

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6488402号
(P6488402)

(45) 発行日 平成31年3月20日(2019.3.20)

(24) 登録日 平成31年3月1日(2019.3.1)

(51) Int. Cl.	F I
C07D 413/04 (2006.01)	C O 7 D 413/04 C S P
C07D 487/04 (2006.01)	C O 7 D 487/04 1 4 4
C07D 471/04 (2006.01)	C O 7 D 471/04 1 O 7 K
A61K 31/5025 (2006.01)	A 6 1 K 31/5025
A61K 31/437 (2006.01)	A 6 1 K 31/437

請求項の数 16 (全 168 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2017-545442 (P2017-545442)
 (86) (22) 出願日 平成28年10月12日 (2016.10.12)
 (86) 国際出願番号 PCT/JP2016/080274
 (87) 国際公開番号 W02017/065183
 (87) 国際公開日 平成29年4月20日 (2017.4.20)
 審査請求日 平成30年4月9日 (2018.4.9)
 (31) 優先権主張番号 特願2015-201937 (P2015-201937)
 (32) 優先日 平成27年10月13日 (2015.10.13)
 (33) 優先権主張国 日本国(JP)
 (31) 優先権主張番号 特願2016-30466 (P2016-30466)
 (32) 優先日 平成28年2月19日 (2016.2.19)
 (33) 優先権主張国 日本国(JP)
 (31) 優先権主張番号 特願2016-140926 (P2016-140926)
 (32) 優先日 平成28年7月15日 (2016.7.15)
 (33) 優先権主張国 日本国(JP)

(73) 特許権者 000232623
 日本農薬株式会社
 東京都中央区京橋1丁目19番8号
 (74) 代理人 100077012
 弁理士 岩谷 龍
 (72) 発明者 佐野 勇介
 大阪府河内長野市小山田町345 日本農
 薬株式会社総合研究所内
 (72) 発明者 米村 樹
 大阪府河内長野市小山田町345 日本農
 薬株式会社総合研究所内
 (72) 発明者 松尾 宗一郎
 大阪府河内長野市小山田町345 日本農
 薬株式会社総合研究所内

最終頁に続く

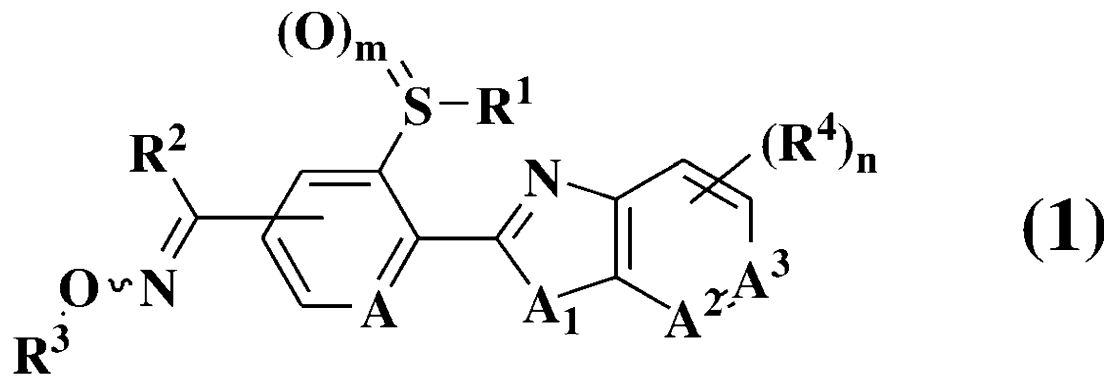
(54) 【発明の名称】 オキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類及び該化合物を含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(1)

【化1】



{ 式中、

R¹ は、

- (a1) (C₁ - C₆) アルキル基；
- (a2) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；
- (a3) (C₂ - C₆) アルケニル基；又は
- (a4) (C₂ - C₆) アルキニル基；を示す。

R² は、

- (b1) 水素原子；
- (b2) (C₁-C₆) アルキル基；
- (b3) (C₃-C₆) シクロアルキル基；
- (b4) 八口 (C₁-C₆) アルキル基；
- (b5) アミノ基；
- (b6) シアノ基；
- (b7) (C₁-C₆) アルコキシカルボニル基；
- (b8) アミノカルボニル基；
- (b9) モノ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基；又は
- (b10) ジ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基；

10

を示す。

R³ は、

- (c1) 水素原子；
- (c2) (C₁-C₆) アルキル基；
- (c3) (C₂-C₆) アルケニル基；
- (c4) (C₂-C₆) アルキニル基；
- (c5) (C₃-C₆) シクロアルキル基；
- (c6) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルキル基；
- (c7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基；
- (c8) 八口 (C₁-C₆) アルキル基；
- (c9) 八口 (C₂-C₆) アルケニル基；
- (c10) 八口 (C₂-C₆) アルキニル基；
- (c11) フェニル基；
- (c12) 同一又は異なっても良く、(a)八口ゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)八口 (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)八口 (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)八口 (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m)八口 (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)八口 (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基；
- (c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基；
- (c14) 同一又は異なっても良く、(a)八口ゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)八口 (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)八口 (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)八口 (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m)八口 (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)八口 (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル (C₁-C₆) アルキル基；
- (c15) (C₁-C₆) アルキルカルボニル基；
- (c16) (C₃-C₆) シクロアルキルカルボニル基；
- (c17) シアノアルキル基；
- (c18) (C₁-C₆) アルキルチオ (C₁-C₆) アルキル基；
- (c19) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル (C₁-C₆) アルキル基；
- (c20) (C₁-C₆) アルキルスルホニル (C₁-C₆) アルキル基；
- (c21) 八口 (C₁-C₆) アルキルチオ (C₁-C₆) アルキル基；
- (c22) 八口 (C₁-C₆) アルキルスルフィニル (C₁-C₆) アルキル基；又は
- (c23) 八口 (C₁-C₆) アルキルスルホニル (C₁-C₆) アルキル基；

20

30

40

を示す。

50

R⁴ は、

- (d1) ハロゲン原子；
- (d2) シアノ基；
- (d3) ニトロ基；
- (d4) (C₁-C₆) アルキル基；
- (d5) (C₁-C₆) アルコキシ基；
- (d6) (C₂-C₆) アルケニルオキシ基；
- (d7) (C₂-C₆) アルキニルオキシ基；
- (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；
- (d9) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基；
- (d10) ハロ (C₂-C₆) アルケニルオキシ基；
- (d11) ハロ (C₂-C₆) アルキニルオキシ基；
- (d12) (C₁-C₆) アルキルチオ基；
- (d13) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；
- (d14) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；
- (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基；
- (d16) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；又は
- (d17) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；を示す。

10

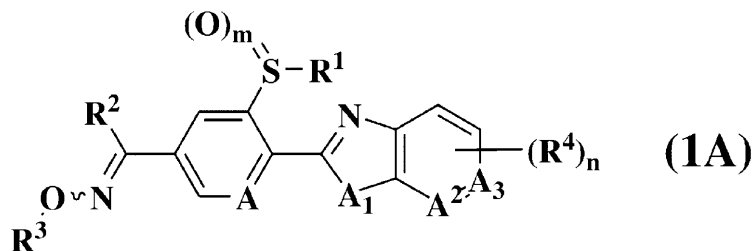
A 及び A²、A³ は、CH 又は窒素原子を示し、A¹ は、O、S、又は N - R⁵ を示す (ここで R⁵ は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基；(e2) (C₃-C₆) シクロアルキル基；(e3) (C₂-C₆) アルケニル基；又は (e4) (C₂-C₆) アルキニル基；を示す)。
m は 0、1、又は 2 を示し、n は 0、1、又は 2 を示す。} で示される縮合複素環化合物又はその塩。

20

【請求項 2】

一般式 (1A)

【化 2】



30

{ 式中、

- R¹ は、(a1) (C₁-C₆) アルキル基；を示す。
- R² は、(b1) 水素原子；又は (b2) (C₁-C₆) アルキル基；を示す。
- R³ は、(c1) 水素原子；又は (c8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；を示す。
- R⁴ は、(d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；
- (d9) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基；
- (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基；
- (d16) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；又は
- (d17) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；を示す。

40

A は、窒素原子を示し、A²、A³ は、CH 又は窒素原子を示し、A¹ は、O、又は N - R⁵ を示す (ここで R⁵ は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基；を示す)。
m は 0 又は 2 を示し、n は 1 を示す。} で示される請求項 1 に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

【請求項 3】

A¹ が、O である請求項 2 に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

50

【請求項 4】

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の縮合複素環化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

【請求項 5】

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の縮合複素環化合物又はその塩の有効量で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用方法。

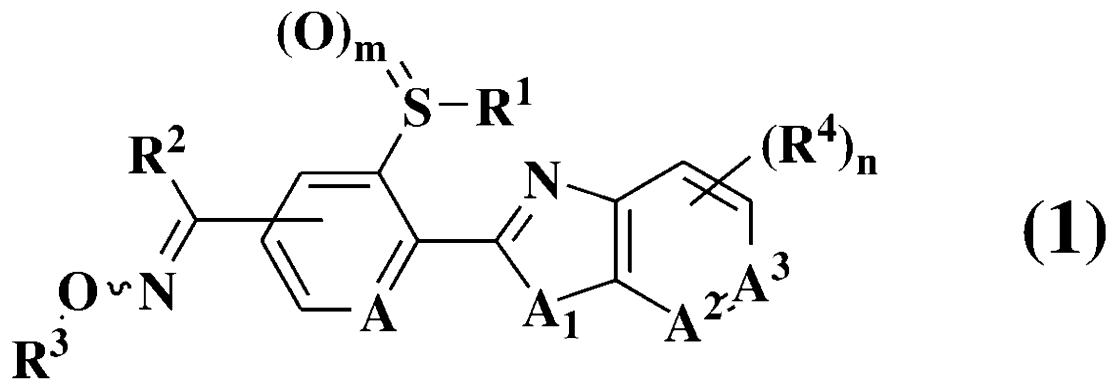
【請求項 6】

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の縮合複素環化合物又はその塩の有効量を有効成分として含有することを特徴とする動物用外部寄生虫防除剤。

【請求項 7】

一般式 (1)

【化 3】



{ 式中、

R¹ は、

- (a1) (C₁ - C₆) アルキル基；
- (a2) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；
- (a3) (C₂ - C₆) アルケニル基；又は
- (a4) (C₂ - C₆) アルキニル基；を示す。

R² は、

- (b1) 水素原子；
- (b2) (C₁ - C₆) アルキル基；
- (b3) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；
- (b4) ハロ (C₁ - C₆) アルキル基；又は
- (b5) アミノ基；を示す。

R³ は、

- (c1) 水素原子；
- (c2) (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c3) (C₂ - C₆) アルケニル基；
- (c4) (C₂ - C₆) アルキニル基；
- (c5) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；
- (c6) (C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c7) (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c8) ハロ (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c9) ハロ (C₂ - C₆) アルケニル基；
- (c10) ハロ (C₂ - C₆) アルキニル基；
- (c11) フェニル基；

(c12) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁ - C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、(g) (C₁ - C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ基、(i) (C₃ - C₆) シクロアル

10

20

30

40

50

キル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基；
(c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基；

(c14) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f) ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル (C₁-C₆) アルキル基；

(c15) (C₁-C₆) アルキルカルボニル基；又は

(c16) (C₃-C₆) シクロアルキルカルボニル基；

を示す。

R⁴ は、

(d1) ハロゲン原子；

(d2) シアノ基；

(d3) ニトロ基；

(d4) (C₁-C₆) アルキル基；

(d5) (C₁-C₆) アルコキシ基；

(d6) (C₂-C₆) アルケニルオキシ基；

(d7) (C₂-C₆) アルキニルオキシ基；

(d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；

(d9) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基；

(d10) ハロ (C₂-C₆) アルケニルオキシ基；

(d11) ハロ (C₂-C₆) アルキニルオキシ基；

(d12) (C₁-C₆) アルキルチオ基；

(d13) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；

(d14) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；

(d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基；

(d16) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；又は

(d17) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；を示す。

A 及び A²、A³ は、C H 又は窒素原子を示し、A¹ は、O、S 又は N - R⁵ を示す（ここで R⁵ は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基；(e2) (C₃-C₆) シクロアルキル基；(e3) (C₂-C₆) アルケニル基；又は (e4) (C₂-C₆) アルキニル基；を示す）。

m は 0、1、又は 2 を示し、n は 0、1、又は 2 を示す。} で示される請求項 1 に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

【請求項 8】

一般式 (1A)

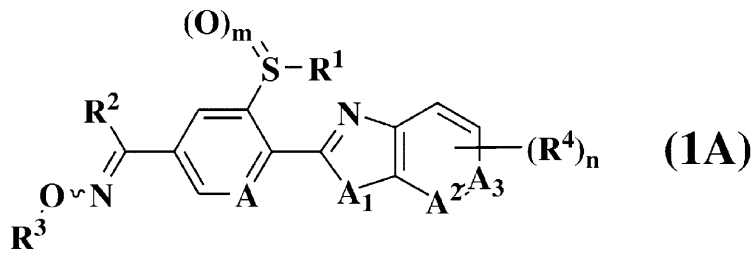
10

20

30

40

【化4】



10

{ 式中、

R¹ は、

- (a1) (C₁ - C₆) アルキル基；
- (a2) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；
- (a3) (C₂ - C₆) アルケニル基；又は
- (a4) (C₂ - C₆) アルキニル基；を示す。

R² は、

- (b1) 水素原子；
- (b2) (C₁ - C₆) アルキル基；
- (b3) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；又は
- (b5) アミノ基；を示す。

20

R³ は、

- (c1) 水素原子；
- (c2) (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c3) (C₂ - C₆) アルケニル基；
- (c4) (C₂ - C₆) アルキニル基；
- (c5) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；
- (c6) (C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c7) (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c8) ハロ (C₁ - C₆) アルキル基；
- (c9) ハロ (C₂ - C₆) アルケニル基；
- (c10) ハロ (C₂ - C₆) アルキニル基；
- (c11) フェニル基；

30

(c12) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁ - C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、(g) (C₁ - C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ基、(i) (C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルコキシ基、(j) (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(k)ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基；

40

(c13) フェニル (C₁ - C₆) アルキル基； 又は

(c14) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁ - C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、(g) (C₁ - C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ基、(i) (C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルコキシ基、(j) (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(k)ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C₁ - C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル (C₁ - C₆) アルキル基；を示す。

R⁴ は、

50

- (d1) ハロゲン原子；
 (d2) シアノ基；
 (d3) ニトロ基；
 (d4) (C₁-C₆) アルキル基；
 (d5) (C₁-C₆) アルコキシ基；
 (d6) (C₂-C₆) アルケニルオキシ基；
 (d7) (C₂-C₆) アルキニルオキシ基；
 (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；
 (d9) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基；
 (d10) ハロ (C₂-C₆) アルケニルオキシ基； 10
 (d11) ハロ (C₂-C₆) アルキニルオキシ基；
 (d12) (C₁-C₆) アルキルチオ基；
 (d13) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；
 (d14) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；
 (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基；
 (d16) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；又は
 (d17) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；を示す。
 A 及び A²、A³ は、C H、又は窒素原子を示し、A¹ は、O、S、又は N - R⁵ を示す
 (ここで R⁵ は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基；(e2) (C₃-C₆) シクロアルキル基
 ；(e3) (C₂-C₆) アルケニル基；又は (e4) (C₂-C₆) アルキニル基；を示す)。 20
 m は 0、1、又は 2 を示し、n は 0、1、又は 2 を示す。} で示される請求項 7 に記載の
 縮合複素環化合物又はその塩。

【請求項 9】

- R¹ が、
 (a1) (C₁-C₆) アルキル基；を示し、
 R² が、
 (b1) 水素原子；又は
 (b2) (C₁-C₆) アルキル基；を示し、
 R³ が、
 (c1) 水素原子； 30
 (c2) (C₁-C₆) アルキル基；
 (c3) (C₂-C₆) アルケニル基；
 (c7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基；
 (c11) フェニル基；又は
 (c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基；を示し、
 R⁴ が、
 (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；又は
 (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基；を示し、
 A 及び A²、A³ が、窒素原子を示し、A¹ が、N - R⁵ を示し (ここで R⁵ は、(e1)
 (C₁-C₆) アルキル基；を示す)、m が 0、1、又は 2 を示し、n が 1 を示す請求項 8 40
 に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

【請求項 10】

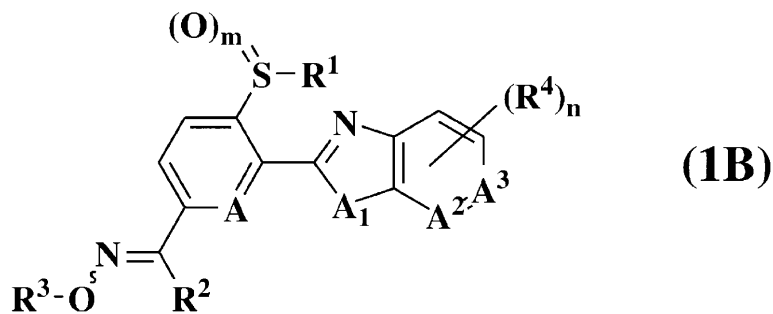
- R¹ が、
 (a1) (C₁-C₆) アルキル基；を示し、
 R² が、
 (b1) 水素原子；又は
 (b2) (C₁-C₆) アルキル基；を示し、
 R³ が、
 (c1) 水素原子；
 (c2) (C₁-C₆) アルキル基； 50

- (c3) (C₂-C₆) アルケニル基 ;
 (c7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c11) フェニル基 ; 又は
 (c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基 ; を示し、
 R⁴ が、
 (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基 ; を示し、
 A 及び A²、A³ が、窒素原子を示し、A¹ が、N-R⁵ を示し (ここで R⁵ は、(e1)
 (C₁-C₆) アルキル基 ; を示す)、
 m が 2 を示し、n が 1 を示す請求項 8 又は 9 に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

【請求項 11】

一般式 (1B)

【化 5】



{ 式中、

R¹ は、

- (a1) (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (a2) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ;
 (a3) (C₂-C₆) アルケニル基 ; 又は
 (a4) (C₂-C₆) アルキニル基 ; を示す。

R² は、

- (b1) 水素原子 ;
 (b2) (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (b3) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ; 又は
 (b5) アミノ基 ; を示す。

R³ は、

- (c1) 水素原子 ;
 (c2) (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c3) (C₂-C₆) アルケニル基 ;
 (c4) (C₂-C₆) アルキニル基 ;
 (c5) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ;
 (c6) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c9) ハロ (C₂-C₆) アルケニル基 ;
 (c10) ハロ (C₂-C₆) アルキニル基 ;
 (c11) フェニル基 ;

- (c12) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C₁-

10

20

30

40

50

C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基 ;
 (c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基 ; 又は
 (c14) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル (C₁-C₆) アルキル基 ; を示す。

10

R⁴ は、

- (d1) ハロゲン原子 ;
- (d2) シアノ基 ;
- (d3) ニトロ基 ;
- (d4) (C₁-C₆) アルキル基 ;
- (d5) (C₁-C₆) アルコキシ基 ;
- (d6) (C₂-C₆) アルケニルオキシ基 ;
- (d7) (C₂-C₆) アルキニルオキシ基 ;
- (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基 ;
- (d9) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基 ;
- (d10) ハロ (C₂-C₆) アルケニルオキシ基 ;
- (d11) ハロ (C₂-C₆) アルキニルオキシ基 ;
- (d12) (C₁-C₆) アルキルチオ基 ;
- (d13) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基 ;
- (d14) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基 ;
- (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基 ;
- (d16) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基 ; 又は
- (d17) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基 ; を示す。

20

A 及び A²、A³ は、CH 又は窒素原子を示し、A¹ は、O、S、又は N - R⁵ を示す (ここで R⁵ は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基 ; (e2) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ; (e3) (C₂-C₆) アルケニル基 ; 又は (e4) (C₂-C₆) アルキニル基 ; を示す)。
 m は 0、1、又は 2 を示し、n は 0、1、又は 2 を示す。} で示される請求項 7 に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

30

【請求項 1 2】

R¹ が、

- (a1) (C₁-C₆) アルキル基 ; を示し、
- R² が、
- (b1) 水素原子 ; 又は
 - (b2) (C₁-C₆) アルキル基 ; を示し、
- R³ が、
- (c1) 水素原子 ;
 - (c2) (C₁-C₆) アルキル基 ;
 - (c3) (C₂-C₆) アルケニル基 ;
 - (c7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基 ;
 - (c11) フェニル基 ; 又は
 - (c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基 ; を示し、
- R⁴ が、
- (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基 ; 又は
 - (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基 ; を示し、
- A 及び A²、A³ が、窒素原子を示し、A¹ が、N - R⁵ を示し (ここで R⁵ は、(e1)

40

50

($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示す)、 m が 0、1、又は 2 を示し、 n が 1 を示す請求項 1 1 に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

【請求項 1 3】

R^1 が、

(a1) ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示し、

R^2 が、

(b1) 水素原子 ; 又は

(b2) ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示し、

R^3 が、

(c1) 水素原子 ;

(c2) ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;

(c3) ($C_2 - C_6$) アルケニル基 ;

(c7) ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;

(c11) フェニル基 ; 又は

(c13) フェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示し、

R^4 が、

(d8) 八口 ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示し、

A 及び A^2 、 A^3 が、窒素原子を示し、 A^1 が、 $N - R^5$ を示し (ここで R^5 は、(e1)

($C_1 - C_6$) アルキル基 ; を示す)、

m が 2 を示し、 n が 1 を示す請求項 1 1 又は 1 2 に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

【請求項 1 4】

請求項 7 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の縮合複素環化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

【請求項 1 5】

請求項 7 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の縮合複素環化合物又はその塩の有効量で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用方法。

【請求項 1 6】

請求項 7 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の縮合複素環化合物又はその塩の有効量を有効成分として含有することを特徴とする動物用外部寄生虫防除剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、オキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類及び該化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びに該使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

これまでに農園芸用殺虫剤として様々な化合物が検討されており、ある種の縮合複素環化合物が殺虫剤として有用であることが報告されている (例えば特許文献 1 ~ 7 参照)。かかる文献中には、オキシム基が縮合複素環と結合した化合物は具体的に開示されていない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献 1】特開 2009 - 280574 号公報

