8 は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OR^{14}$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し、

R^9 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

m は、1、2又は3を表し、

n は、0、1、2又は3を表す、

請求項2に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[請求項4]

G^1 は、 G^1-1 で表される構造を表し、

X^1 は、ハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルを表し、

X^2 は、水素原子又はフッ素原子を表す、

請求項1～3のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[請求項5]

G^1 は、 G^1-2 又は G^1-3 で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メチルチオ、メチルスルホニル又はジフルオロメチルスルホニルを表す、

請求項1～3のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[請求項6]

G¹は、G¹⁻⁴で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表す、

請求項1～3のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[請求項7]

G¹は、G¹⁻⁷又はG¹⁻⁸で表される構造を表し、

X¹は、ハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルを表す、

請求項1～3のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[請求項8]

G¹は、G¹⁻¹⁰で表される構造を表し、

X¹は、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルを表し、

X²は、水素原子を表し、

R⁷は、メチルを表す、

請求項1～3のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[請求項9]

R⁶は、(Z)_mによって置換されたフェニル、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23又はD-25を表し、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、m又はnが2以上を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、

隣接する2つのZは $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{ON}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SN}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{13})\text{N}=\text{N}-$ 、 $=\text{NN}(\text{R}^{13})\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $=\text{NON}=\text{CH}-$ 、 $=\text{NSN}=\text{CH}-$ 又は $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、

R^{13} は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル又は $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルを表し、

m は、1、2又は3を表し、

n は、0、1、2又は3を表す、

請求項1～8のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[請求項10]

R^1 がフッ素原子を表し、

R^2 がフッ素原子を表し、

R^3 がメチルを表し、

R^4 が水素原子を表し、

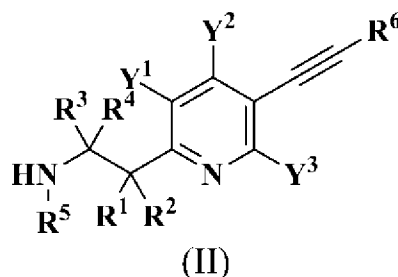
R^6 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキル又は $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキルを表す、

請求項1～8のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩。

[請求項11]

下記式 (II) で表される、請求項1～10のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩の製造中間体。

[化6]



[式中、Y¹は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、

Y²は、水素原子を表し、

Y³は、水素原子を表し、

R¹は、水素原子、フッ素原子、メチル又はメトキシを表し、

R²は、水素原子、フッ素原子又はメチルを表し、

ここで、R¹とR²とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R¹及びR²が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R³は、水素原子、メチル又はエチルを表し、

R⁴は、水素原子又はメチルを表し、

ここで、R³とR⁴とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、R³及びR⁴が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表してもよく、

R⁵は、水素原子、C₁~C₄アルキル又はシクロプロピルを表し、

R⁶は、(Z)_mによって置換されたフェニル、D-1、D-2、D-6、D-8、D-23又はD-25を表し、

さらに、R¹がフッ素原子を表し、R²がフッ素原子を表し、R³がメチルを表し、且つR⁴が水素原子又はメチルを表す場合には、R⁶はC₁~C₄ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル又はトリ(C₁~C₄アルキル)シリルを表してもよく、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₄ハロアルコキシ、C₁~C₄アルキルチオ、C₁~C₄アルキルスルフィニル、C₁~C₄アルキルスルホニル、C₁~C₄ハロアルキルチオ、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル、D-31、D-32又はD-34を表し、m又はnが2以上を表す場合には、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH₂CH₂CH₂-、-OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-、-OCH=CH-

-SCH=CH-, -N(R¹³)CH=CH-, -OCH=N-, -SCH=N-, -N(R¹³)CH=N-, -ON=CH-, -SN=CH-, -N(R¹³)N=CH-, -N(R¹³)N=N-, =NN(R¹³)CH=, =NON=, =NSN=又は-CH=CHCH=CH-を形成することにより、それぞれのZが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、メチル又はトリフルオロメチルによって任意に置換されていてもよく、

R¹³は、C₁~C₄アルキル又はC₁~C₄ハロアルキルを表し、

mは、1、2又は3を表し、

nは、0、1、2又は3を表す。]

[請求項12] 請求項1~10のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシドおよびそれらの塩からなる群より選ばれる1種以上を有効成分として含有する有害生物防除剤組成物。

[請求項13] 請求項1~10のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシドおよびそれらの塩からなる群より選ばれる1種以上を有効成分として含有する哺乳動物又は鳥類の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