【特許文献 2】特開 2010 - 275301 号公報

【特許文献 3】特開 2011 - 79774 号公報

【特許文献 4】特開 2012 - 131780 号公報

【特許文献 5】国際公開第 2012 / 086848 号パンフレット

【特許文献 6】国際公開第 2013 / 018928 号パンフレット

【特許文献 7】国際公開第 2015 / 121136 号パンフレット

10

20

30

40

50

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤の開発が望まれている。

【課題を解決するための手段】

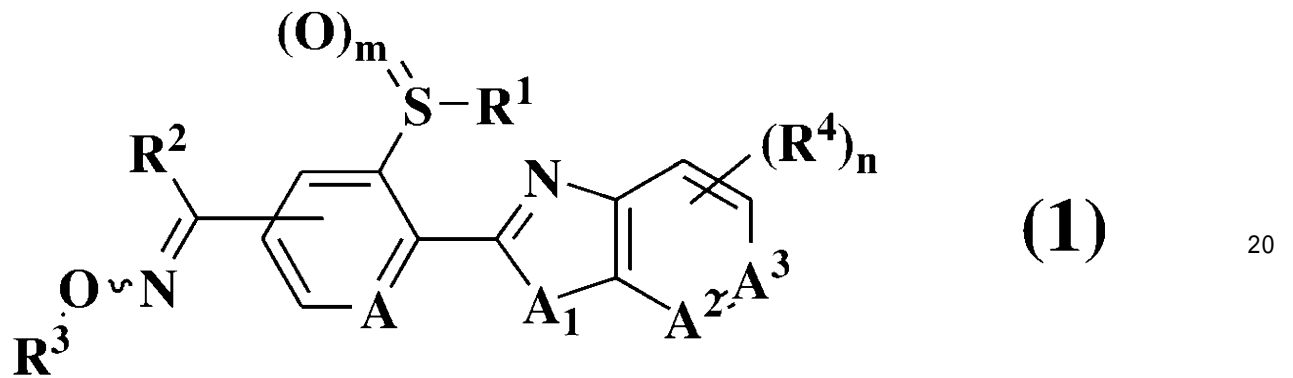
【0005】

本発明者等は上記の課題を解決すべく鋭意検討した結果、一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類が農園芸用害虫に対して優れた防除効果を有することを見出し、本発明に至った。

即ち、本発明は、以下の発明に関する。

〔1〕一般式(1)

【化1】



{式中、

R¹は、

- (a1) (C₁-C₆)アルキル基；
- (a2) (C₃-C₆)シクロアルキル基；
- (a3) (C₂-C₆)アルケニル基；又は
- (a4) (C₂-C₆)アルキニル基；を示す。

R²は、

- (b1) 水素原子；
 - (b2) (C₁-C₆)アルキル基；
 - (b3) (C₃-C₆)シクロアルキル基；
 - (b4) 八員環(C₁-C₆)アルキル基；
 - (b5) アミノ基；
 - (b6) シアノ基；
 - (b7) (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基；
 - (b8) アミノカルボニル基；
 - (b9) モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基；又は
 - (b10) ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基；
- を示す。

R³は、

- (c1) 水素原子；
- (c2) (C₁-C₆)アルキル基；
- (c3) (C₂-C₆)アルケニル基；
- (c4) (C₂-C₆)アルキニル基；
- (c5) (C₃-C₆)シクロアルキル基；
- (c6) (C₃-C₆)シクロアルキル(C₁-C₆)アルキル基；
- (c7) (C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルキル基；
- (c8) 八員環(C₁-C₆)アルキル基；

10

20

30

40

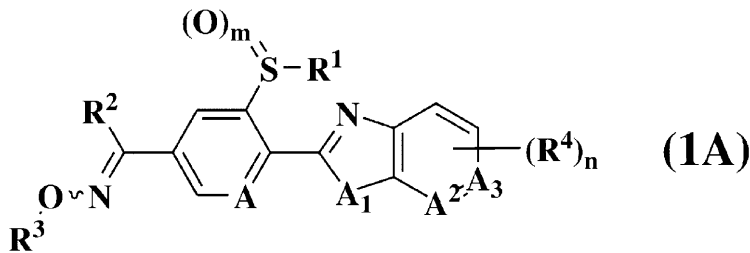
50

- (c9) ハロ ($C_2 - C_6$) アルケニル基 ;
- (c10) ハロ ($C_2 - C_6$) アルキニル基 ;
- (c11) フェニル基 ;
- (c12) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) ($C_1 - C_6$) アルキル基、(f)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、(g) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(h)ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(i) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(j) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(k)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(l) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(n) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基 ; 10
- (c13) フェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;
- (c14) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) ($C_1 - C_6$) アルキル基、(f)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、(g) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(h)ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(i) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルコキシ基、(j) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(k)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、(l) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基、(n) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; 20
- (c15) ($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル基 ;
- (c16) ($C_3 - C_6$) シクロアルキルカルボニル基 ;
- (c17) シアノアルキル基 ;
- (c18) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;
- (c19) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;
- (c20) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;
- (c21) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;
- (c22) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; 又は
- (c23) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;
- を示す。
- R^4 は、 30
- (d1) ハロゲン原子 ;
- (d2) シアノ基 ;
- (d3) ニトロ基 ;
- (d4) ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;
- (d5) ($C_1 - C_6$) アルコキシ基 ;
- (d6) ($C_2 - C_6$) アルケニルオキシ基 ;
- (d7) ($C_2 - C_6$) アルキニルオキシ基 ;
- (d8) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基 ;
- (d9) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ基 ;
- (d10) ハロ ($C_2 - C_6$) アルケニルオキシ基 ; 40
- (d11) ハロ ($C_2 - C_6$) アルキニルオキシ基 ;
- (d12) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基 ;
- (d13) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基 ;
- (d14) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基 ;
- (d15) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基 ;
- (d16) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル基 ; 又は
- (d17) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル基 ; を示す。
- A 及び A^2 、 A^3 は、CH又は窒素原子を示し、 A^1 は、O、S、又はN - R^5 を示す (ここで R^5 は、(e1) ($C_1 - C_6$) アルキル基 ; (e2) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル基 ; (e3) ($C_2 - C_6$) アルケニル基 ; 又は (e4) ($C_2 - C_6$) アルキニル基 ; を示す)。 50

mは0、1、又は2を示し、nは0、1、又は2を示す。}で示される縮合複素環化合物又はその塩。

〔2〕 一般式(1A)

【化2】



10

{ 式中、

R¹は、(a1) (C₁-C₆) アルキル基；を示す。

R²は、(b1) 水素原子；又は (b2) (C₁-C₆) アルキル基；を示す。

R³は、(c1) 水素原子；又は (c8) ハロ(C₁-C₆) アルキル基；を示す。

R⁴は、(d8) ハロ(C₁-C₆) アルキル基；

(d9) ハロ(C₁-C₆) アルコキシ基；

(d15) ハロ(C₁-C₆) アルキルチオ基；

20

(d16) ハロ(C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；又は

(d17) ハロ(C₁-C₆) アルキルスルホニル基；を示す。

Aは、窒素原子を示し、A²、A³は、CH又は窒素原子を示し、A¹は、O、又はN-R⁵を示す(ここでR⁵は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基；を示す)。

mは0又は2を示し、nは1を示す。}で表される前記〔1〕に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

〔3〕 A¹が、Oである前記〔2〕に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

〔4〕 前記〔1〕～〔3〕のいずれか1項に記載の縮合複素環化合物又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

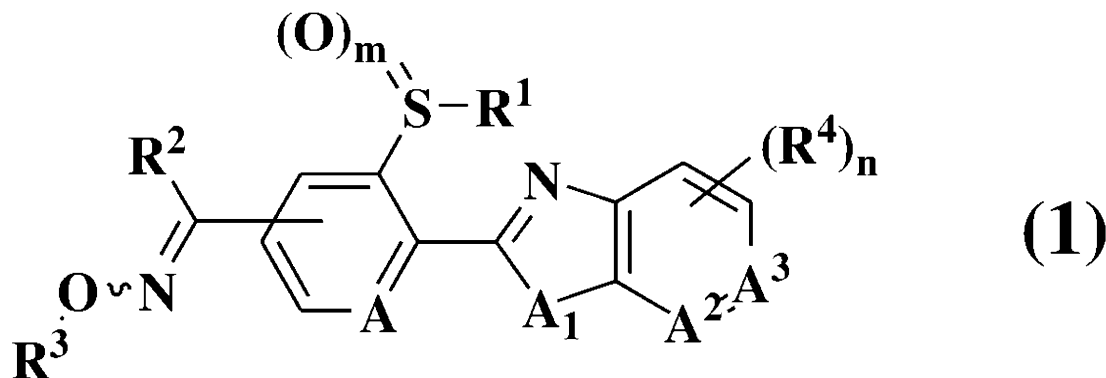
〔5〕 前記〔1〕～〔3〕のいずれか1項に記載の縮合複素環化合物又はその塩の有効量で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用法。

30

〔6〕 前記〔1〕～〔3〕のいずれか1項に記載の縮合複素環化合物又はその塩の有効量を有効成分として含有することを特徴とする動物用外部寄生虫防除剤。

〔7〕 一般式(1)

【化3】



40

(1)

{ 式中、

R¹は、

(a1) (C₁-C₆) アルキル基；

(a2) (C₃-C₆) シクロアルキル基；

50

(a3) (C₂-C₆) アルケニル基 ; 又は
 (a4) (C₂-C₆) アルキニル基 ; を示す。

R² は、

- (b1) 水素原子 ;
- (b2) (C₁-C₆) アルキル基 ;
- (b3) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ;
- (b4) ハロ (C₁-C₆) アルキル基 ; 又は
- (b5) アミノ基 ; を示す。

R³ は、

- (c1) 水素原子 ;
- (c2) (C₁-C₆) アルキル基 ;
- (c3) (C₂-C₆) アルケニル基 ;
- (c4) (C₂-C₆) アルキニル基 ;
- (c5) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ;
- (c6) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルキル基 ;
- (c7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基 ;
- (c8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基 ;
- (c9) ハロ (C₂-C₆) アルケニル基 ;
- (c10) ハロ (C₂-C₆) アルキニル基 ;

10

(c11) フェニル基 ;

20

(c12) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基 ;

(c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基 ;

(c14) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル (C₁-C₆) アルキル基 ;

30

(c15) (C₁-C₆) アルキルカルボニル基 ; 又は

(c16) (C₃-C₆) シクロアルキルカルボニル基 ;

を示す。

R⁴ は、

40

- (d1) ハロゲン原子 ;
- (d2) シアノ基 ;
- (d3) ニトロ基 ;
- (d4) (C₁-C₆) アルキル基 ;
- (d5) (C₁-C₆) アルコキシ基 ;
- (d6) (C₂-C₆) アルケニルオキシ基 ;
- (d7) (C₂-C₆) アルキニルオキシ基 ;
- (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基 ;
- (d9) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基 ;
- (d10) ハロ (C₂-C₆) アルケニルオキシ基 ;

50

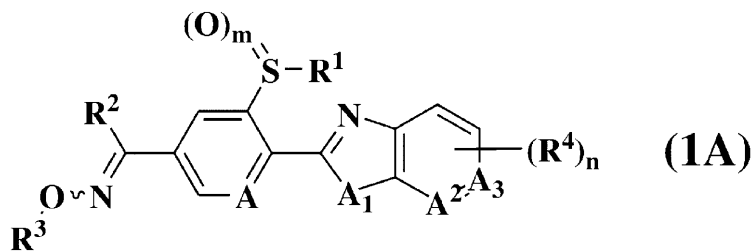
- (d11) 八口 (C₂-C₆) アルキニルオキシ基 ;
 (d12) (C₁-C₆) アルキルチオ基 ;
 (d13) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基 ;
 (d14) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基 ;
 (d15) 八口 (C₁-C₆) アルキルチオ基 ;
 (d16) 八口 (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基 ; 又は
 (d17) 八口 (C₁-C₆) アルキルスルホニル基 ; を示す。

A 及び A²、A³ は、C H 又は窒素原子を示し、A¹ は、O、S 又は N - R⁵ を示す (ここで R⁵ は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基 ; (e2) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ; (e3) (C₂-C₆) アルケニル基 ; 又は (e4) (C₂-C₆) アルキニル基 ; を示す)。

m は 0、1、又は 2 を示し、n は 0、1、又は 2 を示す。} で示される前記〔1〕に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

〔8〕一般式(1A)

【化4】



{ 式中、

R¹ は、

- (a1) (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (a2) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ;
 (a3) (C₂-C₆) アルケニル基 ; 又は
 (a4) (C₂-C₆) アルキニル基 ; を示す。

R² は、

- (b1) 水素原子 ;
 (b2) (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (b3) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ; 又は
 (b5) アミノ基 ; を示す。

R³ は、

- (c1) 水素原子 ;
 (c2) (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c3) (C₂-C₆) アルケニル基 ;
 (c4) (C₂-C₆) アルキニル基 ;
 (c5) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ;
 (c6) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c8) 八口 (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c9) 八口 (C₂-C₆) アルケニル基 ;
 (c10) 八口 (C₂-C₆) アルキニル基 ;
 (c11) フェニル基 ;

(c12) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)八口 (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)八口 (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)八口 (C₁-C

10

20

30

40

50

₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m) ハロ (C₁-C₆)
 アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o) ハロ (C₁-
 C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基；
 (c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基； 又は
 (c14) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) ホ
 ルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f) ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-
 C₆) アルコキシ基、(h) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアル
 キル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k) ハロ (C₁-C₆)
 アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m) ハロ (C₁-C₆)
 アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o) ハロ (C₁-
 C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル (C
₁-C₆) アルキル基；を示す。

10

R⁴ は、

- (d1) ハロゲン原子；
- (d2) シアノ基；
- (d3) ニトロ基；
- (d4) (C₁-C₆) アルキル基；
- (d5) (C₁-C₆) アルコキシ基；
- (d6) (C₂-C₆) アルケニルオキシ基；
- (d7) (C₂-C₆) アルキニルオキシ基；
- (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；
- (d9) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基；
- (d10) ハロ (C₂-C₆) アルケニルオキシ基；
- (d11) ハロ (C₂-C₆) アルキニルオキシ基；
- (d12) (C₁-C₆) アルキルチオ基；
- (d13) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基；
- (d14) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；
- (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基；
- (d16) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基； 又は
- (d17) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基；を示す。

20

A 及び A²、A³ は、C H、又は窒素原子を示し、A¹ は、O、S、又は N - R⁵ を示す
 (ここで R⁵ は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基；(e2) (C₃-C₆) シクロアルキル基
 ；(e3) (C₂-C₆) アルケニル基；又は(e4) (C₂-C₆) アルキニル基；を示す)。
 m は 0、1、又は 2 を示し、n は 0、1、又は 2 を示す。} で示される前記〔7〕に記載
 の縮合複素環化合物又はその塩。

30

〔9〕 R¹ が、

- (a1) (C₁-C₆) アルキル基；を示し、
R² が、
- (b1) 水素原子； 又は
- (b2) (C₁-C₆) アルキル基； を示し、
R³ が、
- (c1) 水素原子；
- (c2) (C₁-C₆) アルキル基；
- (c3) (C₂-C₆) アルケニル基；
- (c7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基；
- (c11) フェニル基； 又は
- (c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基；を示し、
R⁴ が、
- (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基； 又は
- (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基；を示し、

40

50

A 及び A²、A³ が、窒素原子を示し、A¹ が、N - R⁵ を示し（ここで R⁵ は、(e1) (C₁ - C₆) アルキル基；を示す)、m が 0、1、又は 2 を示し、n が 1 を示す前記〔8〕に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

〔10〕R¹ が、

(a1) (C₁ - C₆) アルキル基；を示し、
R² が、

(b1) 水素原子；又は

(b2) (C₁ - C₆) アルキル基；を示し、
R³ が、

(c1) 水素原子；

(c2) (C₁ - C₆) アルキル基；

(c3) (C₂ - C₆) アルケニル基；

(c7) (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル基；

(c11) フェニル基；又は

(c13) フェニル (C₁ - C₆) アルキル基；を示し、
R⁴ が、

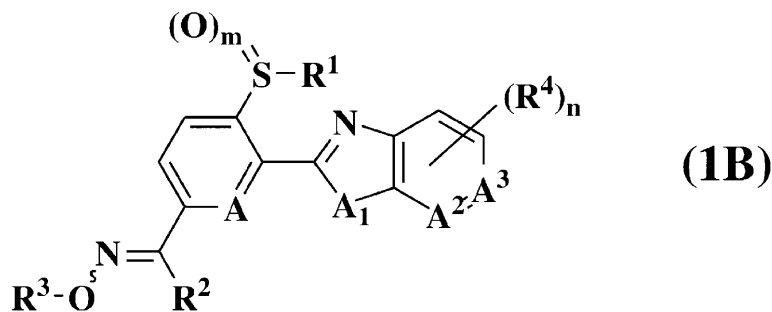
(d8) ハロ (C₁ - C₆) アルキル基；を示し、

A 及び A²、A³ が、窒素原子を示し、A¹ が、N - R⁵ を示し（ここで R⁵ は、(e1) (C₁ - C₆) アルキル基；を示す)、

m が 2 を示し、n が 1 を示す前記〔8〕又は〔9〕に記載の縮合複素環化合物又はその塩

。〔11〕一般式 (1B)

【化5】



{ 式中、

R¹ は、

(a1) (C₁ - C₆) アルキル基；

(a2) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；

(a3) (C₂ - C₆) アルケニル基；又は

(a4) (C₂ - C₆) アルキニル基；を示す。

R² は、

(b1) 水素原子；

(b2) (C₁ - C₆) アルキル基；

(b3) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；又は

(b5) アミノ基；を示す。

R³ は、

(c1) 水素原子；

(c2) (C₁ - C₆) アルキル基；

(c3) (C₂ - C₆) アルケニル基；

(c4) (C₂ - C₆) アルキニル基；

(c5) (C₃ - C₆) シクロアルキル基；

(c6) (C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルキル基；

10

20

30

40

50

- (c7) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (c9) ハロ (C₂-C₆) アルケニル基 ;
 (c10) ハロ (C₂-C₆) アルキニル基 ;
 (c11) フェニル基 ;
 (c12) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル基 ;
 (c13) フェニル (C₁-C₆) アルキル基 ; 又は
 (c14) 同一又は異なっても良く、(a)ハロゲン原子、(b)シアノ基、(c)ニトロ基、(d)ホルミル基、(e) (C₁-C₆) アルキル基、(f)ハロ (C₁-C₆) アルキル基、(g) (C₁-C₆) アルコキシ基、(h)ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ基、(j) (C₁-C₆) アルキルチオ基、(k)ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(l) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(m)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(n) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、又は(o)ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基から選択される 1 ~ 5 の置換基を環上に有するフェニル (C₁-C₆) アルキル基 ; を示す。

R⁴ は、

- (d1) ハロゲン原子 ;
 (d2) シアノ基 ;
 (d3) ニトロ基 ;
 (d4) (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (d5) (C₁-C₆) アルコキシ基 ;
 (d6) (C₂-C₆) アルケニルオキシ基 ;
 (d7) (C₂-C₆) アルキニルオキシ基 ;
 (d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基 ;
 (d9) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基 ;
 (d10) ハロ (C₂-C₆) アルケニルオキシ基 ;
 (d11) ハロ (C₂-C₆) アルキニルオキシ基 ;
 (d12) (C₁-C₆) アルキルチオ基 ;
 (d13) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基 ;
 (d14) (C₁-C₆) アルキルスルホニル基 ;
 (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基 ;
 (d16) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基 ; 又は
 (d17) ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基 ; を示す。

A 及び A²、A³ は、CH 又は窒素原子を示し、A¹ は、O、S、又は N - R⁵ を示す (ここで R⁵ は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基 ; (e2) (C₃-C₆) シクロアルキル基 ; (e3) (C₂-C₆) アルケニル基 ; 又は (e4) (C₂-C₆) アルキニル基 ; を示す)。
 m は 0、1、又は 2 を示し、n は 0、1、又は 2 を示す。} で示される前記〔7〕に記載の縮合複素環化合物又はその塩。

〔12〕 R¹ が、

- (a1) (C₁-C₆) アルキル基 ; を示し、
 R² が、
 (b1) 水素原子 ; 又は
 (b2) (C₁-C₆) アルキル基 ; を示し、
 R³ が、

- (c1)水素原子；
- (c2) (C₁-C₆) アルキル基；
- (c3) (C₂-C₆) アルケニル基；
- (c7) (C₁-C₆) アルコキシ(C₁-C₆) アルキル基；
- (c11) フェニル基；又は
- (c13) フェニル(C₁-C₆) アルキル基；を示し、
R⁴が、
- (d8) ハロ(C₁-C₆) アルキル基；又は
- (d15) ハロ(C₁-C₆) アルキルチオ基；を示し、
A及びA²、A³が、窒素原子を示し、A¹が、N-R⁵を示し(ここでR⁵は、(e1)
(C₁-C₆) アルキル基；を示す)、mが0、1、又は2を示し、nが1を示す前記〔1
1〕に記載の縮合複素環化合物又はその塩。
〔13〕R¹が、
- (a1) (C₁-C₆) アルキル基；を示し、
R²が、
- (b1) 水素原子；又は
- (b2) (C₁-C₆) アルキル基；を示し、
R³が、
- (c1)水素原子；
- (c2) (C₁-C₆) アルキル基；
- (c3) (C₂-C₆) アルケニル基；
- (c7) (C₁-C₆) アルコキシ(C₁-C₆) アルキル基；
- (c11) フェニル基；又は
- (c13) フェニル(C₁-C₆) アルキル基；を示し、
R⁴が、
- (d8) ハロ(C₁-C₆) アルキル基；を示し、
A及びA²、A³が、窒素原子を示し、A¹が、N-R⁵を示し(ここでR⁵は、(e1)
(C₁-C₆) アルキル基；を示す)、
mが2を示し、nが1を示す前記〔11〕又は〔12〕に記載の縮合複素環化合物又はそ
の塩。
- 〔14〕前記〔7〕～〔13〕のいずれかに記載の縮合複素環化合物又はその塩を有効成
分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。
- 〔15〕前記〔7〕～〔13〕のいずれかに記載の縮合複素環化合物又はその塩の有効量
で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用法。
- 〔16〕前記〔7〕～〔13〕のいずれかに記載の縮合複素環化合物又はその塩の有効量
を有効成分として含有することを特徴とする動物用外部寄生虫防除剤。
- 【発明の効果】
- 【0006】
- 本発明のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類は農園芸用殺虫剤として優
れた効果を有するだけでなく、犬や猫といった愛玩動物、又は牛や羊等の家畜に寄生する
害虫、白蟻等のその他の有害害虫に対しても効果を有する。
- 【発明を実施するための形態】
- 【0007】
- 本発明のオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類の一般式(1)の定義にお
いて、「ハロ」とは「ハロゲン原子」を意味し、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はフ
ッ素原子を示す。
- 【0008】
- 「(C₁-C₆) アルキル基」とは、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基
、イソプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャ
リーブチル基、ノルマルペンチル基、イソペンチル基、ターシャリーブチル基、ネオペ

10

20

30

40

50

ンチル基、2,3-ジメチルプロピル基、1-エチルプロピル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、ノルマルヘキシル基、イソヘキシル基、2-ヘキシル基、3-ヘキシル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、1,1,2-トリメチルプロピル基、3,3-ジメチルブチル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示す。

【0009】

「(C₃-C₆)シクロアルキル基」とは、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素原子数3~6個の環状のアルキル基を示し、「(C₁-C₆)アルコキシ基」としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基、ノルマルブトキシ基、セカンダリーブトキシ基、ターシャリーブトキシ基、ノルマルペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ターシャリーペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、2,3-ジメチルプロピルオキシ基、1-エチルプロピルオキシ基、1-メチルブチルオキシ基、ノルマルヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、1,1,2-トリメチルプロピルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルコキシ基を示し、「(C₂-C₆)アルケニルオキシ基」としては、例えば、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基、ペンテニルオキシ基、ヘキセニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルケニルオキシ基を示し、「(C₂-C₆)アルキニルオキシ基」としては、例えば、プロピニルオキシ基、ブチニルオキシ基、ペンチニルオキシ基、ヘキシニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニルオキシ基を示す。

【0010】

「(C₁-C₆)アルキルチオ基」としては、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ノルマルブチルチオ基、セカンダリーブチルチオ基、ターシャリーブチルチオ基、ノルマルペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ターシャリーペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、2,3-ジメチルプロピルチオ基、1-エチルプロピルチオ基、1-メチルブチルチオ基、ノルマルヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基、1,1,2-トリメチルプロピルチオ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルチオ基を示し、「(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基」としては、例えば、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ノルマルプロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ノルマルブチルスルフィニル基、セカンダリーブチルスルフィニル基、ターシャリーブチルスルフィニル基、ノルマルペンチルスルフィニル基、イソペンチルスルフィニル基、ターシャリーペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、2,3-ジメチルプロピルスルフィニル基、1-エチルプロピルスルフィニル基、1-メチルブチルスルフィニル基、ノルマルヘキシルスルフィニル基、イソヘキシルスルフィニル基、1,1,2-トリメチルプロピルスルフィニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルスルフィニル基を示し、「(C₁-C₆)アルキルスルホニル基」としては、例えば、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ノルマルプロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ノルマルブチルスルホニル基、セカンダリーブチルスルホニル基、ターシャリーブチルスルホニル基、ノルマルペンチルスルホニル基、イソペンチルスルホニル基、ターシャリーペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、2,3-ジメチルプロピルスルホニル基、1-エチルプロピルスルホニル基、1-メチルブチルスルホニル基、ノルマルヘキシルスルホニル基、イソヘキシルスルホニル基、1,1,2-トリメチルプロピルスルホニル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルスルホニル基を示す。

【0011】

上記「(C₁-C₆)アルキル基」、「(C₂-C₆)アルケニル基」、「(C₂-C₆)アルキニル基」、「(C₃-C₆)シクロアルキル基」、「(C₃-C₆)シクロアルキルオキシ基」、「(C₁-C₆)アルコキシ基」、「(C₂-C₆)アルケニルオキシ基」、「(C₂-C₆)アルキニルオキシ基」、「(C₁-C₆)アルキルチオ基」、「(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基」、「(C₁-C₆)アルキルスルホニル基」

、「(C₂-C₆)アルケニルチオ基」、「(C₂-C₆)アルキニルチオ基」、「(C₂-C₆)アルケニルスルフィニル基」、「(C₂-C₆)アルキニルスルフィニル基」、「(C₂-C₆)アルケニルスルホニル基」、「(C₂-C₆)アルキニルスルホニル基」、「(C₃-C₆)シクロアルキルチオ基」、「(C₃-C₆)シクロアルキルスルフィニル基」又は「(C₃-C₆)シクロアルキルスルホニル基」の置換し得る位置に1又は2以上のハロゲン原子が置換されていても良く、置換されるハロゲン原子が2以上の場合は、ハロゲン原子は同一又は異なっても良い。

【0012】

上記1又は2以上のハロゲン原子が置換された置換基は、それぞれ、「ハロ(C₁-C₆)アルキル基」、「ハロ(C₂-C₆)アルケニル基」、「ハロ(C₂-C₆)アルキニル基」、「ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル基」、「ハロ(C₃-C₆)シクロアルキルオキシ基」、「ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基」、「ハロ(C₂-C₆)アルケニルオキシ基」、「ハロ(C₂-C₆)アルキニルオキシ基」、「ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基」、「ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基」、「ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基」、「ハロ(C₂-C₆)アルケニルチオ基」、「ハロ(C₂-C₆)アルキニルチオ基」、「ハロ(C₂-C₆)アルケニルスルフィニル基」、「ハロ(C₂-C₆)アルケニルスルホニル基」、「ハロ(C₂-C₆)アルキニルスルホニル基」、「ハロ(C₃-C₆)シクロアルキルチオ基」、「ハロ(C₃-C₆)シクロアルキルスルフィニル基」又は「ハロ(C₃-C₆)シクロアルキルスルホニル基」を示す。本発明における置換基自体の意義及び例示はいずれも、当該技術分野において当業者にとって自明のものである。

【0013】

「(C₁-C₆)」、「(C₂-C₆)」、「(C₃-C₆)」等の表現は各種置換基の炭素原子数の範囲を示す。更に、上記置換基が連結した基についても上記定義を示すことができ、例えば、「(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルキル基」の場合は直鎖又は分岐鎖状の炭素数1~6個のアルコキシ基が直鎖又は分岐鎖状の炭素数1~6個のアルキル基に結合していることを示す。

【0014】

本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、トリメチルアンモニウム等の無機又は有機の塩基との塩類を例示することができる。

【0015】

本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物及びその塩類は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉中心を有する場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(1)で表される化合物及びその塩類は、その構造式中に炭素-炭素二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。本発明の化合物はオキシム基によるシン異性体(Z異性体)とアンチ異性体(E異性体)があるが、本発明はいずれの異性体であってもよく、また、それらの任意の割合の異性体混合物であってもよい。

【0016】

本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類において、一般式(1)中、

R¹は、(a1)(C₁-C₆)アルキル基を示し、

R²は、(b1)水素原子；(b2)(C₁-C₆)アルキル基；又は(b5)アミノ基；を示し、

R³は、(c1)水素原子；(c2)(C₁-C₆)アルキル基；(c4)(C₂-C₆)アルキニル基；(c6)(C₃-C₆)シクロアルキル(C₁-C₆)アルキル基；(c8)ハロ(C₁-C

10

20

30

40

50

₆) アルキル基; (c15) (C₁-C₆) アルキルカルボニル基; 又は(c16) (C₃-C₆) シクロアルキルカルボニル基; を示し、

R⁴ は、(d8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基; 又は (d15) ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基; を示し、

A 及び A²、A³ は、CH、又は窒素原子を示し、A¹ は、O、又はN-R⁵を示し(ここでR⁵は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基を示す)、mは1、又は2を示し、nは1を示すことが好ましい。

本発明の一般式(1A)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類において、一般式(1A)中、

R¹ は、(a1) (C₁-C₆) アルキル基を示し、

10

R² は、(b1) 水素原子; 又は(b5) アミノ基; を示し、

R³ は、(c1) 水素原子; (c2) (C₁-C₆) アルキル基; (c4) (C₂-C₆) アルキニル基; (c6) (C₃-C₆) シクロアルキル(C₁-C₆) アルキル基; (c8) ハロ(C₁-C₆) アルキル基; を示し、

R⁴ は、(d8) ハロ(C₁-C₆) アルキル基; 又は (d15) ハロ(C₁-C₆) アルキルチオ基; を示し、

A 及び A²、A³ は、CH、又は窒素原子を示し、A¹ は、O、又はN-R⁵を示し(ここでR⁵は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基を示す)、mは1、又は2を示し、nは1を示すことが好ましい。

本発明の一般式(1B)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類において、一般式(1B)中、

20

R¹ は、(a1) (C₁-C₆) アルキル基を示し、

R² は、(b1) 水素原子; (b2) (C₁-C₆) アルキル基; 又は(b5) アミノ基; を示し、

R³ は、(c1) 水素原子; (c2) (C₁-C₆) アルキル基; (c4) (C₂-C₆) アルキニル基; (c6) (C₃-C₆) シクロアルキル(C₁-C₆) アルキル基; (c8) ハロ(C₁-C₆) アルキル基; を示し、

R⁴ は、(d8) ハロ(C₁-C₆) アルキル基; 又は (d15) ハロ(C₁-C₆) アルキルチオ基; を示し、

A 及び A²、A³ は、CH又は窒素原子を示し、A¹ は、O、又はN-R⁵を示し(ここでR⁵は、(e1) (C₁-C₆) アルキル基を示す)、mは1、又は2を示し、nは1を示すことが好ましい。

30

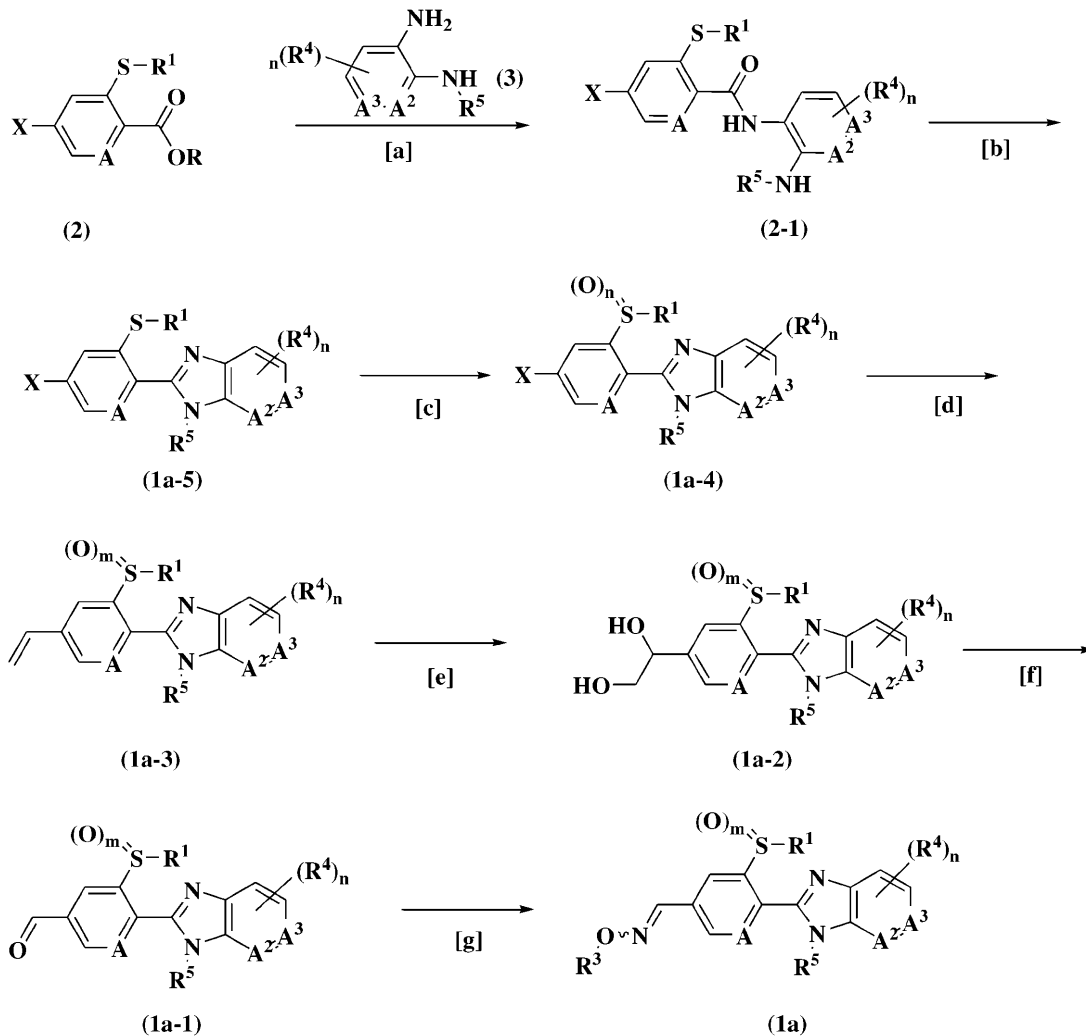
【0017】

本発明の縮合複素環化合物又はその塩類は、例えば下記製造方法によって製造することができるが、本発明はこれらに限定されるものではない。本発明で用いられる化合物は公知方法又は自体公知の方法によって製造される。

【0018】

製造方法1

【化6】



10

20

{式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 A 、 A^2 、 A^3 、 m 及び n は前記と同じであって、 X は、例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子を示す(本明細書を通じて同意義)。 R は例えばメチル基、エチル基等の $C_1 \sim C_3$ のアルキル基を示す。}

30

【0019】

工程 [a] の製造方法

一般式 (2) で表されるカルボン酸エステルと一般式 (3) で表される化合物とを塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより一般式 (2 - 1) で表されるアミド化合物を製造することができる。

【0020】

本反応で使用することができる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属ヒドライド類、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム *t*-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデック-7-エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式 (3) で表される化合物に対して通常1倍モル~10倍モルの範囲で使用される。

40

【0021】

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロ

50

ロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独又は2種以上混合して使用することができる。

【0022】

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

10

【0023】

工程 [b] の製造方法

一般式 (1 a 5) で表される縮合複素環化合物は、一般式 (2 1) で表されるアミド化合物を、酸と、不活性溶媒の存在下、反応させることにより製造することができる。

【0024】

本反応で使用する酸としては、例えば、塩酸、硫酸、硝酸等の無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、安息香酸等の有機酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等のスルホン酸、リン酸等を例示することができ、その使用量は一般式 (2 1) で表されるアミド化合物に対して 0.01 倍モル～10 倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

20

【0025】

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独又は2種以上混合して使用することができる。

30

【0026】

反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

40

【0027】

工程 [c] の製造方法

一般式 (1 a 4) で表される縮合複素環化合物は、一般式 (1 a 5) で表される縮合複素環化合物を、不活性溶媒中、酸化剤と反応させることにより製造することができる。

【0028】

本反応で使用する酸化剤としては、過酸化水素水、過安息香酸、m-クロル過安息香酸などの過酸化物などが挙げられる。これら酸化剤は、一般式 (1 a 5) で表される縮合複素環化合物類に対して1倍モル～5倍モルの範囲で適宜選択することができる。

【0029】

50

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸エチル等のエステル類、蟻酸、酢酸等の有機酸類、N, N ジメチルホルムアミド、N, N ジメチルアセトアミド、1, 3 ジメチル 2 イミダゾリジノン、水等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

【0030】

本反応における反応温度は - 10 から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分～48時間の範囲で適宜選択すればよい。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

10

【0031】

工程 [d] の製造方法

一般式 (1 a 3) で表される縮合複素環化合物は、一般式 (1 a 4) で表される縮合複素環化合物とビニルホウ酸化合物とを金属触媒並びに、塩基の存在下、不活性溶媒中にて、クロスカップリング反応を行い、製造することができる。

【0032】

本反応で使用することができる金属触媒としては、例えば、パラジウム触媒、ニッケル触媒、鉄触媒、ルテニウム触媒、白金触媒、ロジウム触媒、イリジウム触媒等を列挙することができる。これらの金属触媒は、「金属」、「担持金属」、「金属の塩化物、臭化物、ヨウ化物、硝酸塩、硫酸塩、炭酸塩、シュウ酸塩、酢酸塩または酸化物等の金属塩」、「オレフィン錯体、ホスフィン錯体、アミン錯体、アンミン錯体又はアセチルアセトナート錯体等の錯化合物」を用いることができる。好ましくはパラジウム触媒である。

20

【0033】

パラジウム触媒としては、パラジウム黒、パラジウムスポンジ等のパラジウム金属が例示でき、また、パラジウム/アルミナ、パラジウム/炭素、パラジウム/シリカ、パラジウム/Y型ゼオライト等の担持パラジウム金属も例示できる。また、塩化パラジウム、臭化パラジウム、ヨウ化パラジウム、酢酸パラジウム等の金属塩を例示できる。さらに、
- アリルパラジウムクロリドダイマー、パラジウムアセチルアセトナート、ジクロロビス(アセトニトリル)パラジウム、ジクロロビス(ベンゾニトリル)パラジウム、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(クロロホルム付加物)、ジクロロジアミンパラジウム、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリシクロヘキシルホスフィン)パラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロ[1, 2-ビス(ジフェニルホスフィノ)エタン]パラジウム、ジクロロ[1, 3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン]パラジウム、ジクロロ[1, 4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン]パラジウム、ジクロロ[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム、ジフェニルホスフィノフェロセンジクロロパラジウム・ジクロロメタン錯体等の錯化合物を例示できる。

30

40

【0034】

これらのパラジウム触媒は単独で使用しても良いが、さらに三級ホスフィンと組み合わせて使用しても良い。使用することのできる三級ホスフィンとしては、トリフェニルホスフィン、トリメチルホスフィン、トリエチルホスフィン、トリブチルホスフィン、トリ(tert-ブチル)ホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン、トリ-o-トリルホスフィン、トリオクチルホスフィン、9, 9-ジメチル-4, 5-ビス(ジフェニルホスフィノ)キサンテン、2-(ジ-tert-ブチルホスフィノ)ピフェニル、2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)ピフェニル、1, 2-ビス(ジフェニルホスフィノ)エタン、1,

50

3 - ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン、1, 4 - ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン、1, 1' - ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン、(R) - (+) - 2, 2' - ビス(ジフェニルホスフィノ) - 1, 1' - ビナフチル、(S) - (-) - 2, 2' - ビス(ジフェニルホスフィノ) - 1, 1' - ビナフチル、(±) - 2, 2' - ビス(ジフェニルホスフィノ) - 1, 1' - ビナフチル等が例示できる。

【0035】

本反応で使用することができるビニルホウ酸化合物としては、臭化ビニルマグネシウム、塩化ビニルマグネシウム、塩化ビニル亜鉛、トリブチルビニルスズ、ビニルトリフルオロホウ酸カリウム、ビニルホウ酸、ビニルホウ酸無水物、ビニルホウ酸2 - メチル - 2, 4 - ペンタンジオールエステル、ビニルホウ酸ピナコールエステル、トリエトキシビニルシラン等を例示することができる。

10

【0036】

本反応で使用できる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化アルカリ金属、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルコキシド類が挙げられる。塩基の使用量は一般式(1-4)で表される縮合複素環化合物に対して通常約1倍モル~5倍モルの範囲で使用できる。

【0037】

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2 - プロパノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン(DME)等の鎖状又は環状エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸エチル等のエステル類、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリジノン等の極性溶媒及び水を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

20

【0038】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分~48時間の範囲で適宜選択すれば良い。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

30

【0039】

工程[e]の製造方法

一般式(1a-2)で表されるジオール縮合複素環化合物は、一般式(1a-3)で表されるビニル縮合複素環化合物を四酸化オスミウムと酸化剤の存在下、第4版実験化学講座23、有機化学V、酸化反応(丸善株式会社)に記載してある方法に従って製造することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

40

【0040】

工程[f]の製造方法

一般式(1a-1)で表されるホルミル縮合複素環化合物は、一般式(1a-2)で表されるジオール縮合複素環化合物と過ヨウ素酸化合物を、不活性溶媒の存在下、新実験化学講座15、酸化と還元I-1(丸善株式会社)に記載してある方法に従って反応させ製造することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれ

50

ば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0041】

工程 [g] の製造方法

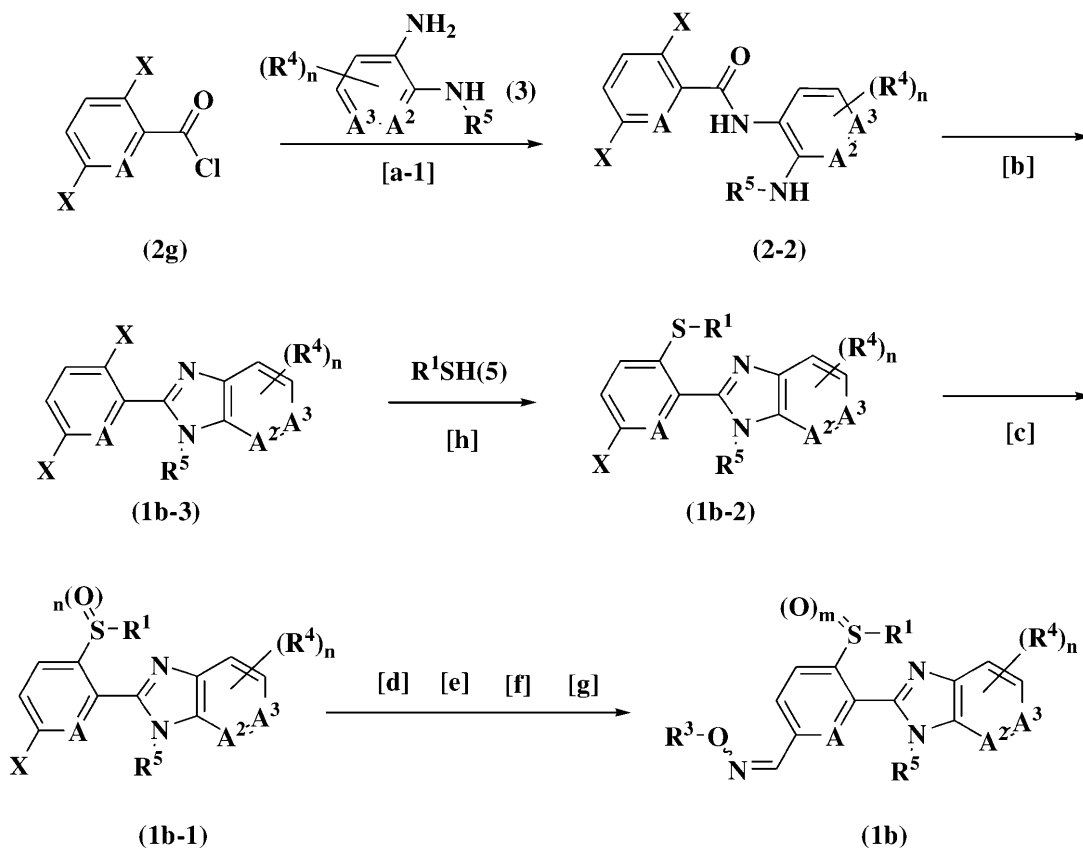
一般式 (1 a) で表されるオキシム縮合複素環化合物は、一般式 (1 a - 1) で表されるホルミルイミダゾピリダジン化合物を、ORGANIC FUNCTIONAL GROUP PREPARATIONS III 2nd edition ACADEMIC PRESS, INC. に記載された方法に従ってホルミル基をオキシム基に変換することにより製造することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