[請求項14] 哺乳動物又は鳥類に経口投与するための請求項13に記載の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

[請求項15] 哺乳動物又は鳥類に非経口投与するための請求項13に記載の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

[請求項16] 哺乳動物又は鳥類に非経口投与する方法が、注射による投与である請求項15に記載の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

[請求項17] 哺乳動物又は鳥類に非経口投与する方法が、経皮投与である請求項15に記載の抗真菌剤又は寄生虫防除剤組成物。

[請求項18] 請求項1~10のいずれか1項に記載のアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシドおよびそれらの塩からなる群より選ばれる1種以上を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤又は殺線虫剤組成物。

- [請求項19] 植物に茎葉散布するための請求項18に記載の農園芸用殺菌剤又は殺線虫剤組成物。
- [請求項20] 植物が生育する土壌を処理するための請求項18に記載の農園芸用殺菌剤又は殺線虫剤組成物。
- [請求項21] 植物の種子、塊根又は根茎を処理するための請求項18に記載の農園芸用殺菌剤又は殺線虫剤組成物。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2017/023955

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

See extra sheet.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D213/61, A01N43/40, A01N43/56, A01P3/00, A01P5/00, A61K31/44, A61K31/443, A61K31/4436, A61K31/4439, A61K31/444, A61K31/497, A61P31/10, A61P33/00, C07D401/12, C07D405/12, C07D409/12, C07D411/12, C07D413/12,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

| | | | |
|---------------------------|-----------|----------------------------|-----------|
| Jitsuyo Shinan Koho | 1922-1996 | Jitsuyo Shinan Toroku Koho | 1996-2017 |
| Kokai Jitsuyo Shinan Koho | 1971-2017 | Toroku Jitsuyo Shinan Koho | 1994-2017 |

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAplus/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|--|-----------------------|
| X | WO 2015/125824 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 27 August 2015 (27.08.2015), entire text; particularly, formula (I); tables 3 to 18; test examples & US 2017/0008847 A1 entire text; particularly, formula (I); tables 3 to 18; test examples & JP 2015-214536 A & JP 2015-214535 A & EP 3109234 A1 | 1-9, 11-21 |

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date

“L” document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

“T” later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

“X” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

“Y” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

“&” document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
07 September 2017 (07.09.17)

Date of mailing of the international search report
19 September 2017 (19.09.17)

Name and mailing address of the ISA/
Japan Patent Office
3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku,
Tokyo 100-8915, Japan

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2017/023955

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| X | JP 2013-541513 A (Boehringer Ingelheim International GmbH), 14 November 2013 (14.11.2013), example 35.3 & US 2012/0214785 A1 example 35.3 & WO 2012/028676 A1 & EP 2611771 A1 | 11 |
| A | JP 2009-539791 A (Syngenta Participations AG.), 19 November 2009 (19.11.2009), Y.474, Y.477, Z1.474, Z1.477 & US 2011/0207771 A1 Y.474, Y.477, Z1.474, Z1.477 & WO 2007/141009 A1 & EP 2035374 A1 & KR 10-2009-0016512 A & CN 101489999 A | 1-9,11-21 |
| A | WO 2014/173921 A1 (Syngenta Participations AG.), 30 October 2014 (30.10.2014), X.7, X.8 (Family: none) | 1-9,11-21 |
| P,X | JP 2017-39722 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 23 February 2017 (23.02.2017), formula (I) (Family: none) | 1-9,11-21 |
| P,X | JP 2017-36275 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 16 February 2017 (16.02.2017), formula (I) (Family: none) | 1-9,11-21 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2017/023955

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

C07D213/61(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01N43/56(2006.01)i,
A01P3/00(2006.01)i, A01P5/00(2006.01)i, A61K31/44(2006.01)i,
A61K31/443(2006.01)i, A61K31/4436(2006.01)i, A61K31/4439(2006.01)i,
A61K31/444(2006.01)i, A61K31/497(2006.01)i, A61P31/10(2006.01)i,
A61P33/00(2006.01)i, C07D401/12(2006.01)i, C07D405/12(2006.01)i,
C07D409/12(2006.01)i, C07D411/12(2006.01)i, C07D413/12(2006.01)i,
C07D417/12(2006.01)i

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national
classification and IPC)

Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (International Patent Classification (IPC))

C07D417/12

Minimum documentation searched (classification system followed by
classification symbols)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2017/023955

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:
See extra sheet.