10

【0042】

製造方法 2

【化 7】



20

30

{ 式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 A 、 A^2 、 A^3 、 m 及び n は前記と同じであって、 X はハロゲン原子を示す。 }

【0043】

工程 [a - 1] の製造方法

一般式 (2 2) で表されるアミド化合物は、有機合成で使用される通常方法によって対応するカルボン酸から誘導した一般式 (2 g) で表されるカルボン酸クロリドと一般式 (3) で表される化合物とを塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより一般式 (2 2) で表されるアミド化合物を製造することができる。

【0044】

本反応で使用することができる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属ヒドライド類、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム t - ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド

50

等のアルカリ金属アルコキシド類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデック-7-エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式(2g)で表される化合物に対して通常1倍モル～10倍モルの範囲で使用される。

【0045】

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独又は2種以上混合して使用することができる。

10

【0046】

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

20

【0047】

工程[b]の製造方法

一般式(1b-3)で表される化合物は、一般式(2-2)で表されるアミド化合物を、上記製造方法1の工程[b]に記載した方法に従って製造することができる。

【0048】

工程[h]の製造方法

一般式(1b-2)で表される化合物は、一般式(1b-3)で表される化合物を、R¹SHと反応させることによって製造することができる(詳しくは、下記中間体(2)の製造方法参照)。

30

【0049】

工程[c]の製造方法

一般式(1b-1)で表される化合物は、一般式(1b-2)で表される化合物を、上記製造方法1の工程[c]に記載した方法に従って製造することができる。

【0050】

工程[d][e][f][g]の製造方法

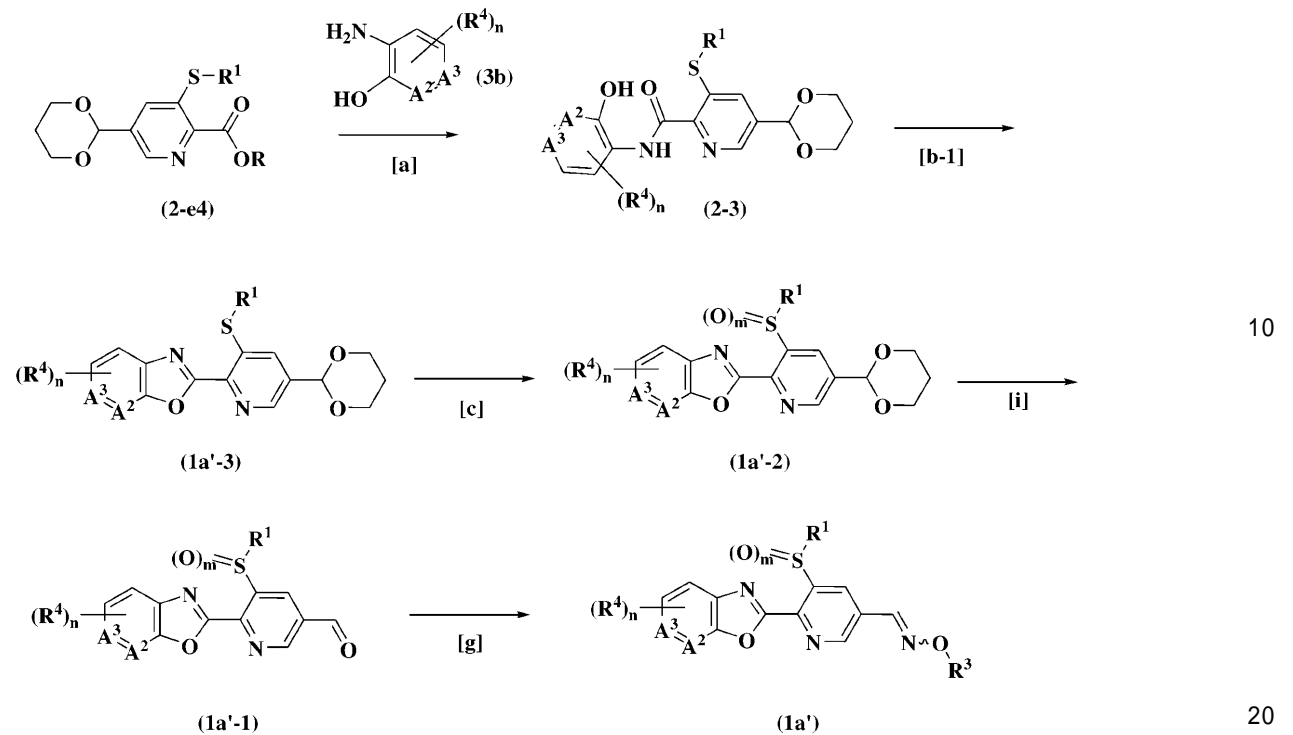
一般式(1b)で表される化合物は、一般式(1b-1)で表される化合物を、上記製造方法1の工程[d][e][f][g]に記載した方法に従って製造することができる。

40

【0051】

製造方法3

【化 8】



{ 式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R 、 A^2 、 A^3 、 m 及び n は前記と同じ。 }

【 0 0 5 2 】

工程 [a] の製造方法

一般式 (2 3) で表される化合物は、一般式 (2 e 4) で表わされる化合物と一般式 (3 b) で表わされる化合物から、前述の製造方法 1 に記載した工程 [a] に記載した製造方法に従って製造することができる。

【 0 0 5 3 】

工程 [b - 1] の製造方法

一般式 (1 a ' 3) で表される化合物は、一般式 (2 3) で表される化合物を上記製造方法 1 に記載した工程 [b] に記載した製造方法に従って、または、不活性溶媒の存在下、*Synthesis* 1981, 1 に記載された方法に従って (好ましくはアゾジカルボン酸ジエステル類、及びトリフェニルホスフィンを使用して) 製造することができる。

【 0 0 5 4 】

工程 [c] の製造方法

一般式 (1 a ' 2) で表される化合物は、一般式 (1 a ' 3) で表される化合物を、上記製造方法 1 の工程 [c] に記載した方法で製造することができる。

【 0 0 5 5 】

工程 [i] の製造方法

一般式 (1 a ' 1) で表される化合物は、一般式 (1 a ' 2) で表される化合物を、*Greene's Protective Groups in Organic Synthesis* (4 th Edition) に記載の方法により、脱保護することにより、製造することができる。

【 0 0 5 6 】

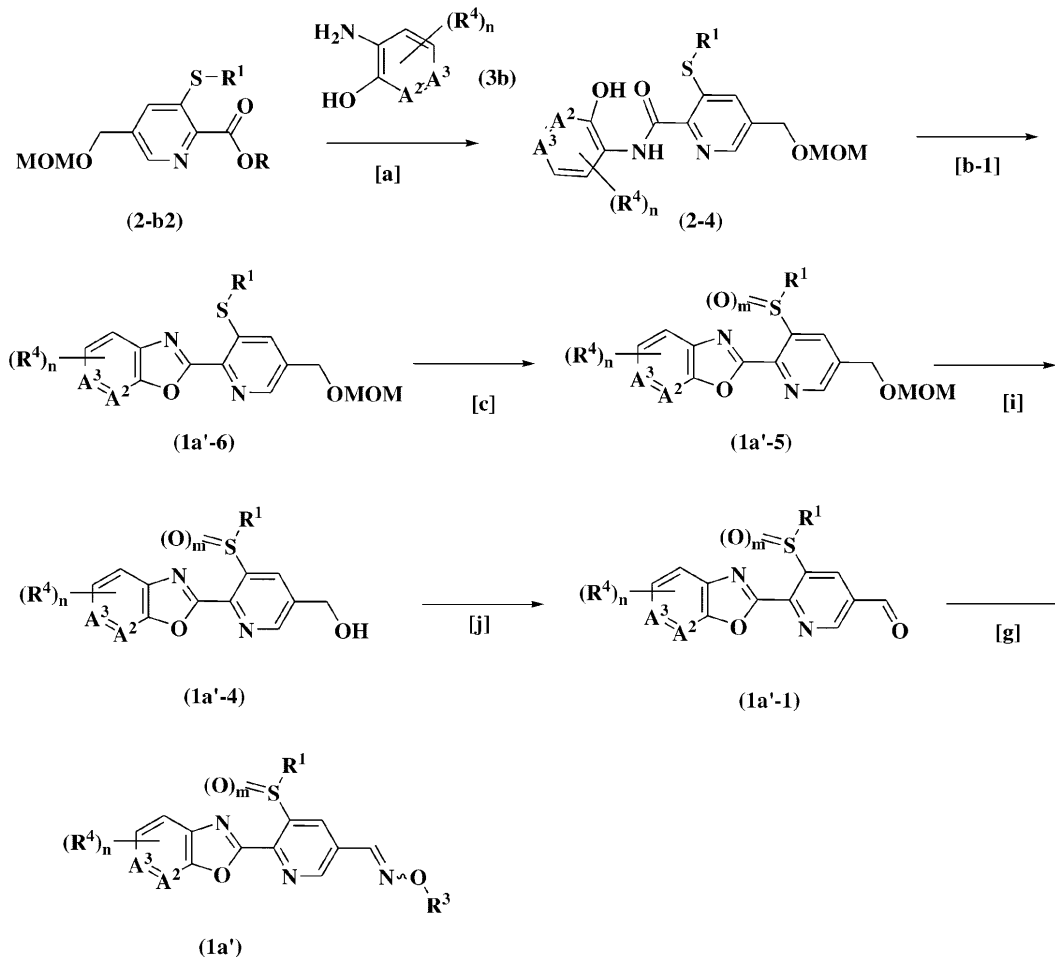
工程 [g] の製造方法

一般式 (1 a ') で表される化合物は、一般式 (1 a ' 1) で表される化合物を、上記製造方法 1 の工程 [g] に記載した方法で製造することができる。

【 0 0 5 7 】

製造方法 4

【化9】



10

20

{ 式中、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R 、 A^2 、 A^3 、 m 及び n は前記と同じ。MOMはメトキシメチルを意味する。 }

【0058】

30

工程 [a] の製造方法

一般式 (2 4) で表される化合物は、一般式 (2 b 2) で表わされる化合物と一般式 (3 b) で表わされる化合物とを、前述の製造方法 1 に記載した工程 [a] に記載した製造方法に従って製造することができる。

【0059】

工程 [b - 1] の製造方法

一般式 (1 a ' 6) で表される化合物は、一般式 (2 4) で表される化合物を上記製造方法 1 に記載した工程 [b] に記載した製造方法に従って、または、不活性溶媒の存在下、Synthesis 1981, 1 に記載された方法に従って (好ましくはアゾジカルボン酸ジエステル類、及びトリフェニルホスフィン) 製造することができる。

40

【0060】

工程 [c] の製造方法

一般式 (1 a ' 5) で表される化合物は、一般式 (1 a ' 6) で表される化合物を、上記製造方法 1 の工程 [c] に記載した方法で製造することができる。

【0061】

工程 [i] の製造方法

一般式 (1 a ' 4) で表される化合物は、一般式 (1 a ' 5) で表される化合物を、Greene's Protective GROUPS in Organic SYNT HESIS (4 th Edition) に記載の方法により、脱保護することにより、製造することができる。

50

【 0 0 6 2 】

工程 [j] の製造方法

一般式 (1 a ' 1) で表される化合物は、一般式 (1 a ' 4) で表される化合物を、*Synthesis* 1996, 1153 に記載された方法でヒドロキシメチル基をホルミル基に変じることによって製造することができる。

【 0 0 6 3 】

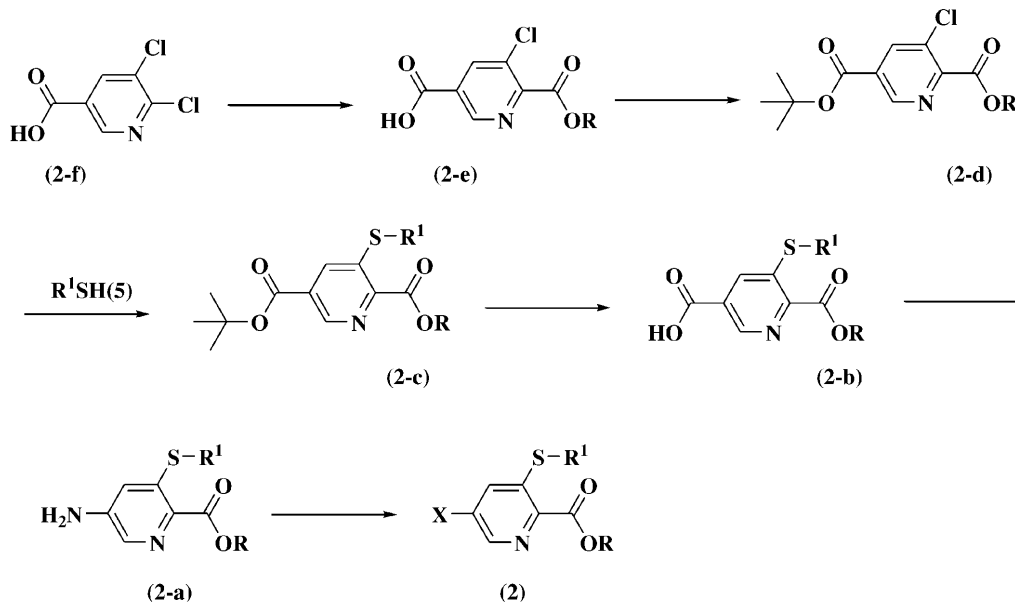
工程 [g] の製造方法

一般式 (1 a ') で表される化合物は、一般式 (1 a ' 1) で表される化合物を、上記製造方法 1 の工程 [g] に記載した方法でホルミル基をオキシム基に変じることによって製造することができる。

【 0 0 6 4 】

中間体 (2) の製造方法

【 化 1 0 】



(式中、 R^1 は前記と同じ意味であり、 R は例えば $C_1 \sim C_3$ のアルキル基等のエステル形成基を示し、 X はハロゲン原子を示す。)

【 0 0 6 5 】

一般式 (2) で表わされる本発明化合物の製造中間体は、以下の方法により製造することができる。

【 0 0 6 6 】

入手可能なジクロロピリジン 3 - カルボン酸 (2 - f) を特開 2 0 0 5 - 2 7 2 3 3 8 号に記載された方法 (ヘック反応) に従って、6 位にエステル基が導入されたピリジン - 3 - カルボン酸 (2 - e) を合成することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、所望により再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【 0 0 6 7 】

ピリジン 2 , 6 - ジカルボン酸エステル (2 - d) は、通常の合成法に従って、先ずエステル基が導入されたピリジン - 3 - カルボン酸 (2 - e) と塩素化剤とを不活性溶媒下、反応させることにより、ピリジンカルボン酸クロリド体に誘導し、その後ターシャリーブチルアルコールと反応させることにより製造することができる。

【 0 0 6 8 】

ピリジンジカルボン酸エステル (2 - c) は、一般式 (2 - d) で表されるピリジンジカルボン酸エステル化合物と一般式 (5) で表わされるチオール化合物とを塩基、及び不活性溶媒下、反応させることにより、製造することができる。

【0069】

本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム t-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデック-7-エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式(2-d)で表されるピリジンジカルボン酸エステル化合物に対して通常1倍モル~10倍モルの範囲で使用される。また一般式(5)で表わされる化合物のアルカリ塩を使用する場合は、塩基を使用しなくてもよい。

10

【0070】

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

20

【0071】

本反応は等モル反応であるので、一般式(5)で表わされる化合物と一般式(2-d)で表されるピリジンジカルボン酸エステル化合物を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は10℃から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分~48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0072】

ピリジンジカルボン酸(2-b)は、一般式(2-c)で表されるピリジンジカルボン酸エステル化合物を酸及び/又は不活性溶媒下、加水分解させることにより製造することができる。

30

【0073】

本反応で使用する酸としては、例えば、塩酸、硫酸、硝酸等の無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、安息香酸等の有機酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等のスルホン酸等を例示することができ、その使用量は一般式(2-c)で表されるピリジンジカルボン酸エステル化合物に対して1倍モル~10倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。場合によっては、当該酸類を溶媒として使用することもできる。

【0074】

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン等の極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。また前記酸類を溶媒として使用する場合は溶媒を使用しなくてもよい。

40

50

【 0 0 7 5 】

反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【 0 0 7 6 】

アミノピリジンカルボン酸エステル(2 a)は、J. A. Chem. Soc. 1972, 94, 6203-6205に記載の方法に従って、一般式(2 b)で表されるピリジンカルボン酸とDPPA(ジフェニルリン酸アジド)とを、塩基、ターシャリーブチルアルコール存在下、反応させ、ついで酸性条件下、加水分解をすることにより製造することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

10

【 0 0 7 7 】

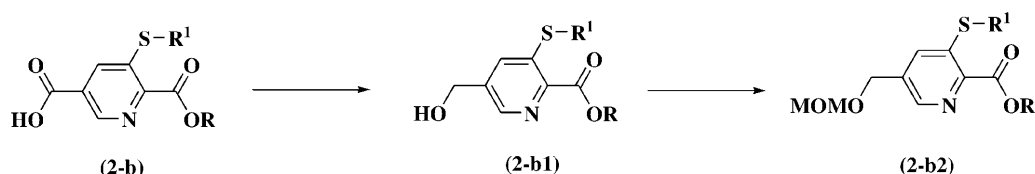
ハロピリジンカルボン酸エステル(2)は、一般式(2 a)で表わされるアミノピリジンカルボン酸エステルを、Sandmeyer反応、即ちChem. Rev. 1988, 88, 765に記載された方法に従って製造することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

20

【 0 0 7 8 】

中間体(2 b 2)の製造方法

【 化 1 1 】



(式中、R1とRは前記と同意義。)

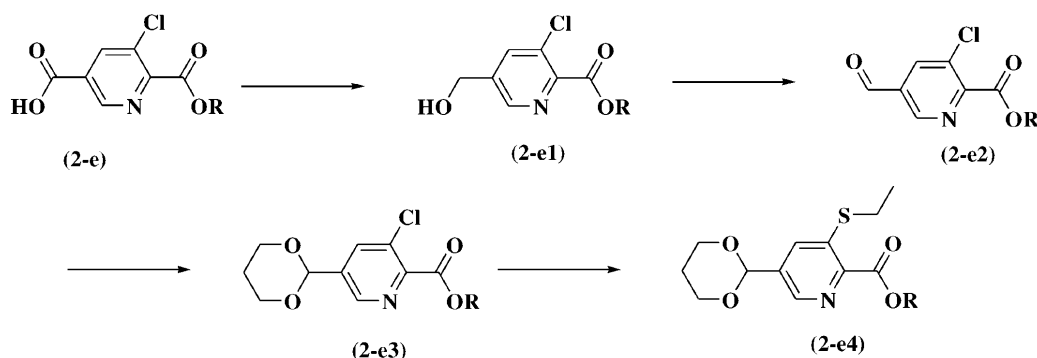
30

上記中間体の製造方法で製造した一般式(2 b)を、国際公開第2014/068988号パンフレットに記載の還元方法により、一般式(2 b1)を製造することができる。更に、当該化合物を、Greene's Protective GROUPS in Organic SYNTHESIS(4th Edition)に記載の方法により、一般式(2 b2)を製造することができる。

【 0 0 7 9 】

中間体(2 e 4)の製造方法

【 化 1 2 】



40

【 0 0 8 0 】

Rは、C₁～C₃のアルキル基を示す。

50

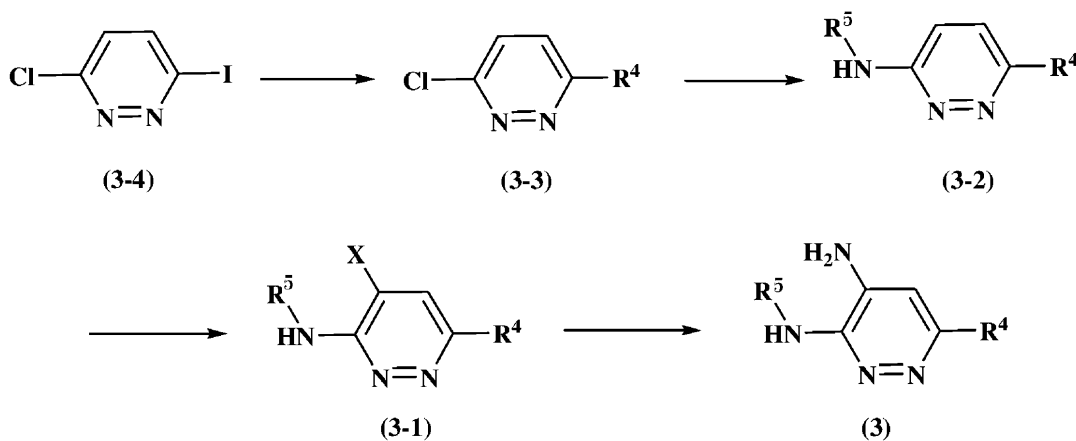
上記中間体の製造方法で製造した一般式(2 e)を、有機合成で使用する通常方法によって対応するカルボン酸からカルボン酸クロリドに誘導したのち、水素化ホウ素ナトリウム(NaBH_4)で還元することにより、一般式(2 e1)で表わされるアルコール化合物を製造することができる。そして当該(2 e1)を、所謂Swern酸化{DMSO(ジメチルスルホキシド)と塩化オキサリルを使用する}により一般式(2 e2)で表わされるアルデヒド化合物に誘導した後、Greene's Protective GROUPS in Organic SYNTHESIS(4th Edition)に記載の方法により、一般式(2 e3)で表わされる環状アセタール化合物を製造することができる。

当該アセタール化合物を、上記中間体の製造方法に記載した一般式(2 c)の製造方法と同様な方法により一般式(2 e4)で表わされる化合物を製造することができる。

【0081】

中間体(3)の製造方法

【化13】



(式中、 R^4 及び R^5 は前記と同じ意味であり、 X はハロゲン原子を示す。)

【0082】

本発明化合物の製造中間体である一般式(3)は、以下の方法により製造することができる。

【0083】

まず、文献記載の方法(Tetrahedron 1999, 55, 15067)により製造した一般式(3-4)で表されるヨードピリダジン化合物と例えばヨードアルキル類等のヨード化合物とを、金属触媒、塩基及び不活性溶媒存在下、文献記載の方法(有機合成化学協会誌 Vol.69 No.7 2011; Chem. Rev. 2011, 4475; WO2013/018928号パンフレット)に従ってクロスカップリング反応を行い、一般式(3-3)で表されるピリダジン化合物を製造することができる。

【0084】

本反応で使用することができる触媒としては入手可能な0価または2価のパラジウム金属や塩(錯体を含む)などのパラジウム化合物を用いる事ができ、活性炭などに担持されても良い。好ましく用いられる物として、パラジウム(0)/炭素、酢酸パラジウム(II)、塩化パラジウム(II)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)クロリド、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)等を挙げる事ができる。

【0085】

本反応は配位子を加えて反応を行うこともできる。配位子としては、トリフェニルホスフィン(PPh_3)、メチルジフェニルホスフィン(Ph_2PCH_3)、トリフリルホスフィン($\text{P}(\text{2-furyl})_3$)、トリ(o-トリル)ホスフィン($\text{P}(\text{o-tol})_3$)、トリ(シクロヘキシル)ホスフィン(PCy_3)、ジシクロヘキシルフェニルホスフィン(PhPCy_2)、トリ(t-ブチル)ホスフィン(P^tBu_3)、2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ピナフ

10

20

30

40

50

チル (BINAP)、ジフェニルホスフィノフェロセン (DPPF)、1, 1'-ビス(ジ-t-ブチルホスフィノ)フェロセン (D^tBPF)、N, N-ジメチル-1-[2-(ジフェニルホスフィノ)フェロセニル]エチルアミン、1-[2-(ジフェニルホスフィノ)フェロセニル]エチルメチルエーテル、Xantphos等のホスフィン系配位子や、イミダゾール-2-イリデンカルベン類等のホスフィンミック配位子(アンゲバンテ・ケミー・インターナショナル・エディション・イン・イングリッシュ (Angewandte Chemie International Edition in English) 第36巻、第2163頁(1997年)参照)等が挙げられる。

【0086】

本発明で使用できる塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化物、炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸セシウム等の炭酸塩、酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩、ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド等、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属ヒドリド類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。塩基の使用量としては、一般式(3-4)で表される化合物に対して1倍モル~5.0倍モルの範囲から適宜選択すればよい。

10

【0087】

本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分~48時間の範囲で適宜選択すればよい。

20

【0088】

一般式(3-2)で表されるアミノピリダジン化合物は、一般式(3-3)で表されるピリダジン化合物とアミノ化合物(R^5NH_2)とを反応することにより製造することができる。

【0089】

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサソ、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

30

【0090】

必要に応じて塩基を使用しても良く、塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウムt-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザピシクロ[5.4.0]ウンデック-7-エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式(3-3)で表される化合物に対して通常1倍モル~10倍モルの範囲で使用される。

40

【0091】

本反応における反応温度は-10 から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分~48時間の範囲で適宜選択すればよい。アミノ化合物(R^5NH_2)は、一般式(3-3)で表されるピリダジン化合物に対して、1倍モル~5倍モルの範囲で適宜選択すること

50

ができる。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0092】

一般式(3-1)で表されるハロピリダジン化合物は、一般式(3-2)で表されるアミノピリダジン化合物をハロゲン化剤と反応することにより製造することができる。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンの鎖状又は環状エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、水、酢酸等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

10

【0093】

反応に用いられるハロゲン化剤としては、例えば、塩素、臭素、ヨウ素のハロゲン分子、NCS, NBS等のハロゲン化スクシンイミド類、DIH等のハロゲン化ヒダントイン類、塩化チオニル等が挙げられる。

本反応における反応温度は-30 から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分～48時間の範囲で適宜選択すればよい。

20

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0094】

アミノピリダジン化合物(3)は、一般式(3-1)で表されるハロピリダジン化合物を銅触媒及び溶媒存在下、アンモニアと反応させることにより製造することができる。

【0095】

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。本反応で使用できる銅触媒は、酸化銅、臭化銅、塩化銅等を使用することができる。該使用量は、一般式(3-1)で表されるハロピリダジン化合物に対して1倍モル～5倍モルの範囲で適宜選択することができる。

30

【0096】

本反応における反応温度は-10 から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分から48時間の範囲で適宜選択すればよい。アンモニアは、一般式(3-1)で表されるハロピリダジン化合物に対して、1倍モルから5倍モルの範囲で適宜選択することができる。また効率的に反応を進行させるため、オートクレーブを使用することができる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

40

【0097】

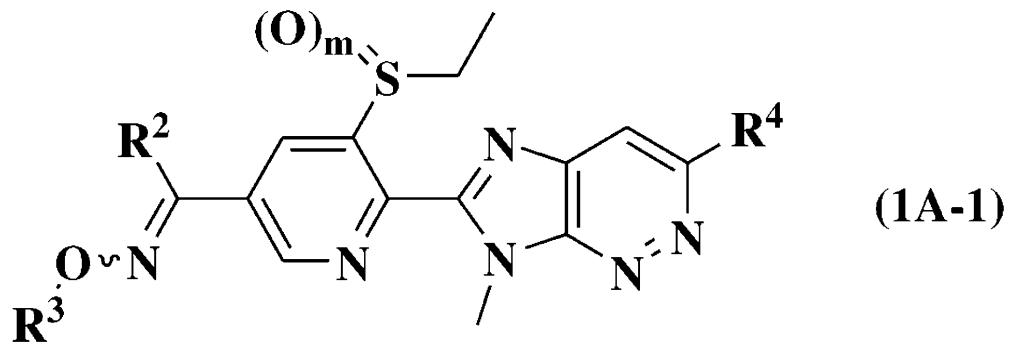
次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。下記の表において、Meはメチル基を表し、Etはエチル基を示し、n-Prはノルマルプロピル基、i-Prはイソプロピル基、

50

c Prはシクロプロピル基、Allyl基はアリル基、t Buはターシャリーブチル基、Ph基はフェニル基、Bn基はベンジル基、Ac基はアセチル基を示す。異性体のE又はZはオキシム基の幾何異性体を示す。物性は融点()又はNMRを示し、NMRデータは第7表に示す。

【0098】

【化14】



【0099】

【表 1】

第 1 表

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-1	H	H	CF ₃	E	0	
1-2	H	H	CF ₃	E	1	
1-3	H	H	CF ₃	E	2	240-241
1-4	H	Me	CF ₃	E	0	
1-5	H	Me	CF ₃	E	1	
1-6	H	Me	CF ₃	E	2	
1-7	H	Et	CF ₃	E	0	
1-8	H	Et	CF ₃	E	1	
1-9	H	Et	CF ₃	E	2	
1-10	H	Et	CF ₃	Z	0	
1-11	H	Et	CF ₃	Z	1	
1-12	H	Et	CF ₃	Z	2	
1-13	H	Allyl	CF ₃	E	0	
1-14	H	Allyl	CF ₃	E	1	
1-15	H	Allyl	CF ₃	E	2	
1-16	H	Allyl	CF ₃	Z	0	
1-17	H	Allyl	CF ₃	Z	1	
1-18	H	Allyl	CF ₃	Z	2	
1-19	H	Bn	CF ₃	E	0	
1-20	H	Bn	CF ₃	E	1	
1-21	H	Bn	CF ₃	E	2	
1-22	Me	Me	CF ₃	E	0	
1-23	Me	Me	CF ₃	E	1	
1-24	Me	Me	CF ₃	E	2	
1-25	Me	Me	CF ₃	Z	0	
1-26	Me	Me	CF ₃	Z	1	
1-27	Me	Me	CF ₃	Z	2	
1-28	Me	Et	CF ₃	E	0	
1-29	Me	Et	CF ₃	E	1	
1-30	Me	Et	CF ₃	E	2	

【 0 1 0 0 】

10

20

30

40

【表 2】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-31	Me	Et	CF ₃	Z	0	
1-32	Me	Et	CF ₃	Z	1	
1-33	Me	Et	CF ₃	Z	2	
1-34	Me	Allyl	CF ₃	E	0	
1-35	Me	Allyl	CF ₃	E	1	
1-36	Me	Allyl	CF ₃	E	2	
1-37	Me	Allyl	CF ₃	Z	0	
1-38	Me	Allyl	CF ₃	Z	1	
1-39	Me	Allyl	CF ₃	Z	2	
1-40	Me	Bn	CF ₃	E	0	
1-41	Me	Bn	CF ₃	E	1	
1-42	Me	Bn	CF ₃	E	2	
1-43	Me	Bn	CF ₃	Z	0	
1-44	Me	Bn	CF ₃	Z	1	
1-45	Me	Bn	CF ₃	Z	2	
1-46	H	t - Bu	CF ₃	E	0	
1-47	H	t - Bu	CF ₃	E	1	
1-48	H	t - Bu	CF ₃	E	2	
1-49	H	t - Bu	CF ₃	Z	0	
1-50	H	t - Bu	CF ₃	Z	1	
1-51	H	t - Bu	CF ₃	Z	2	
1-52	H	Ph	CF ₃	E	0	
1-53	H	Ph	CF ₃	E	1	
1-54	H	Ph	CF ₃	E	2	
1-55	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₃	E	0	
1-56	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₃	E	1	
1-57	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₃	E	2	
1-58	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	0	
1-59	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
1-60	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	202-203

10

20

30

40

【 0 1 0 1 】

【表 3】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-61	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	0	
1-62	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	1	
1-63	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
1-64	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	0	
1-65	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
1-66	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-67	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	0	
1-68	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	1	
1-69	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
1-70	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-71	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-72	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	188-189
1-73	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	
1-74	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-75	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-76	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-77	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-78	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-79	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	
1-80	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-81	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-82	H	CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-83	H	CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-84	H	CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-85	H	CHF ₂	CF ₃	Z	0	
1-86	H	CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-87	H	CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-88	Me	CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-89	Me	CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-90	Me	CHF ₂	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【表4】

第1表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-91	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	0	
1-92	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-93	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-94	H	H	SCF ₃	E	0	
1-95	H	H	SCF ₃	E	1	
1-96	H	H	SCF ₃	E	2	
1-97	H	Me	SCF ₃	E	0	
1-98	H	Me	SCF ₃	E	1	
1-99	H	Me	SCF ₃	E	2	
1-100	H	Et	SCF ₃	E	0	
1-101	H	Et	SCF ₃	E	1	
1-102	H	Et	SCF ₃	E	2	
1-103	H	Et	SCF ₃	Z	0	
1-104	H	Et	SCF ₃	Z	1	
1-105	H	Et	SCF ₃	Z	2	
1-106	H	Allyl	SCF ₃	E	0	
1-107	H	Allyl	SCF ₃	E	1	
1-108	H	Allyl	SCF ₃	E	2	
1-109	H	Allyl	SCF ₃	Z	0	
1-110	H	Allyl	SCF ₃	Z	1	
1-111	H	Allyl	SCF ₃	Z	2	
1-112	H	Bn	SCF ₃	E	0	
1-113	H	Bn	SCF ₃	E	1	
1-114	H	Bn	SCF ₃	E	2	
1-115	Me	Me	SCF ₃	E	0	
1-116	Me	Me	SCF ₃	E	1	
1-117	Me	Me	SCF ₃	E	2	
1-118	Me	Me	SCF ₃	Z	0	
1-119	Me	Me	SCF ₃	Z	1	
1-120	Me	Me	SCF ₃	Z	2	

10

20

30

40

【0103】

【表 5】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-121	Me	Et	SCF ₃	E	0	
1-122	Me	Et	SCF ₃	E	1	
1-123	Me	Et	SCF ₃	E	2	
1-124	Me	Et	SCF ₃	Z	0	
1-125	Me	Et	SCF ₃	Z	1	
1-126	Me	Et	SCF ₃	Z	2	
1-127	Me	Allyl	SCF ₃	E	0	
1-128	Me	Allyl	SCF ₃	E	1	
1-129	Me	Allyl	SCF ₃	E	2	
1-130	Me	Allyl	SCF ₃	Z	0	
1-131	Me	Allyl	SCF ₃	Z	1	
1-132	Me	Allyl	SCF ₃	Z	2	
1-133	Me	Bn	SCF ₃	E	0	
1-134	Me	Bn	SCF ₃	E	1	
1-135	Me	Bn	SCF ₃	E	2	
1-136	Me	Bn	SCF ₃	Z	0	
1-137	Me	Bn	SCF ₃	Z	1	
1-138	Me	Bn	SCF ₃	Z	2	
1-139	H	t-Bu	SCF ₃	E	0	
1-140	H	t-Bu	SCF ₃	E	1	
1-141	H	t-Bu	SCF ₃	E	2	
1-142	H	t-Bu	SCF ₃	Z	0	
1-143	H	t-Bu	SCF ₃	Z	1	
1-144	H	t-Bu	SCF ₃	Z	2	
1-145	H	Ph	SCF ₃	E	0	
1-146	H	Ph	SCF ₃	E	1	
1-147	H	Ph	SCF ₃	E	2	
1-148	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	SCF ₃	E	0	
1-149	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	SCF ₃	E	1	
1-150	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 0 4 】

【表6】

第1表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-151	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	0	
1-152	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
1-153	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
1-154	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	0	
1-155	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	1	
1-156	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	
1-157	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	0	
1-158	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
1-159	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
1-160	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	0	
1-161	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	1	
1-162	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	
1-163	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	0	
1-164	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	1	
1-165	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
1-166	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
1-167	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
1-168	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
1-169	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	0	
1-170	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	1	
1-171	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
1-172	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
1-173	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
1-174	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
1-175	H	CHF ₂	SCF ₃	E	0	
1-176	H	CHF ₂	SCF ₃	E	1	
1-177	H	CHF ₂	SCF ₃	E	2	
1-178	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
1-179	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
1-180	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	2	

10

20

30

40

【0105】

【表 7】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-181	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	0	
1-182	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	1	
1-183	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	2	
1-184	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
1-185	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
1-186	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
1-187	H	H	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-188	H	H	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-189	H	H	CF ₂ CF ₃	E	2	2 4 0 - 2 4 2
1-190	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-191	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-192	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	2	1 9 3 - 1 9 4
1-193	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-194	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-195	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	2	1 6 2 - 1 6 4
1-196	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-197	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-198	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	2	1 7 9 - 1 8 0
1-199	H	Allyl	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-200	H	Allyl	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-201	H	Allyl	CF ₂ CF ₃	E	2	1 5 5 - 1 6 0
1-202	H	Allyl	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-203	H	Allyl	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-204	H	Allyl	CF ₂ CF ₃	Z	2	1 4 1 - 1 4 2
1-205	H	Bn	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-206	H	Bn	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-207	H	Bn	CF ₂ CF ₃	E	2	NMR
1-208	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-209	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-210	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	2	1 7 5 - 1 7 6

10

20

30

40

【表 8】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-211	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-212	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-213	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	2	NMR
1-214	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-215	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-216	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	2	163-164
1-217	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-218	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-219	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	2	NMR
1-220	Me	Allyl	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-221	Me	Allyl	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-222	Me	Allyl	CF ₂ CF ₃	E	2	173-174
1-223	Me	Allyl	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-224	Me	Allyl	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-225	Me	Allyl	CF ₂ CF ₃	Z	2	NMR
1-226	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-227	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-228	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	E	2	213-214
1-229	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-230	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-231	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	Z	2	117-119
1-232	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-233	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-234	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	2	NMR
1-235	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-236	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-237	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	2	NMR
1-238	H	Ph	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-239	H	Ph	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-240	H	Ph	CF ₂ CF ₃	E	2	168-169

【 0 1 0 7 】

10

20

30

40

【表 9】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-241	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-242	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-243	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₂ CF ₃	E	2	NMR
1-244	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-245	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-246	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	207-208
1-247	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-248	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-249	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-250	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-251	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-252	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	207-208
1-253	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-254	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-255	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-256	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-257	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-258	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	207-208
1-259	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-260	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-261	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-262	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-263	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-264	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-265	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-266	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-267	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-268	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-269	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-270	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【表 10】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-271	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-272	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-273	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-274	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-275	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-276	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-277	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-278	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-279	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-280	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-281	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-282	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-283	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-284	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-285	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-286	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-287	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-288	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-289	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-290	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-291	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-292	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-293	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-294	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-295	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-296	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-297	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-298	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-299	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-300	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 0 9 】

【表 1 1】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-301	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-302	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-303	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-304	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-305	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-306	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	136-137
1-307	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-308	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-309	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-310	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-311	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-312	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-313	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-314	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-315	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-316	CF ₃	H	CF ₃	E	0	
1-317	CF ₃	H	CF ₃	E	1	
1-318	CF ₃	H	CF ₃	E	2	
1-319	CF ₃	Me	CF ₃	E	0	
1-320	CF ₃	Me	CF ₃	E	1	
1-321	CF ₃	Me	CF ₃	E	2	
1-322	CF ₃	Et	CF ₃	E	0	
1-323	CF ₃	Et	CF ₃	E	1	
1-324	CF ₃	Et	CF ₃	E	2	
1-325	CF ₃	Et	CF ₃	Z	0	
1-326	CF ₃	Et	CF ₃	Z	1	
1-327	CF ₃	Et	CF ₃	Z	2	
1-328	CF ₃	H	C ₂ F ₅	E	0	
1-329	CF ₃	H	C ₂ F ₅	E	1	
1-330	CF ₃	H	C ₂ F ₅	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 1 0 】

【表 1 2】
第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-331	CF ₃	Me	C ₂ F ₅	E	0	
1-332	CF ₃	Me	C ₂ F ₅	E	1	
1-333	CF ₃	Me	C ₂ F ₅	E	2	
1-334	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	E	0	
1-335	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	E	1	
1-336	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	E	2	
1-337	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	Z	0	
1-338	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	Z	1	
1-339	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	Z	2	
1-340	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-341	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-342	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-343	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	
1-344	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-345	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-346	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	E	0	
1-347	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	E	1	
1-348	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	E	2	
1-349	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	Z	0	
1-350	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	Z	1	
1-351	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	Z	2	
1-352	H	CH ₂ C ₂ F ₅	C ₂ F ₅	E	2	136-137
1-353	NH ₂	H	C ₂ F ₅	E	2	241-242
1-354	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	88-89
1-355	NH ₂	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	E	2	85-86
1-356	NH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	NMR
1-357	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-358	Me	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-359	H	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-360	Me	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 1 1 】

【表 1 3】
第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-361	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-362	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-363	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-364	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-365	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-366	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-367	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-368	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-369	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-370	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-371	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-372	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-373	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-374	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-375	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-376	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-377	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-378	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-379	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-380	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-381	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-382	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-383	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-384	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-385	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-386	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-387	CN	Me	CF ₃	E	2	
1-388	CN	Et	CF ₃	E	2	
1-389	CN	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-390	CN	i-Pr	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 1 2 】

【表 1 4】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-391	CN	H	CF ₃	E	2	
1-392	CN	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-393	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-394	CN	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-395	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-396	CN	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-397	CN	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-398	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-399	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-400	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-401	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-402	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-403	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-404	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-405	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-406	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-407	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-408	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-409	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-410	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-411	COOMe	Me	CF ₃	E	2	
1-412	COOMe	Et	CF ₃	E	2	
1-413	COOMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-414	COOMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-415	COOMe	H	CF ₃	E	2	
1-416	COOMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-417	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-418	COOMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-419	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-420	COOMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 1 3 】

【表 15】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-421	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-422	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-423	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-424	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-425	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-426	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-427	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-428	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-429	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-430	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-431	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-432	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-433	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-434	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-435	COOEt	Me	CF ₃	E	2	
1-436	COOEt	Et	CF ₃	E	2	
1-437	COOEt	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-438	COOEt	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-439	COOEt	H	CF ₃	E	2	
1-440	COOEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-441	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-442	COOEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-443	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-444	COOEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-445	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-446	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-447	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-448	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-449	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-450	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 1 4 】

【表 1 6】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-451	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-452	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-453	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-454	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-455	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-456	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-457	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-458	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-459	CONH ₂	Me	CF ₃	E	2	
1-460	CONH ₂	Et	CF ₃	E	2	
1-461	CONH ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-462	CONH ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-463	CONH ₂	H	CF ₃	E	2	
1-464	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-465	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-466	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-467	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-468	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-469	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-470	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-471	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-472	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-473	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-474	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-475	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-476	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-477	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-478	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-479	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-480	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 1 5 】

【表 17】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-481	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-482	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-483	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
1-484	CONHMe	Et	CF ₃	E	2	
1-485	CONHMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-486	CONHMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-487	CONHMe	H	CF ₃	E	2	
1-488	CONHMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-489	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-490	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-491	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-492	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-493	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-494	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-495	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-496	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-497	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-498	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-499	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-500	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-501	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-502	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-503	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-504	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-505	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-506	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-507	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
1-508	CONMe ₂	Me	CF ₃	E	2	
1-509	CONMe ₂	Et	CF ₃	E	2	
1-510	CONMe ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 1 6 】

【表 1 8】

第 1 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
1-511	CONMe ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-512	CONMe ₂	H	CF ₃	E	2	
1-513	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-514	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-515	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-516	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-517	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-518	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-519	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-520	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-521	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-522	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-523	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-524	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-525	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-526	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-527	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-528	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-529	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-530	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-531	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