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:
a part of claims 1-8, 11-22, and claim 9

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2017/023955

Continuation of Box No.III of continuation of first sheet(2)

Document 1: WO 2015/125824 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 27 August 2015 (27.08.2015), compound 8-027

Claims are classified into the following two inventions.

(Invention group 1) Parts (i) of claims 1-21 satisfying the first definition of R⁶ set forth in claim 1, namely "R⁶ represents a C₃-C₆ cycloalkyl(C₃-C₆)cycloalkyl group, a phenyl(C₃-C₆)cycloalkyl group, a phenyl group substituted by (Z)_m or D-1 to D-29" (parts of claims 1-8, 11-22 and claim 9)

Since the invention of parts (i) of claims 1-21 satisfying the first definition of R⁶ set forth in claim 1 has a special technical feature that is "an alkynylpyridine-substituted amide compound represented by formula (I), an N-oxide of the compound or a salt of the compound or the N-oxide, wherein R⁶ represents a C₃-C₆ cycloalkyl(C₃-C₆)cycloalkyl group, a phenyl(C₃-C₆)cycloalkyl group, a phenyl group substituted by (Z)_m or D-1 to D-29", the invention of parts (i) of claims 1-21 satisfying the first definition of R⁶ set forth in claim 1 is placed in invention group 1.

With respect to the invention group 1, the definitions of R¹, R², R³ and R⁴ are generally as follows: R¹ represents a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₆ alkyl group, a C₁-C₆ haloalkyl group, a phenyl(C₁-C₄)alkyl group, a phenyl(C₁-C₄)alkyl group substituted by (Z)_m, a C₃-C₆ cycloalkyl group, a C₂-C₆ alkenyl group, a C₂-C₆ alkynyl group, a C₁-C₆ alkoxy group, a C₁-C₆ haloalkoxy group, a C₃-C₆ alkenyloxy group, a C₃-C₆ haloalkenyloxy group, a C₃-C₆ alkynyloxy group, a C₃-C₆ haloalkynyloxy group, a cyano(C₁-C₄)alkoxy group, a phenyl(C₁-C₄)alkoxy group, a phenyl(C₁-C₄)alkoxy group substituted by (Z)_m, a C₁-C₆ alkylthio group, a C₁-C₆ haloalkylthio group, a C₁-C₆ alkoxyamino group, -C(O)NH₂ or -C(S)NH₂; R² represents a hydrogen atom, a halogen atom or a C₁-C₆ alkyl group; R³ represents a hydrogen atom, a C₁-C₆ alkyl group or a C₁-C₆ haloalkyl group; R⁴ represents a hydrogen atom or a C₁-C₆ alkyl group (provided that R¹ and R², and R³ and R⁴ may respectively combine with each other and -omitted -); and any one of R¹, R², R³ and R⁴ includes a hydrogen atom as an option.

(Invention group 2) Parts (ii) of claims 1-21 satisfying requirements other than the parts (i) set forth in claim 1, namely (in cases where R¹ represents a fluorine atom, a C₁-C₆ alkyl group or a C₁-C₆ alkoxy group; R² represents a fluorine atom or a C₁-C₆ alkyl group; R³ represents a C₁-C₆ alkyl group or a C₁-C₆ haloalkyl group; and R⁴ represents a hydrogen atom or a C₁-C₆ alkyl group) "R⁶ may represent a hydrogen atom, a halogen atom, a C₁-C₆ alkyl group, a C₁-C₆ haloalkyl group, a (C₁-C₄)alkyl group arbitrarily substituted by R¹⁰, a C₃-C₁₀ cycloalkyl group, a C₃-C₁₀ halocycloalkyl group, a hydroxy(C₃-C₆)cycloalkyl group, a C₁-C₄alkoxy(C₃-C₆)cycloalkyl group, a C₄-C₁₀ cycloalkenyl group, a C₄-C₁₀ halocycloalkenyl group, a tri(C₁-C₄alkyl)silyl group, a phenyldimethylsilyl group, -C(R¹¹)=NOR¹² or a phenyl group" (parts of claims 1-8, 11-22 and claim 10)

The technical feature common to the invention of parts (ii) of claims 1-21 set forth in claim 1 and the invention placed in invention group 1 is "an alkynylpyridine-substituted amide compound represented by formula (I), an N-oxide of the compound or a salt of the compound or the N-oxide" wherein R¹ and R², and R³ and R⁴ are selected from among the options for the invention group 1 and R⁶ is selected from among the options for the invention group 1 or the invention group 2.

(Continued to next extra sheet)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2017/023955

However, the above-said technical feature cannot be considered to be a special technical feature, since the technical feature does not make a contribution over the prior art in the light of the contents disclosed in the document 1.

Further, there is no other same or corresponding special technical feature between these inventions.

Consequently, the inventions concerning the part of claims 1-8, 11-21 which satisfies (ii) set forth in claim 1, and the invention of claim 10 cannot be classified into Invention 1.

Since the invention of parts of claims 1-8, 11-21 satisfying (ii) set forth in claim 1 and the invention of claim 10 have a technical feature that is "an alkynylpyridine-substituted amide compound represented by formula (I), an N-oxide of the compound or a salt of the compound or the N-oxide" having a specific combination of R^1 and R^2 , and R^3 , R^4 and R^6 , the invention of parts of claims 1-8, 11-21 satisfying (ii) set forth in claim 1 and the invention of claim 10 are placed in invention group 2.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. 特別ページ参照

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07D213/61, A01N43/40, A01N43/56, A01P3/00, A01P5/00, A61K31/44, A61K31/443, A61K31/4436, A61K31/4439, A61K31/444, A61K31/497, A61P31/10, A61P33/00, C07D401/12, C07D405/12, C07D409/12, C07D411/12, C07D413/12, C07D417/12

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

| | |
|-------------|------------|
| 日本国実用新案公報 | 1922-1996年 |
| 日本国公開実用新案公報 | 1971-2017年 |
| 日本国実用新案登録公報 | 1996-2017年 |
| 日本国登録実用新案公報 | 1994-2017年 |

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求項の番号 |
|-----------------|---|----------------|
| X | WO 2015/125824 A1 (日産化学工業株式会社) 2015.08.27, 全文、特に式(I)、第3-18表、試験例 & US 2017/0008847 A1; 全文、特に式(I)、第3-18表、試験例 & JP 2015-214536 A & JP 2015-214535 A & EP 3109234 A1 | 1-9, 11-21 |
| X | JP 2013-541513 A (ベーリンガー インゲルハイム インターナシヨ ナル ゲゼルシャフト ミット ベシユレンクテル ハフツング) 2013.11.14, 実施例 35.3 | 11 |

C欄の続きにも文献が列挙されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

| | |
|---|--|
| * 引用文献のカテゴリー | の日の後に公表された文献 |
| 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの | 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの |
| 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの | 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの |
| 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) | 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの |
| 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 | 「&」同一パテントファミリー文献 |
| 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願 | |

国際調査を完了した日
07.09.2017

国際調査報告の発送日
19.09.2017

国際調査機関の名称及びあて先
日本国特許庁 (ISA/J P)
郵便番号 100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

| | | |
|---------------------------|-----|------|
| 特許庁審査官 (権限のある職員) 安藤 倫世 | 4 P | 9837 |
| 電話番号 03-3581-1101 内線 3492 | | |

| C (続き) . 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------------|---|----------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求項の番号 |
| A | & US 2012/0214785 A1; 実施例 35.3 & WO 2012/028676 A1 & EP 2611771 A1 JP 2009-539791 A (シンジェンタ パーティシペーションズ アク チェンゲゼルシャフト) 2009. 11. 19, Y. 474, Y. 477, Z1. 474, Z1. 477 & US 2011/0207771 A1; Y. 474, Y. 477, Z1. 474, Z1. 477 & WO 2007/141009 A1 & EP 2035374 A1 & KR 10-2009-0016512 A & CN 101489999 A | 1-9, 11-21 |
| A | WO 2014/173921 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2014. 10. 30, X. 7, X. 8 (ファミリーなし) | 1-9, 11-21 |
| P, X | JP 2017-39722 A (日産化学工業株式会社) 2017. 02. 23, 式(I) (ファミリーなし) | 1-9, 11-21 |
| P, X | JP 2017-36275 A (日産化学工業株式会社) 2017. 02. 16, 式(I) (ファミリーなし) | 1-9, 11-21 |

発明の属する分野の分類

C07D213/61(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01N43/56(2006.01)i, A01P3/00(2006.01)i,
A01P5/00(2006.01)i, A61K31/44(2006.01)i, A61K31/443(2006.01)i,
A61K31/4436(2006.01)i, A61K31/4439(2006.01)i, A61K31/444(2006.01)i,
A61K31/497(2006.01)i, A61P31/10(2006.01)i, A61P33/00(2006.01)i,
C07D401/12(2006.01)i, C07D405/12(2006.01)i, C07D409/12(2006.01)i,
C07D411/12(2006.01)i, C07D413/12(2006.01)i, C07D417/12(2006.01)i