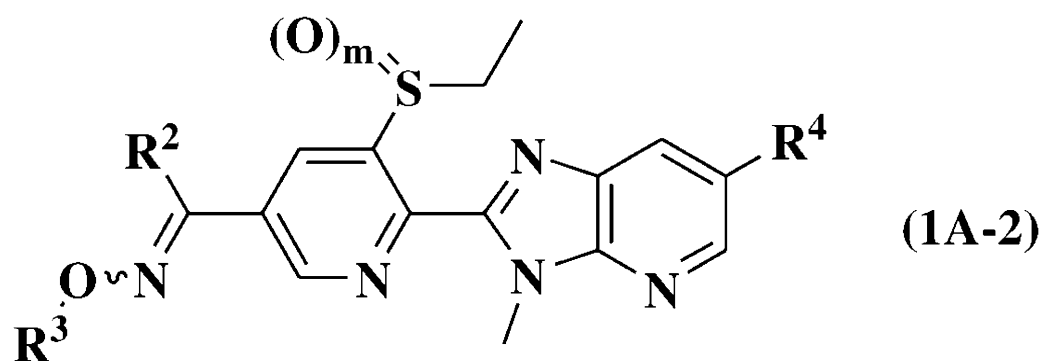
10

20

30

【 0 1 1 7 】

【 化 1 5 】



40

【 0 1 1 8 】

【表 19】

第 2 表

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-1	H	H	CF ₃	E	0	
2-2	H	H	CF ₃	E	1	
2-3	H	H	CF ₃	E	2	256-257
2-4	H	Me	CF ₃	E	0	
2-5	H	Me	CF ₃	E	1	
2-6	H	Me	CF ₃	E	2	245-246
2-7	H	Et	CF ₃	E	0	
2-8	H	Et	CF ₃	E	1	
2-9	H	Et	CF ₃	E	2	190-191
2-10	H	Et	CF ₃	Z	0	
2-11	H	Et	CF ₃	Z	1	
2-12	H	Et	CF ₃	Z	2	143-144
2-13	Me	Me	CF ₃	E	0	
2-14	Me	Me	CF ₃	E	1	
2-15	Me	Me	CF ₃	E	2	204-205
2-16	Me	Me	CF ₃	Z	0	
2-17	Me	Me	CF ₃	Z	1	
2-18	Me	Me	CF ₃	Z	2	
2-19	Me	Et	CF ₃	E	0	
2-20	Me	Et	CF ₃	E	1	
2-21	Me	Et	CF ₃	E	2	
2-22	Me	Et	CF ₃	Z	0	
2-23	Me	Et	CF ₃	Z	1	
2-24	Me	Et	CF ₃	Z	2	
2-25	H	t-Bu	CF ₃	E	0	
2-26	H	t-Bu	CF ₃	E	1	
2-27	H	t-Bu	CF ₃	E	2	
2-28	H	t-Bu	CF ₃	Z	0	
2-29	H	t-Bu	CF ₃	Z	1	
2-30	H	t-Bu	CF ₃	Z	2	

10

20

30

40

【 0 1 1 9 】

【表 20】

第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-31	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	0	
2-32	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
2-33	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	125-126
2-34	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	0	
2-35	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	1	
2-36	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
2-37	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	0	
2-38	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
2-39	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	127-128
2-40	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	0	
2-41	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	1	
2-42	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
2-43	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
2-44	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
2-45	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	158-159
2-46	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	
2-47	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
2-48	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
2-49	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
2-50	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
2-51	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-52	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	
2-53	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
2-54	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
2-55	H	CHF ₂	CF ₃	E	0	
2-56	H	CHF ₂	CF ₃	E	1	
2-57	H	CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-58	H	CHF ₂	CF ₃	Z	0	
2-59	H	CHF ₂	CF ₃	Z	1	
2-60	H	CHF ₂	CF ₃	Z	2	

10

20

30

40

【 0 1 2 0 】

【表 2 1】
第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-61	Me	CHF ₂	CF ₃	E	0	
2-62	Me	CHF ₂	CF ₃	E	1	
2-63	Me	CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-64	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	0	
2-65	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	1	
2-66	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	2	
2-67	H	H	SCF ₃	E	0	
2-68	H	H	SCF ₃	E	1	
2-69	H	H	SCF ₃	E	2	
2-70	H	Me	SCF ₃	E	0	
2-71	H	Me	SCF ₃	E	1	
2-72	H	Me	SCF ₃	E	2	
2-73	H	Et	SCF ₃	E	0	
2-74	H	Et	SCF ₃	E	1	
2-75	H	Et	SCF ₃	E	2	
2-76	H	Et	SCF ₃	Z	0	
2-77	H	Et	SCF ₃	Z	1	
2-78	H	Et	SCF ₃	Z	2	
2-79	Me	Me	SCF ₃	E	0	
2-80	Me	Me	SCF ₃	E	1	
2-81	Me	Me	SCF ₃	E	2	
2-82	Me	Me	SCF ₃	Z	0	
2-83	Me	Me	SCF ₃	Z	1	
2-84	Me	Me	SCF ₃	Z	2	
2-85	Me	Et	SCF ₃	E	0	
2-86	Me	Et	SCF ₃	E	1	
2-87	Me	Et	SCF ₃	E	2	
2-88	Me	Et	SCF ₃	Z	0	
2-89	Me	Et	SCF ₃	Z	1	
2-90	Me	Et	SCF ₃	Z	2	

【 0 1 2 1 】

10

20

30

40

【表 2 2】

第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-91	H	t-Bu	SCF ₃	E	0	
2-92	H	t-Bu	SCF ₃	E	1	
2-93	H	t-Bu	SCF ₃	E	2	
2-94	H	t-Bu	SCF ₃	Z	0	
2-95	H	t-Bu	SCF ₃	Z	1	
2-96	H	t-Bu	SCF ₃	Z	2	
2-97	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	0	
2-98	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
2-99	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
2-100	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	0	
2-101	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	1	
2-102	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	
2-103	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	0	
2-104	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
2-105	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
2-106	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	0	
2-107	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	1	
2-108	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	
2-109	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	0	
2-110	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	1	
2-111	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
2-112	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
2-113	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
2-114	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
2-115	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	0	
2-116	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	1	
2-117	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
2-118	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
2-119	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
2-120	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	2	

【 0 1 2 2】

10

20

30

40

【表 2 3】

第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-121	H	CHF ₂	SCF ₃	E	0	
2-122	H	CHF ₂	SCF ₃	E	1	
2-123	H	CHF ₂	SCF ₃	E	2	
2-124	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
2-125	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
2-126	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
2-127	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	0	
2-128	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	1	
2-129	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	2	
2-130	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
2-131	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
2-132	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
2-133	H	H	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-134	H	H	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-135	H	H	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-136	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-137	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-138	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-139	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-140	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-141	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-142	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-143	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-144	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-145	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-146	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-147	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-148	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-149	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-150	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	2	

10

20

30

40

【 0 1 2 3 】

【表 2 4】

第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-151	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-152	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-153	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-154	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-155	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-156	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-157	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-158	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-159	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-160	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-161	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-162	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-163	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-164	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-165	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-166	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-167	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-168	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-169	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-170	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-171	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-172	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-173	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-174	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-175	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-176	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-177	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-178	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-179	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-180	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	

10

20

30

40

【 0 1 2 4 】

【表 2 5】

第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-181	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-182	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-183	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-184	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-185	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-186	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-187	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-188	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-189	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-190	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-191	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-192	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-193	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-194	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-195	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-196	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-197	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-198	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-199	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-200	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-201	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-202	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-203	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-204	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-205	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-206	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-207	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-208	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-209	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-210	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	

【 0 1 2 5】

10

20

30

40

【表 2 6】

第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-211	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-212	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-213	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-214	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-215	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-216	H	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-217	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-218	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-219	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-220	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-221	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-222	Me	<i>i</i> -Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-223	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-224	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-225	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-226	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-227	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-228	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-229	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-230	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	

【 0 1 2 6 】

10

20

30

【表 2 7】
第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-231	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-232	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-233	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-234	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-235	H	Ac	CF ₃	E	2	217-218
2-236	H	CO-c-Pr	CF ₃	E	2	194-195
2-237	H	CH ₂ -c-Pr	CF ₃	E	2	140-142
2-238	H	CH ₂ C≡CH	CF ₃	E	2	204-205
2-239	Me	H	CF ₃	E	2	194-195
2-240	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	114-115
2-241	H	Me	CF ₃	Z	2	204-205
2-242	H	n-Pr	CF ₃	E	2	134-135
2-243	Me	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-244	H	n-Pr	CF ₃	E	2	156-157
2-245	Me	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-246	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	NMR
2-247	Me	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-248	H	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	NMR
2-249	Me	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-250	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	205-206
2-251	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-252	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-253	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-254	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-255	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-256	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-257	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-258	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	97-98
2-259	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-260	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 2 7 】

【表 2 8】

第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-261	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-262	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	107-108
2-263	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-264	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	115-116
2-265	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-266	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-267	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-268	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-269	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-270	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-271	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-272	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-273	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-274	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-275	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-276	H	CH ₂ C≡N	CF ₃	E	2	204-205
2-277	Me	CH ₂ C≡N	CF ₃	E	2	
2-278	H	c-Pen	CF ₃	E	2	124-125
2-279	Me	c-Pen	CF ₃	E	2	
2-280	H	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	159-160
2-281	Me	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	
2-282	H	n-Bu	CF ₃	E	2	119-120
2-283	Me	n-Bu	CF ₃	E	2	
2-284	H	n-Pen	CF ₃	E	2	133-134
2-285	Me	n-Pen	CF ₃	E	2	
2-286	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	132-133
2-287	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	
2-288	CN	Me	CF ₃	E	2	
2-289	CN	Et	CF ₃	E	2	
2-290	CN	n-Pr	CF ₃	E	2	148-151

【 0 1 2 8 】

10

20

30

40

【表 29】

第2表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-291	CN	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-292	CN	H	CF ₃	E	2	
2-293	CN	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	163-166
2-294	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-295	CN	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-296	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-297	CN	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-298	CN	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-299	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-300	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-301	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-302	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-303	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-304	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-305	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-306	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-307	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-308	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-309	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-310	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-311	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-312	COOMe	Me	CF ₃	E	2	
2-313	COOMe	Et	CF ₃	E	2	
2-314	COOMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-315	COOMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-316	COOMe	H	CF ₃	E	2	
2-317	COOMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-318	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-319	COOMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-320	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 2 9 】

【表 3 0】

第 2 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-321	COOMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-322	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-323	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-324	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-325	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-326	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-327	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-328	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-329	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-330	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-331	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-332	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-333	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-334	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-335	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-336	COOEt	Me	CF ₃	E	2	
2-337	COOEt	Et	CF ₃	E	2	
2-338	COOEt	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-339	COOEt	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-340	COOEt	H	CF ₃	E	2	
2-341	COOEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-342	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-343	COOEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-344	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-345	COOEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-346	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-347	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-348	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-349	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-350	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 3 0 】

【表 3 1】

第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-351	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-352	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-353	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-354	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-355	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-356	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-357	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-358	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-359	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-360	CONH ₂	Me	CF ₃	E	2	
2-361	CONH ₂	Et	CF ₃	E	2	
2-362	CONH ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-363	CONH ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-364	CONH ₂	H	CF ₃	E	2	
2-365	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-366	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-367	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-368	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-369	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-370	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-371	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-372	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-373	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-374	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-375	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-376	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-377	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-378	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-379	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-380	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 3 1 】

【表 3 2】

第 2 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-381	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-382	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-383	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-384	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
2-385	CONHMe	Et	CF ₃	E	2	
2-386	CONHMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-387	CONHMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-388	CONHMe	H	CF ₃	E	2	
2-389	CONHMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-390	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-391	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-392	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-393	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-394	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-395	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-396	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-397	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-398	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-399	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-400	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-401	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-402	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-403	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-404	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-405	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-406	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-407	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-408	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
2-409	CONMe ₂	Me	CF ₃	E	2	
2-410	CONMe ₂	Et	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 3 2 】

【表 3 3】

第 2 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
2-411	CONMe ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-412	CONMe ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-413	CONMe ₂	H	CF ₃	E	2	
2-414	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-415	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-416	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-417	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-418	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-419	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-420	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-421	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-422	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-423	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-424	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-425	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-426	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-427	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-428	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-429	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-430	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-431	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-432	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

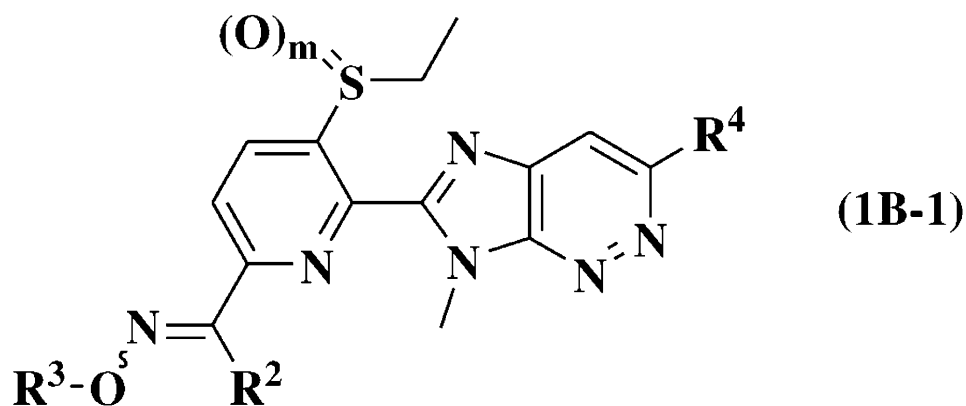
10

20

30

【 0 1 3 3 】

【 化 1 6 】



40

【 0 1 3 4 】

【表 3 4】

第 3 表

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
3-1	H	H	CF ₃	E	2	157-158
3-2	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	84-85
3-3	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	NMR
3-4	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	NMR
3-5	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	NMR
3-6	Me	H	CF ₃	E	2	
3-7	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-8	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-9	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-10	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-11	H	H	CF ₂ CF ₃	E	2	219-220
3-12	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	NMR
3-13	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	NMR
3-14	Me	H	CF ₂ CF ₃	E	2	
3-15	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
3-16	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
3-17	H	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-18	Me	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-19	H	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-20	Me	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-21	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-22	Me	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-23	H	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-24	Me	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-25	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-26	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-27	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-28	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-29	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-30	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-31	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

【 0 1 3 5 】

10

20

30

40

【表 3 5】

第3表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
3-32	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-33	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-34	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-35	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-36	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-37	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-38	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-39	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-40	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-41	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-42	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-43	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-44	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-45	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-46	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-47	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-48	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-49	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-50	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-51	H	CH ₂ C≡N	CF ₃	E	2	
3-52	Me	CH ₂ C≡N	CF ₃	E	2	
3-53	H	c-Pen	CF ₃	E	2	
3-54	Me	c-Pen	CF ₃	E	2	
3-55	H	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	
3-56	Me	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	
3-57	H	n-Bu	CF ₃	E	2	
3-58	Me	n-Bu	CF ₃	E	2	
3-59	H	n-Pen	CF ₃	E	2	
3-60	Me	n-Pen	CF ₃	E	2	
3-61	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	
3-62	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 3 6 】

【表 3 6】

第 3 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
3-63	CN	Me	CF ₃	E	2	
3-64	CN	Et	CF ₃	E	2	
3-65	CN	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-66	CN	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-67	CN	H	CF ₃	E	2	
3-68	CN	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-69	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-70	CN	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-71	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-72	CN	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-73	CN	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-74	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-75	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-76	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-77	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-78	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-79	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-80	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-81	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-82	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-83	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-84	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-85	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-86	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-87	COOMe	Me	CF ₃	E	2	
3-88	COOMe	Et	CF ₃	E	2	
3-89	COOMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-90	COOMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-91	COOMe	H	CF ₃	E	2	
3-92	COOMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 3 7 】

【表 3 7】

第 3 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
3-93	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-94	COOMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-95	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-96	COOMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-97	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-98	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-99	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-100	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-101	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-102	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-103	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-104	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-105	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-106	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-107	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-108	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-109	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-110	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-111	COOEt	Me	CF ₃	E	2	
3-112	COOEt	Et	CF ₃	E	2	
3-113	COOEt	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-114	COOEt	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-115	COOEt	H	CF ₃	E	2	
3-116	COOEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-117	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-118	COOEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-119	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-120	COOEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-121	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-122	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 3 8 】

【表 3 8】

第 3 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
3-123	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-124	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-125	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-126	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-127	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-128	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-129	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-130	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-131	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-132	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-133	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-134	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-135	CONH ₂	Me	CF ₃	E	2	
3-136	CONH ₂	Et	CF ₃	E	2	
3-137	CONH ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-138	CONH ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-139	CONH ₂	H	CF ₃	E	2	
3-140	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-141	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-142	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-143	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-144	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-145	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-146	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-147	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-148	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-149	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-150	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-151	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-152	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 3 9 】

【表 3 9】

第 3 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
3-153	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-154	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-155	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-156	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-157	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-158	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-159	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
3-160	CONHMe	Et	CF ₃	E	2	
3-161	CONHMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-162	CONHMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-163	CONHMe	H	CF ₃	E	2	
3-164	CONHMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-165	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-166	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-167	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-168	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-169	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-170	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-171	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-172	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-173	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-174	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-175	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-176	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-177	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-178	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-179	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-180	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-181	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-182	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

【 0 1 4 0 】

10

20

30

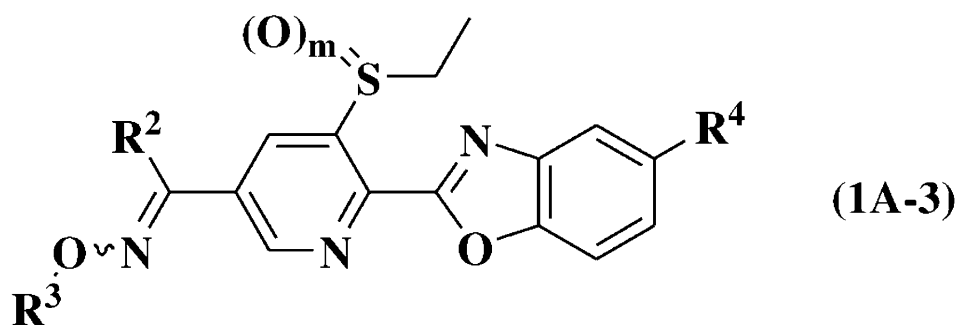
40

【表 4 0】
第 3 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
3-183	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
3-184	CONMe ₂	Me	CF ₃	E	2	
3-185	CONMe ₂	Et	CF ₃	E	2	
3-186	CONMe ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-187	CONMe ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-188	CONMe ₂	H	CF ₃	E	2	
3-189	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-190	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-191	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-192	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-193	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-194	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-195	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-196	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-197	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-198	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-199	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-200	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-201	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-202	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-203	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-204	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-205	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-206	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-207	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

【 0 1 4 1 】

【 化 1 7 】



10

20

30

40

【表 4 1】

第 4 表

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-1	H	H	CF ₃	E	2	243-244
4-2	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	187-188
4-3	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	180-181
4-4	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
4-5	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	1	
4-6	Me	H	CF ₃	E	2	
4-7	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
4-8	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
4-9	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
4-10	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	Z	2	
4-11	H	H	SCF ₃	E	2	213-214
4-12	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	157-158
4-13	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	135-138
4-14	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	200-202
4-15	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	1	196-197
4-16	Me	H	SCF ₃	E	2	
4-17	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-18	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-19	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	
4-20	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	Z	2	

【 0 1 4 2 】

10

20

30

【表 4 2】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-21	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
4-22	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
4-23	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
4-24	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
4-25	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	154-155
4-26	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-27	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-28	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-29	H	H	OCF ₃	E	2	169-170
4-30	H	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	153-154
4-31	H	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	Z	2	150-151
4-32	H	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	153-154
4-33	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	127-128
4-34	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	2	143-144
4-35	H	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	1	
4-36	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	1	
4-37	Me	H	OCF ₃	E	2	
4-38	Me	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
4-39	Me	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
4-40	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
4-41	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	2	
4-42	Me	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	1	
4-43	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	1	

10

20

30

【 0 1 4 3 】

【表 4 3】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-44	H	n-Pr	SCF ₃	E	2	143-144
4-45	Me	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-46	H	i-Pr	SCF ₃	E	2	153-154
4-47	Me	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-48	H	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	150-151
4-49	Me	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-50	H	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-51	Me	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-52	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-53	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-54	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-55	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-56	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-57	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-58	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-59	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-60	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	141-142
4-61	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-62	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-63	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-64	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-65	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-66	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-67	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-68	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-69	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-70	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-71	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-72	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-73	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 4 4 】

【表 4 4】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-74	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-75	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-76	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-77	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-78	H	CH ₂ C≡N	SCF ₃	E	2	
4-79	Me	CH ₂ C≡N	SCF ₃	E	2	
4-80	H	c-Pen	SCF ₃	E	2	
4-81	Me	c-Pen	SCF ₃	E	2	
4-82	H	CH ₂ CH=CHCl	SCF ₃	E	2	139-140
4-83	Me	CH ₂ CH=CHCl	SCF ₃	E	2	
4-84	H	n-Bu	SCF ₃	E	2	126-127
4-85	Me	n-Bu	SCF ₃	E	2	
4-86	H	n-Pen	SCF ₃	E	2	128-129
4-87	Me	n-Pen	SCF ₃	E	2	
4-88	H	CH ₂ CH= C(CH ₃) ₂	SCF ₃	E	2	81-82
4-89	Me	CH ₂ CH= C(CH ₃) ₂	SCF ₃	E	2	
4-90	H	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-91	H	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	164-165
4-92	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-93	H	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	161-162
4-94	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-95	Me	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-96	Me	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	140-141
4-97	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-98	Me	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	118-119
4-99	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-100	H	H	OCHF ₂	E	2	
4-101	H	CH ₂ CF ₃	OCHF ₂	E	0	144-145
4-102	H	CH ₂ CF ₃	OCHF ₂	E	2	146-147
4-103	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCHF ₂	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 4 5 】