第II欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT17条(2)(a))の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. 請求項 _____ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、
2. 請求項 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. 請求項 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第III欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところの国際調査機関は認めた。
特別ページ参照。

1. 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求項について作成した。
2. 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求項について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求項のみについて作成した。
4. 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求項について作成した。

請求項 1 - 8, 11 - 22の一部と請求項 9

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- 追加調査手数料及び、該当する場合には、異議申立手数料の納付と共に、出願人から異議申立てがあった。
- 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあったが、異議申立手数料が納付命令書に示した期間内に支払われなかった。
- 追加調査手数料の納付はあったが、異議申立てはなかった。

第Ⅲ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見

文献1：WO 2015/125824 A1（日産化学工業株式会社）2015.08.27, 化合物8-027等
請求の範囲は、以下の2つの発明に区分される。

（発明1）請求項1-21のうち、請求項1に記載の最初のR⁶の定義「C₃~C₆シクロアルキル(C₃~C₆)シクロアルキル、フェニル(C₃~C₆)シクロアルキル、(Z)_mによって置換されたフェニル又はD-1~D-29を表し、」を充足する部分(i)（請求項1-8, 11-22の一部と請求項9）

請求項1-21のうち、請求項1に記載の最初のR⁶の定義を充足する部分(i)に係る発明は、「R⁶は、C₃~C₆シクロアルキル(C₃~C₆)シクロアルキル、フェニル(C₃~C₆)シクロアルキル、(Z)_mによって置換されたフェニル又はD-1~D-29を表す、式(I)で表されるアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩」という特別な技術的特徴を有しているので、発明1に区分する。

発明1において、R¹、R²、R³、R⁴の定義は概略以下のとおりであり、

R¹は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、フェニル(C₁~C₄)アルキル、(Z)_mによって置換されたフェニル(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₃~C₆アルケニルオキシ、C₃~C₆ハロアルケニルオキシ、C₃~C₆アルキニルオキシ、C₃~C₆ハロアルキニルオキシ、シアノ(C₁~C₄)アルコキシ、フェニル(C₁~C₄)アルコキシ、(Z)_mによって置換されたフェニル(C₁~C₄)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルコキシアミノ、-C(O)NH₂又は-C(S)NH₂を表し、

R²は、水素原子、ハロゲン原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

R³は、水素原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表し、

R⁴は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

(ここで、R¹とR²、R³とR⁴とは、それぞれ一緒になって・・・もよい)、

R¹、R²、R³、R⁴のそれぞれはいずれも、水素原子を選択肢として包含している。

（発明2）請求項1-21のうち、請求項1に記載の、上記(i)以外の部分(R¹がフッ素原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆アルコキシを表し、R²がフッ素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、R³がC₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表し、且つR⁴が水素原子又はC₁~C₆アルキルを表す場合には、)「R⁶は水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、R¹⁰によって任意に置換された(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₃~C₁₀ハロシクロアルキル、ヒドロキシ(C₃~C₆)シクロアルキル、C₁~C₄アルコキシ(C₃~C₆)シクロアルキル、C₄~C₁₀シクロアルケニル、C₄~C₁₀ハロシクロアルケニル、トリ(C₁~C₄アルキル)シリル、フェニルジメチルシリル、-C(R¹¹)=NOR¹²又はフェニルを表してもよく、」を充足する部分(ii)（請求項1-8, 11-22の一部と請求項10）

請求項1-21のうち、請求項1に記載の、上記(ii)の部分に係る発明と、発明1に区分された発明とに共通する技術的特徴は、R¹、R²、R³、R⁴は発明1の選択肢から選択され、R⁶は発明1又は発明2の選択肢から選択される、「式(I)で表されるアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩」である。

(続く)

しかしながら、当該技術的特徴は、文献1の開示内容に照らして、先行技術に対する貢献をもたらすものではないから、当該技術的特徴は、特別な技術的特徴であるとはいえない。また、これらの発明の間には、他に同一の又は対応する特別な技術的特徴は存在しない。

したがって、請求項1-8、11-21のうち、請求項1に記載の(i i)を充足する部分に係る発明と、請求項10に係る発明とは、発明1に区分できない。

そして、請求項1-8、11-21のうち、請求項1に記載の(i i)を充足する部分に係る発明と、請求項10に係る発明は、特定の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 と、 R^6 との組み合わせを有する「式(I)で表されるアルキニルピリジン置換アミド化合物、そのN-オキシド又はそれらの塩」という技術的特徴を有しているので、発明2に区分する。