【表 4 5】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-104	H	CH ₂ CHF ₂	OCHF ₂	E	2	
4-105	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCHF ₂	E	2	
4-106	Me	H	OCHF ₂	E	2	
4-107	Me	CH ₂ CF ₃	OCHF ₂	E	2	
4-108	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCHF ₂	E	2	
4-109	Me	CH ₂ CHF ₂	OCHF ₂	E	2	
4-110	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCHF ₂	E	2	
4-111	H	H	SOCF ₃	E	2	
4-112	H	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-113	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-114	H	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	138-139
4-115	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-116	Me	H	SOCF ₃	E	2	
4-117	Me	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-118	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-119	Me	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-120	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-121	H	n-Pr	SOCF ₃	E	2	
4-122	Me	n-Pr	SOCF ₃	E	2	
4-123	H	i-Pr	SOCF ₃	E	2	
4-124	Me	i-Pr	SOCF ₃	E	2	
4-125	H	CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-126	Me	CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-127	H	CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-128	Me	CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-129	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-130	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-131	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-132	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-133	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	

【 0 1 4 6 】

10

20

30

40

【表 4 6】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-134	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-135	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-136	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-137	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-138	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-139	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-140	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-141	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-142	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-143	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-144	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-145	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-146	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-147	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-148	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-149	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-150	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-151	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-152	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-153	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-154	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-155	H	CH ₂ C≡N	SOCF ₃	E	2	
4-156	Me	CH ₂ C≡N	SOCF ₃	E	2	
4-157	H	c-Pen	SOCF ₃	E	2	
4-158	Me	c-Pen	SOCF ₃	E	2	
4-159	H	CH ₂ CH=CHCl	SOCF ₃	E	2	
4-160	Me	CH ₂ CH=CHCl	SOCF ₃	E	2	
4-161	H	n-Bu	SOCF ₃	E	2	
4-162	Me	n-Bu	SOCF ₃	E	2	
4-163	H	n-Pen	SOCF ₃	E	2	

【 0 1 4 7 】

10

20

30

40

【表 4 7】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-164	Me	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-165	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-166	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-167	H	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-168	Me	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-169	H	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-170	Me	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-171	H	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-172	Me	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-173	H	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-174	Me	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-175	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-176	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-177	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-178	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-179	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-180	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-181	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-182	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-183	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-184	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-185	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-186	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-187	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-188	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-189	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-190	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-191	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-192	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-193	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 4 8 】

【表 4 8】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-194	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-195	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-196	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-197	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-198	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-199	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-200	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-201	H	CH ₂ C≡N	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-202	Me	CH ₂ C≡N	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-203	H	c-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-204	Me	c-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-205	H	CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-206	Me	CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-207	H	n-Bu	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-208	Me	n-Bu	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-209	H	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-210	Me	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-211	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-212	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-213	H	Me	SOCF ₃	E	2	
4-214	Me	Me	SOCF ₃	E	2	
4-215	H	Et	SOCF ₃	E	2	
4-216	Me	Et	SOCF ₃	E	2	
4-217	H	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-218	Me	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-219	H	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-220	Me	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-221	CN	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-222	CN	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-223	CN	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	

【 0 1 4 9 】

10

20

30

40

【表 4 9】
第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-224	CN	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-225	CN	H	SOCF ₃	E	2	
4-226	CN	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-227	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-228	CN	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-229	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-230	CN	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-231	CN	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-232	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-233	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-234	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-235	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-236	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-237	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-238	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-239	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-240	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-241	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-242	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-243	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-244	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-245	CN	Me	SCF ₃	E	2	
4-246	CN	Et	SCF ₃	E	2	
4-247	CN	n-Pr	SCF ₃	E	2	127-129
4-248	CN	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-249	CN	H	SCF ₃	E	2	
4-250	CN	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	148-153
4-251	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-252	CN	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-253	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	

【 0 1 5 0 】

10

20

30

40

【表 5 0】

第 4 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-254	CN	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-255	CN	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-256	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-257	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-258	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-259	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-260	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-261	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-262	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-263	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-264	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-265	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-266	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-267	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-268	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-269	COOMe	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-270	COOMe	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-271	COOMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-272	COOMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-273	COOMe	H	SOCF ₃	E	2	
4-274	COOMe	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-275	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-276	COOMe	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-277	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-278	COOMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-279	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-280	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-281	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-282	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-283	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 5 1 】

【表 5 1】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-284	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-285	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-286	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-287	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-288	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-289	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-290	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-291	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-292	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-293	COOMe	Me	SCF ₃	E	2	
4-294	COOMe	Et	SCF ₃	E	2	
4-295	COOMe	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-296	COOMe	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-297	COOMe	H	SCF ₃	E	2	
4-298	COOMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-299	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-300	COOMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-301	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-302	COOMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-303	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-304	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-305	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-306	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-307	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-308	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-309	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-310	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-311	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-312	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-313	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 5 2 】

【表 5 2】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-314	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-315	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-316	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-317	COOEt	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-318	COOEt	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-319	COOEt	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-320	COOEt	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-321	COOEt	H	SOCF ₃	E	2	
4-322	COOEt	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-323	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-324	COOEt	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-325	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-326	COOEt	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-327	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-328	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-329	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-330	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-331	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-332	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-333	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-334	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-335	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-336	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-337	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-338	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-339	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-340	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-341	COOEt	Me	SCF ₃	E	2	
4-342	COOEt	Et	SCF ₃	E	2	
4-343	COOEt	n-Pr	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 5 3 】

【表 5 3】
第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-344	COOEt	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-345	COOEt	H	SCF ₃	E	2	
4-346	COOEt	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-347	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-348	COOEt	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-349	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-350	COOEt	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-351	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-352	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-353	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-354	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-355	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-356	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-357	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-358	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-359	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-360	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-361	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-362	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-363	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-364	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-365	CONH ₂	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-366	CONH ₂	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-367	CONH ₂	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-368	CONH ₂	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-369	CONH ₂	H	SOCF ₃	E	2	
4-370	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-371	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-372	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-373	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 5 4 】

【表 5 4】
第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-374	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-375	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-376	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-377	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-378	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-379	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-380	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-381	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-382	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-383	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-384	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-385	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-386	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-387	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-388	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-389	CONH ₂	Me	SCF ₃	E	2	
4-390	CONH ₂	Et	SCF ₃	E	2	
4-391	CONH ₂	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-392	CONH ₂	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-393	CONH ₂	H	SCF ₃	E	2	
4-394	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-395	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-396	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-397	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-398	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-399	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-400	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-401	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-402	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-403	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 5 5 】

【表 5 5】

第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-404	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-405	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-406	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-407	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-408	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-409	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-410	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-411	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-412	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-413	CONHMe	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-414	CONHMe	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-415	CONHMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-416	CONHMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-417	CONHMe	H	SOCF ₃	E	2	
4-418	CONHMe	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-419	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-420	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-421	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-422	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-423	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-424	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-425	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-426	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-427	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-428	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-429	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-430	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-431	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-432	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-433	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 5 6 】

【表 5 6】

第 4 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-434	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-435	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-436	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-437	CONHMe	Me	SCF ₃	E	2	
4-438	CONHMe	Et	SCF ₃	E	2	
4-439	CONHMe	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-440	CONHMe	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-441	CONHMe	H	SCF ₃	E	2	
4-442	CONHMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-443	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-444	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-445	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-446	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-447	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-448	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-449	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-450	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-451	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-452	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-453	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-454	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-455	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-456	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-457	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-458	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-459	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-460	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-461	CONMe ₂	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-462	CONMe ₂	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-463	CONMe ₂	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 5 7 】

【表 5 7】
第 4 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-464	CONMe ₂	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-465	CONMe ₂	H	SOCF ₃	E	2	
4-466	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-467	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-468	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-469	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-470	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-471	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-472	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-473	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-474	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-475	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-476	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-477	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-478	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-479	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-480	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-481	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-482	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-483	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-484	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-485	CONMe ₂	Me	SCF ₃	E	2	
4-486	CONMe ₂	Et	SCF ₃	E	2	
4-487	CONMe ₂	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-488	CONMe ₂	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-489	CONMe ₂	H	SCF ₃	E	2	
4-490	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-491	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-492	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-493	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 5 8 】

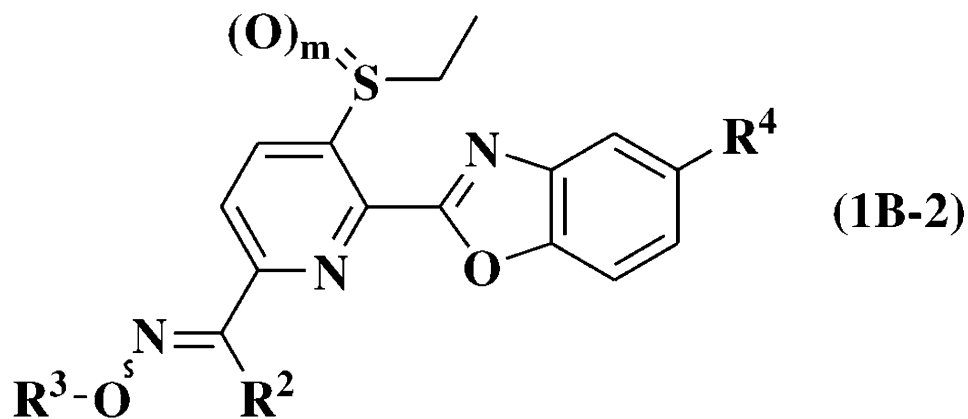
【表 5 8】

第 4 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
4-494	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-495	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-496	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-497	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-498	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-499	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-500	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-501	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-502	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-503	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-504	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-505	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-506	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-507	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-508	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	

【 0 1 5 9 】

【 化 1 8 】



【 0 1 6 0 】

【表 5 9】

第 5 表

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-1	H	H	CF ₃	E	2	
5-2	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
5-3	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
5-4	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
5-5	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
5-6	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
5-7	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	1	
5-8	Me	H	CF ₃	E	2	
5-9	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
5-10	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
5-11	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
5-12	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
5-13	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
5-14	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	1	
5-15	H	H	SCF ₃	E	2	81-82
5-16	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	138-139
5-17	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	121-122
5-18	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	127-128
5-19	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	123-124
5-20	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	

10

20

30

【 0 1 6 1 】

【表 6 0】
第 5 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-21	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	1	
5-22	Me	H	SCF ₃	E	2	
5-23	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-24	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-25	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-26	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-27	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
5-28	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	1	
5-29	H	H	OCF ₃	E	2	
5-30	H	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
5-31	H	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	Z	2	
5-32	H	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
5-33	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
5-34	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	2	
5-35	H	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	1	
5-36	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	1	
5-37	Me	H	OCF ₃	E	2	
5-38	Me	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
5-39	Me	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
5-40	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
5-41	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	2	
5-42	Me	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	1	
5-43	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	1	

10

20

30

【 0 1 6 2 】

【表 6 1】

第 5 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-44	H	n-Pr	OCF ₃	E	2	NMR
5-45	Me	n-Pr	OCF ₃	E	2	
5-46	H	i-Pr	OCF ₃	E	2	115-116
5-47	Me	i-Pr	OCF ₃	E	2	
5-48	H	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	E	2	96-98
5-49	Me	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-50	H	CH ₂ SOCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-51	Me	CH ₂ SOCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-52	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-53	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-54	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-55	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-56	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-57	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-58	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-59	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-60	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	E	2	107-108
5-61	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-62	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	OCF ₃	E	2	169-170
5-63	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-64	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	187-188
5-65	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-66	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-67	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-68	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-69	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-70	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-71	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-72	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	OCF ₃	E	2	
5-73	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	OCF ₃	E	2	

【 0 1 6 3 】

10

20

30

40

【表 6 2】
第 5 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-74	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	OCF ₃	E	2	
5-75	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	OCF ₃	E	2	
5-76	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
5-77	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
5-78	H	CH ₂ C≡N	OCF ₃	E	2	
5-79	Me	CH ₂ C≡N	OCF ₃	E	2	
5-80	H	c-Pen	OCF ₃	E	2	113-114
5-81	Me	c-Pen	OCF ₃	E	2	
5-82	H	CH ₂ CH=CHCl	OCF ₃	E	2	NMR
5-83	Me	CH ₂ CH=CHCl	OCF ₃	E	2	
5-84	H	n-Bu	OCF ₃	E	2	77-78
5-85	Me	n-Bu	OCF ₃	E	2	
5-86	H	n-Pen	OCF ₃	E	2	69-70
5-87	Me	n-Pen	OCF ₃	E	2	
5-88	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	OCF ₃	E	2	NMR
5-89	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	OCF ₃	E	2	
5-90	H	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-91	H	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-92	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-93	H	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	127-128
5-94	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-95	Me	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-96	Me	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-97	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-98	Me	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-99	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-100	H	H	SOCF ₃	E	2	
5-101	H	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-102	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-103	H	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 6 4 】

【表 6 3】

第 5 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-104	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-105	Me	H	SOCF ₃	E	2	
5-106	Me	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-107	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-108	Me	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-109	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-110	H	n-Pr	SOCF ₃	E	2	
5-111	Me	n-Pr	SOCF ₃	E	2	
5-112	H	i-Pr	SOCF ₃	E	2	
5-113	Me	i-Pr	SOCF ₃	E	2	
5-114	H	CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-115	Me	CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-116	H	CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-117	Me	CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-118	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-119	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-120	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-121	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-122	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-123	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-124	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-125	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-126	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-127	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-128	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-129	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-130	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-131	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-132	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-133	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 6 5 】

【表 6 4】

第 5 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-134	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-135	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-136	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-137	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-138	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-139	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-140	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-141	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-142	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-143	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-144	H	CH ₂ C≡N	SOCF ₃	E	2	
5-145	Me	CH ₂ C≡N	SOCF ₃	E	2	
5-146	H	c-Pen	SOCF ₃	E	2	
5-147	Me	c-Pen	SOCF ₃	E	2	
5-148	H	CH ₂ CH=CHCl	SOCF ₃	E	2	
5-149	Me	CH ₂ CH=CHCl	SOCF ₃	E	2	
5-150	H	n-Bu	SOCF ₃	E	2	
5-151	Me	n-Bu	SOCF ₃	E	2	
5-152	H	n-Pen	SOCF ₃	E	2	
5-153	Me	n-Pen	SOCF ₃	E	2	
5-154	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SOCF ₃	E	2	
5-155	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SOCF ₃	E	2	
5-156	H	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-157	Me	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-158	H	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-159	Me	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-160	H	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-161	Me	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-162	H	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-163	Me	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 6 6 】

【表 6 5】
第 5 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-164	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-165	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-166	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-167	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-168	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-169	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-170	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-171	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-172	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-173	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-174	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-175	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-176	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-177	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-178	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-179	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-180	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-181	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-182	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-183	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-184	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-185	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-186	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-187	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-188	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-189	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-190	H	CH ₂ C≡N	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-191	Me	CH ₂ C≡N	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-192	H	c-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-193	Me	c-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	

【 0 1 6 7 】

10

20

30

40

【表 6 6】

第 5 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-194	H	CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-195	Me	CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-196	H	n-Bu	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-197	Me	n-Bu	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-198	H	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-199	Me	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-200	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-201	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-202	H	Me	SOCF ₃	E	2	
5-203	Me	Me	SOCF ₃	E	2	
5-204	H	Et	SOCF ₃	E	2	
5-205	Me	Et	SOCF ₃	E	2	
5-206	H	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-207	Me	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-208	H	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-209	Me	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-210	CN	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-211	CN	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-212	CN	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-213	CN	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-214	CN	H	SOCF ₃	E	2	
5-215	CN	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-216	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-217	CN	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-218	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-219	CN	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-220	CN	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-221	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-222	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-223	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【表 6 7】

第 5 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-224	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-225	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-226	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-227	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-228	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-229	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-230	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-231	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-232	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-233	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-234	CN	Me	SCF ₃	E	2	
5-235	CN	Et	SCF ₃	E	2	
5-236	CN	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-237	CN	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-238	CN	H	SCF ₃	E	2	
5-239	CN	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-240	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-241	CN	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-242	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-243	CN	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-244	CN	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-245	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-246	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-247	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-248	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-249	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-250	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-251	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-252	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-253	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 6 9 】

【表 6 8】

第 5 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-255	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-256	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-257	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-258	COOMe	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-259	COOMe	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-260	COOMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-261	COOMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-262	COOMe	H	SOCF ₃	E	2	
5-263	COOMe	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-264	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-265	COOMe	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-266	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-267	COOMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-268	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-269	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-270	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-271	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-272	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-273	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-274	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-275	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-276	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-277	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-278	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-279	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-280	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-281	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-282	COOMe	Me	SCF ₃	E	2	
5-283	COOMe	Et	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 7 0 】

【表 6 9】

第 5 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-284	COOMe	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-285	COOMe	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-286	COOMe	H	SCF ₃	E	2	
5-287	COOMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-288	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-289	COOMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-290	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-291	COOMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-292	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-293	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-294	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-295	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-296	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-297	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-298	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-299	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-300	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-301	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-302	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-303	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-304	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-305	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-306	COOEt	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-307	COOEt	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-308	COOEt	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-309	COOEt	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-310	COOEt	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-311	COOEt	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-312	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-313	COOEt	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	

【 0 1 7 1 】

10

20

30

40

【表 7 0】

第 5 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-314	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-315	COOEt	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-316	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-317	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-318	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-319	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-320	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-321	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-322	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-323	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-324	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-325	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-326	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-327	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-328	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-329	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-330	COOEt	Me	SCF ₃	E	2	
5-331	COOEt	Et	SCF ₃	E	2	
5-332	COOEt	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-333	COOEt	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-334	COOEt	H	SCF ₃	E	2	
5-335	COOEt	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-336	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-337	COOEt	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-338	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-339	COOEt	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-340	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-341	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-342	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-343	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 7 2 】

【表 7 1】

第 5 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-344	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-345	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-346	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-347	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-348	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-349	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-350	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-351	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-352	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-353	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-354	CONH ₂	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-355	CONH ₂	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-356	CONH ₂	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-357	CONH ₂	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-358	CONH ₂	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-359	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-360	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-361	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-362	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-363	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-364	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-365	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-366	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-367	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-368	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-369	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-370	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-371	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-372	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-373	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 7 3 】

【表 7 2】

第 5 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-374	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-375	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-376	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-377	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-378	CONH ₂	Me	SCF ₃	E	2	
5-379	CONH ₂	Et	SCF ₃	E	2	
5-380	CONH ₂	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-381	CONH ₂	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-382	CONH ₂	H	SCF ₃	E	2	
5-383	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-384	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-385	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-386	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-387	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-388	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-389	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-390	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-391	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-392	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-393	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-394	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-395	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-396	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-397	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-398	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-399	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-400	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-401	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-402	CONHMe	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-403	CONHMe	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 7 4 】

【表 7 3】

第 5 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-404	CONHMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-405	CONHMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-406	CONHMe	H	SOCF ₃	E	2	
5-407	CONHMe	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-408	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-409	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-410	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-411	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-412	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-413	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-414	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-415	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-416	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-417	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-418	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-419	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-420	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-421	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-422	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-423	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-424	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-425	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-426	CONHMe	Me	SCF ₃	E	2	
5-427	CONHMe	Et	SCF ₃	E	2	
5-428	CONHMe	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-429	CONHMe	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-430	CONHMe	H	SCF ₃	E	2	
5-431	CONHMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-432	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-433	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	

10

20

30

40

【表 7 4】

第 5 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-434	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-435	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-436	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-437	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-438	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-439	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-440	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-441	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-442	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-443	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-444	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-445	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-446	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-447	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-448	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-449	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-450	CONMe ₂	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-451	CONMe ₂	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-452	CONMe ₂	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-453	CONMe ₂	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-454	CONMe ₂	H	SOCF ₃	E	2	
5-455	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-456	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-457	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-458	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-459	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-460	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-461	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-462	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-463	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 7 6 】

【表 7 5】
第 5 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
5-464	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-465	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-466	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-467	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-468	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-469	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-470	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-471	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-472	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-473	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-474	CONMe ₂	Me	SCF ₃	E	2	
5-475	CONMe ₂	Et	SCF ₃	E	2	
5-476	CONMe ₂	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-477	CONMe ₂	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-478	CONMe ₂	H	SCF ₃	E	2	
5-479	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-480	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-481	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-482	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-483	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-484	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-485	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-486	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-487	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-488	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-489	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-490	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-491	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-492	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-493	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-494	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-495	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-496	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-497	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	

10

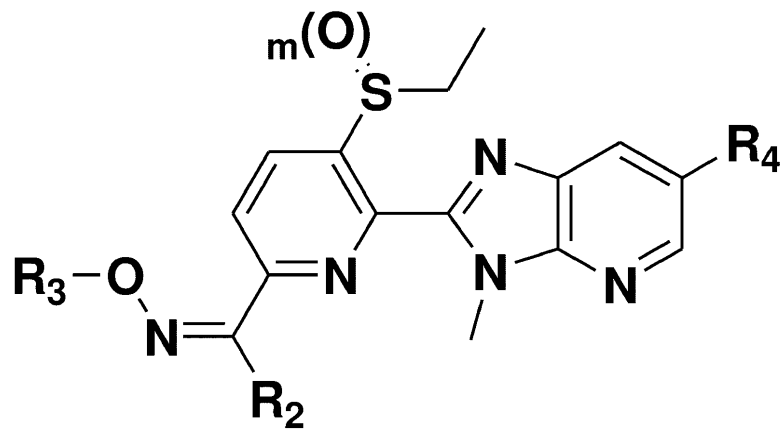
20

30

40

【 0 1 7 7 】

【化 1 9】



(1B-3)

【 0 1 7 8】

【表 7 6】
第 6 表

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
6-1	H	H	CF ₃	E	2	201-202
6-2	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	NMR
6-3	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-4	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	NMR
6-5	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	NMR
6-6	Me	H	CF ₃	E	2	
6-7	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-8	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-9	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-10	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-11	H	H	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-12	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-13	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-14	Me	H	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-15	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-16	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-17	H	n-Pr	CF ₃	E	2	NMR
6-18	Me	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-19	H	i-Pr	CF ₃	E	2	142-143
6-20	Me	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-21	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	NMR
6-22	Me	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-23	H	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-24	Me	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-25	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-26	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-27	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-28	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-29	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-30	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-31	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

【 0 1 7 9 】

10

20

30

40

【表 7 7】

第 6 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
6-32	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-33	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-34	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-35	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-36	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-37	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-38	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-39	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-40	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-41	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-42	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-43	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-44	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-45	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-46	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-47	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-48	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-49	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-50	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-51	H	CH ₂ C≡N	CF ₃	E	2	
6-52	Me	CH ₂ C≡N	CF ₃	E	2	
6-53	H	c-Pen	CF ₃	E	2	
6-54	Me	c-Pen	CF ₃	E	2	
6-55	H	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	NMR
6-56	Me	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	
6-57	H	n-Bu	CF ₃	E	2	NMR
6-58	Me	n-Bu	CF ₃	E	2	
6-59	H	n-Pen	CF ₃	E	2	NMR
6-60	Me	n-Pen	CF ₃	E	2	
6-61	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	NMR
6-62	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 8 0 】

【表 7 8】
第 6 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
6-63	CN	Me	CF ₃	E	2	
6-64	CN	Et	CF ₃	E	2	
6-65	CN	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-66	CN	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-67	CN	H	CF ₃	E	2	
6-68	CN	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-69	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-70	CN	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-71	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-72	CN	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-73	CN	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-74	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-75	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-76	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-77	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-78	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-79	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-80	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-81	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-82	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-83	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-84	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-85	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-86	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-87	COOMe	Me	CF ₃	E	2	
6-88	COOMe	Et	CF ₃	E	2	
6-89	COOMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-90	COOMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-91	COOMe	H	CF ₃	E	2	
6-92	COOMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-93	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 8 1 】

【表 7 9】

第 6 表続き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
6-94	COOMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-95	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-96	COOMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-97	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-98	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-99	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-100	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-101	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-102	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-103	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-104	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-105	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-106	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-107	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-108	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-109	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-110	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-111	COOEt	Me	CF ₃	E	2	
6-112	COOEt	Et	CF ₃	E	2	
6-113	COOEt	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-114	COOEt	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-115	COOEt	H	CF ₃	E	2	
6-116	COOEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-117	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-118	COOEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-119	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-120	COOEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-121	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-122	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-123	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 8 2 】

【表 8 0】
第 6 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
6-124	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-125	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-126	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-127	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-128	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-129	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-130	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-131	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-132	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-133	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-134	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-135	CONH ₂	Me	CF ₃	E	2	
6-136	CONH ₂	Et	CF ₃	E	2	
6-137	CONH ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-138	CONH ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-139	CONH ₂	H	CF ₃	E	2	
6-140	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-141	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-142	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-143	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-144	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-145	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-146	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-147	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-148	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-149	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-150	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-151	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-152	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-153	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 8 3 】

【表 8 1】

第 6 表 続 き

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
6-154	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-155	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-156	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-157	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-158	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-159	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
6-160	CONHMe	Et	CF ₃	E	2	
6-161	CONHMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-162	CONHMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-163	CONHMe	H	CF ₃	E	2	
6-164	CONHMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-165	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-166	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-167	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-168	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-169	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-170	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-171	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-172	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-173	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-174	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-175	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-176	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-177	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-178	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-179	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-180	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-181	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-182	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-183	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	

10

20

30

40

【 0 1 8 4 】

【表 8 2】

第 6 表 続 ぎ

化合物番号	R ²	R ³	R ⁴	異性体	m	物性値
6-184	CONMe ₂	Me	CF ₃	E	2	
6-185	CONMe ₂	Et	CF ₃	E	2	
6-186	CONMe ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-187	CONMe ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-188	CONMe ₂	H	CF ₃	E	2	
6-189	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-190	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-191	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-192	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-193	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-194	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-195	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-196	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-197	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-198	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-199	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-200	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-201	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-202	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-203	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-204	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-205	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-206	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-207	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

10

20

30

【 0 1 8 5 】

【表 8 3】
第 7 表

化合物番号	¹ H-NMRデータ(CDCl ₃)
1-207	9. 28(d, 1H)、8. 71(d, 1H)、8. 21(s, 1H)、7. 25-4. 45 (m, 5H)、5. 34(s, 2H)、4. 07(s, 3H)、3. 80(q, 2H)、1. 39 (t, 3H)
1-213	9. 16(d, 1H)、8. 64(d, 1H)、8. 21(s, 1H)、4. 10(s, 3H)、3. 96(s, 3H)、3. 81(q, 2H)、2. 90(s, 3H)、1. 39(t, 3H)
1-219	9. 19(d, 1H)、8. 72(d, 1H)、8. 22(s, 1H)、4. 23(q, 2H)、4. 10(s, 3H)、3. 81(q, 2H)、2. 38(s, 3H)、1. 40(t, 3H)、1. 30(t, 3H)
1-225	9. 17(d, 1H)、8. 68(d, 1H)、8. 21(s, 1H)、6. 00(tdd, 1H)、5. 31(ddd, 1H)、5. 26(ddd, 1H)、4. 66(td, 2H)、4. 10(s, 3H)、3. 79(q, 2H)、2. 39(s, 3H)、1. 38(t, 3H)
1-234	9. 18(d, 1H)、8. 66(d, 3H)、8. 22(s, 1H)、8. 21(s, 1H)、4. 09(s, 3H)、3. 82(q, 2H)、1. 43(t, 3H)、1. 42(s, 9H)
1-237	9. 45(d, 1H)、9. 10(d, 3H)、8. 21(s, 1H)、7. 57(s, 1H)、4. 09(s, 3H)、3. 80(q, 2H)、1. 45(s, 9H)、1. 39(t, 3H)
1-243	9. 24(d, 1H)、8. 71(d, 3H)、8. 32(s, 1H)、8. 21(s, 1H)、4. 09(s, 3H)、3. 82(q, 2H)、3. 33(s, 3H)、1. 59(s, 6H)、1. 41 (t, 3H)
1-356	9. 39(d, 1H)、8. 84(d, 1H)、8. 21(d, 1H)、6. 01(s, 2H)、4. 53(q, 2H)、4. 07(s, 3H)、3. 79(q, 2H)、1. 38(t, 3H)
2-246	9. 15(d, 1H)、8. 77(d, 1H)、8. 71(d, 1H)、8. 31(d, 1H)、8. 30(s, 1H)、5. 35(s, 2H)、3. 91(s, 3H)、3. 89(q, 2H)、2. 32(s, 3H)、1. 40(t, 3H)
2-248	9. 14(d, 1H)、8. 78(d, 1H)、8. 74(d, 1H)、8. 44(s, 1H)、8. 32(s, 1H)、5. 18(s, 2H)、3. 91(s, 3H)、3. 90(q, 2H)、2. 68(s, 3H)、1. 39(t, 3H)
3-3	8. 54(d, 1H)、8. 31(s, 1H)、8. 28(d, 1H)、8. 20(s, 1H)、6. 07(tt, 1H)、4. 49(td, 2H)、4. 07(s, 3H)、3. 74(q, 2H)、1. 38(t, 3H)
3-4	8. 56(d, 1H)、8. 34(s, 1H)、8. 29(d, 1H)、8. 20(s, 1H)、4. 76(q, 2H)、4. 08(s, 3H)、3. 75(q, 2H)、1. 38(t, 3H)
3-5	8. 56(d, 1H)、8. 33(s, 1H)、8. 29(d, 1H)、8. 20(s, 1H)、5. 94(tt, 1H)、4. 71(t, 2H)、4. 07(s, 3H)、3. 75(q, 2H)、1. 37(t, 3H)
3-12	8. 56(d, 1H)、8. 34(s, 1H)、8. 29(d, 1H)、8. 22(s, 1H)、4. 66(q, 2H)、4. 07(s, 3H)、3. 76(q, 2H)、1. 38(t, 3H)

10

20

30

40

【表 8 4】
第 7 表続き

化合物番号	¹ H-NMRデータ(CDCl ₃)	
3-13	8. 56(d, 1H)、8. 31(s, 1H)、8. 28(d, 1H)、8. 22(s, 1H)、6. 07(tt, 1H)、4. 49(td, 2H)、4. 07(s, 3H)、3. 75(q, 2H)、1. 38(t, 3H)	
5-44	8. 50(d, 1H)、8. 29(s, 1H)、8. 23(d, 1H)、7. 72(d, 1H)、7. 69(d, 1H)、7. 35(dd, 1H)、4. 25(t, 2H)、3. 95(q, 2H)、1. 79(d, 2H)、1. 42(t, 3H)、1. 00(t, 3H)	10
5-82	8. 53(d, 1H)、8. 31(s, 1H)、8. 21(d, 1H)、7. 72(d, 1H)、7. 69(d, 1H)、7. 36(dd, 1H)、6. 38(td, 1H)、6. 18(d, 1H)、4. 76(dd, 2H)、3. 96(q, 2H)、1. 42(t, 3H)	
5-88	8. 50(d, 1H)、8. 28(s, 1H)、8. 21(d, 1H)、7. 71(d, 1H)、7. 68(d, 1H)、7. 34(dd, 1H)、5. 49(t, 1H)、4. 79(d, 2H)、3. 94(q, 2H)、1. 82(s, 3H)、1. 78(s, 3H)、1. 42(t, 3H)、	
6-2	8. 78(d, 1H)、8. 54(d, 1H)、8. 34(s, 1H)、8. 32(d, 1H)、8. 23(d, 1H)、4. 65(q, 2H)、3. 89(s, 3H)、3. 82(q, 2H)、1. 38(t, 3H)、	20
6-4	8. 78(d, 1H)、8. 54(d, 1H)、8. 32(s, 1H)、8. 31(d, 1H)、8. 22(d, 1H)、4. 75(t, 2H)、3. 89(s, 3H)、3. 82(q, 2H)、1. 37(t, 3H)、	
6-5	8. 78(d, 1H)、8. 54(d, 1H)、8. 32(s, 1H)、8. 31(d, 1H)、8. 22(d, 1H)、5. 91(tt, 1H)、4. 70(t, 2H)、3. 89(s, 3H)、3. 82(q, 2H)、1. 37(t, 3H)、	
6-17	8. 76(d, 1H)、8. 48(d, 1H)、8. 31(d, 1H)、8. 24(s, 1H)、8. 21(d, 1H)、4. 26(t, 2H)、3. 88(s, 3H)、3. 80(q, 2H)、1. 78(td, 2H)、1. 37(t, 3H)、1. 01(t, 3H)	30
6-21	8. 77(d, 1H)、8. 51(d, 1H)、8. 31(d, 1H)、8. 28(s, 1H)、8. 24(d, 1H)、5. 35(s, 2H)、3. 88(s, 3H)、3. 80(q, 2H)、2. 32(s, 3H)、1. 36(t, 3H)	
6-55	8. 76(d, 1H)、8. 50(d, 1H)、8. 31(d, 1H)、8. 23(d, 1H)、8. 20(s, 1H)、6. 39(td, 1H)、6. 18(d, 1H)、4. 77(d, 2H)、3. 88(s, 3H)、3. 80(q, 2H)、1. 37(t, 3H)	
6-57	8. 76(d, 1H)、8. 47(d, 1H)、8. 31(d, 1H)、8. 21(d, 1H)、8. 20(s, 1H)、4. 30(t, 2H)、3. 88(s, 3H)、3. 79(q, 2H)、1. 75(d, 2H)、1. 46(dd, 2H)、1. 36(t, 3H)、0. 98(t, 3H)	40
6-59	8. 76(d, 1H)、8. 47(d, 1H)、8. 31(d, 1H)、8. 21(d, 1H)、8. 20(s, 1H)、4. 29(t, 2H)、3. 88(s, 3H)、3. 80(q, 2H)、1. 77(d, 2H)、1. 39(dd, 2H)、1. 37(dd, 2H)、1. 37(t, 3H)、0. 93(t, 3H)	

【 0 1 8 7 】

【表 8 5】

第 7 表続き

化合物番号	¹ H-NMRデータ(CDCl ₃)
6-61	8. 76(d, 1H)、8. 48(d, 1H)、8. 30(d, 1H)、8. 22(d, 1H)、8. 20(s, 1H)、5. 50(t, 1H)、4. 80(d, 2H)、3. 87(s, 3H)、3. 80(q, 2H)、1. 81(ds, 3H)、1. 78(s, 3H)、1. 36(t, 3H)

【 0 1 8 8 】

本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉類を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫、白蟻類等の害虫防除に適している。

【 0 1 8 9 】

上記害虫又は線虫類等として以下のものが例示される。

鱗翅目(チョウ目)害虫として例えば、アオイラガ(*Parasa consocia*)、アカキリバ(*Anomis mesogona*)、アゲハ(*Papilio xuthus*)、アズキサヤムシガ(*Matsumuraeses azukivora*)、アズキノメイガ(*Ostrinia scapularis*)、アフリカヨトウ(*Spodoptera exempta*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、アワノメイガ(*Ostrinia furnacalis*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イガ(*Tinea translucens*)、イグサシンムシガ(*Bactra furfurana*)、イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、イネタテハマキ(*Marasmia exigua*)、イネツトムシ(*Parnara guttata*)、イネヨトウ(*Sesamia inferens*)、イモキバガ(*Brachmia triannulella*)、イラガ(*Monema flavescens*)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、ウコンノメイガ(*Pleuroptya ruralis*)、ウメエダシャク(*Cystidia couaggaria*)、ウラナミシジミ(*Lampides boeticus*)、オオスカシバ(*Cephonodes hylas*)、オオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)、オオトビモンシャチホコ(*Phalerodonta manleyi*)、オオミノガ(*Eumeta japonica*)、オオモンシロチョウ(*Pieris brassicae*)、オビカレハ(*Malacosoma neustria testacea*)、カキノヘタムシガ(*Stathmopoda masinissa*)、カキホソガ(*Cuphodes diospyrosella*)、カクモンハマキ(*Archips xylosteanus*)、カブラヤガ(*Agrotis segetum*)、カンショシンクイハマキ(*Tetramoera schistaceana*)、キアゲハ(*Papilio machaon hippocrates*)、キマダラコウモリ(*Endoclyta sinensis*)、ギンモンハモグリガ(*Lyonetia prunifoliella*)、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoneella*)、クリミガ(*Cydia kurokoi*)、クリミドリシンクイガ(*Eucoenogenes aestuosa*)、グレープベリーモス(*Lobesia botrana*)、クロシタアオイラガ(*Latoia sinica*)、クロフタモンマダラメイガ(*Euzophera batangensis*)、クワイホソハマキ(*Phalonidia mesotypa*)、クワゴマダラヒトリ(*Spilosoma imparilis*)、クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、クワヒメハマキ(*Olethreutes mori*)、コイガ(*Tineola bisselliella*)、コウモリガ(*Endoclyta excrescens*)、コクガ(*Nemapogon granellus*)、コスカシバ(*Synanthedon hector*)、コドリング(*Cydia pomonella*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、サザンピンクボラー(*Sesamia calamistis*)、サンカメイガ(*Scirpophaga incertulas*)、シバツトガ(*Pediasia teterrellus*)、ジャガイモガ(*Phthorimaea operculella*)、シャチホコガ(*Stauropus fagi persimilis*)、シロイチモジマダラメイガ(*Etiella zinckenella*)、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera exigua*)、シロテンコウモリ(*Palpifer sexnotata*)、シロナヨトウ(*Spodoptera mauritia*)、イネシロオオメイガ(*Scirpophaga innotata*)、シロモンヤガ(*Xestia c-nigrum*)、スジキリヨトウ(*Spodoptera depravata*)、スジコナマダラメイガ(*Ephestia kuehniella*)、スモエダシャク(*Angerona prunaria*)、セグロシャチホコ(*Clostera anastomosis*)、ソイビーンルーパー(*Pseudoplusia includens*)、ダイズサヤムシガ(*Matsumuraeses falcana*)、タバコガ(*Helicoverpa assulta*)、タマナギンウワバ(*Autographa nigrisigna*)、タマナヤガ(*Agrotis ipsilon*)、チャドクガ(*Euproctis pseudoconspersa*)、チャノコカク

10

20

30

40

50

モンハマキ(*Adoxophyes orana*)、チャノホソガ(*Caloptilia theivora*)、チャハマキ(*Homonagnanima*)、チャマダラメイガ(*Ephestia elutella*)、チャミノガ(*Eumeta minuscula*)、ツマアカシヤチホコ(*Clostera anachoreta*)、ツメクサガ(*Heliothis maritima*)、テングハマキ(*Sparganothis pilleriana*)、トウモロコシメイガ(*Busseola fusca*)、ドクガ(*Euproctis subflava*)、トビモンオオエダシヤク(*Biston robustum*)、トマトフルーツワーム(*Heliothis zea*)、ナカジロシタバ(*Aedia leucomelas*)、ナシイラガ(*Narosoideus flavidorsalis*)、ナシケンモン(*Viminia rumicis*)、ナシチビガ(*Bucculatrix pyrivorella*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、ナシホソガ(*Spulerina astaurota*)、ナシマダラメイガ(*Ectomyelois pyrivorella*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、ネギコガ(*Acrolepiopsis sapporensis*)、ノシメマダラメイガ(*Plodia interpunctella*)、ハイマダラノメイガ(*Hellicula undalis*)、バクガ(*Sitotroga cerealella*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、ハマキガの一種(*Eucosma aporema*)、バラハマキ(*Acleris comariana*)、ヒメクロイラガ(*Scopelodes contractus*)、ヒメシロモンドクガ(*Orgyia thyellina*)、フォールアーミーワーム(*Spodoptera frugiperda*)、フキノメイガ(*Ostrinia zaguliaevi*)、フタオビコヤガ(*Naranga aenescens*)、フタテンカギバモドキ(*Andraca bipunctata*)、ブドウスカシバ(*Paranthrene regalis*)、ブドウズメ(*Acosmeryx castanea*)、ブドウハモグリガ(*Phyllocnistis toparcha*)、ブドウヒメハマキ(*Endopiza viteana*)、ブドウホソハマキ(*Eupoecillia ambigua*)、ベルベットビーンキャタピラー(*Anticarsia gemmatalis*)、ホソバハイイロハマキ(*Cnephasia cinereipalpana*)、マイマイガ(*Lymantria dispar*)、マツカレハ(*Dendrolimus spectabilis*)、マメシンクイガ(*Leguminivora glycinivorella*)、マメノメイガ(*Maruca testulalis*)、マメヒメサヤムシガ(*Matsumuraeses phaseoli*)、マメホソガ(*Caloptilia soyella*)、ミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)、マエウスキノメイガ(*Omiodes indicata*)、ミダレカクモンハマキ(*Archips fuscocupreanus*)、ミツモンキンウワバ(*Acanthoplusia agnata*)、ミノガ(*Bambalina* sp.)、モモシンクイガ(*Carposina niponensis*)、モモノゴマダラノメイガ(*Conogethes punctiferalis*)、モモスカシバ類(*Synanthedon* sp.)、モモハモグリガ(*Lyonetia clerkella*)、モンキアゲハ(*Papilio helenus*)、モンキチョウ(*Colias erate poliographus*)、モンクロシヤチホコ(*Phalera flavescens*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae*)等のシロチョウ類、モンシロドクガ(*Euproctis similis*)、ヤマノイモコガ(*Acrolepiopsis suzukiella*)、ヨーロピアンコーンボラー(*Ostrinia nubilalis*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、ヨモギエダシヤク(*Ascotis selenaria*)、ヨモギオオホソハマキ(*Phtheochroides clandestina*)、リンゴオオハマキ(*Hoshinoa adumbratana*)、リンゴカレハ(*Odonestis pruni japonensis*)、リンゴケンモン(*Triaena intermedia*)、リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana fasciata*)、リンゴコシンクイ(*Grapholita inopinata*)、リンゴシロヒメハマキ(*Spilonota ocellana*)、リンゴハイイロハマキ(*Spilonota lechrispis*)、リンゴハマキクロバ(*Illiberis pruni*)、リンゴヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、リンゴホソガ(*Caloptilia zachrysa*)、リンゴモンハマキ(*Archips breviplicans*)、ワタアカキリバ(*Anomis flava*)、ワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella*)、ワタノメイガ(*Notarcha derogata*)、ワタヘリクロノメイガ(*Diaphania indica*)、ニセアメリカタバコガ(*Heliothis virescens*)、及びワタリンガ(*Earias cupreoviridis*)等が挙げられる。

【 0 1 9 0 】

半翅目(カメムシ目)害虫として例えば、アオクサカメムシ(*Nezara antennata*)、アカスジカスミカメ(*Stenotus rubrovittatus*)、アカスジカメムシ(*Graphosoma rubrolineatum*)、アカヒゲホソミドリカスミカメ(*Trigonotylus coelestialium*)等、アカヒメヘリカメムシ(*Aeschynteles maculatus*)、アカホシカスミカメ(*Creontiades pallidifer*)、アカホシカメムシ(*Dysdercus cingulatus*)、アカホシマルカイアガラムシ(*Chrysomphalus ficus*)、アカマルカイガラムシ(*Aonidiella aurantii*)、アブラゼミ(*Graptopsaltria nigrofuscata*)、アメリカコバナナガカメムシ(*Blissus leucopterus*)、イセリヤカイガラムシ(*Icerya purchasi*)、イチモンジカメムシ(*Piezodorus hybneri*)、イネカメムシ(*Lagynotom*

us elongatus)、イネキイロヒメヨコバイ (*Thaia subrufa*)、イネクロカメムシ (*Scotinophara lurida*)、イバラヒゲナガアブラムシ (*Sitobion ibarae*)、イワサキカメムシ (*Stariodes iwasakii*)、ウスイロマルカイガラムシ (*Aspidiotus destructor*)、ウスモンミドリカスミカメ (*Taylorilygus pallidulus*)、ウメコブアブラムシ (*Myzomumecola*)、ウメシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis prunicola*)、エンドウヒゲナガアブラムシ (*Acyrtosiphon pisum*)、オオクモヘリカメムシ (*Anacanthocoris striicornis*)、オオクロトビカスミカメ (*Ectometopterus micantulus*)、オオトゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris lewisi*)、オオヘリカメムシ (*Molipteryx fuliginosa*)、オオヨコバイ (*Cicadella viridis*)、オカボノアカアブラムシ (*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)、オリーブカタカイガラムシ (*Saissetia oleae*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、カシヒメヨコバイ (*Aguriahana quercus*)、カスミカメムシ類 (*Lygus* spp.)、カバワタフキマダラアブラムシ (*Euceraphis punctipennis*)、カンキツカイガラムシ (*Andaspis kashicola*)、カンキツカタカイガラムシ (*Coccus pseudomagnoliarum*)、カンシャコバナナガカメムシ (*Cavelerius saccharivorus*)、キクグンバイ (*Galeatus spinifrons*)、キクヒメヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphoniella sanborni*)、キマルカイガラムシ (*Aonidiella citrina*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*)、クスグンバイ (*Stephanitis fasciicarinata*)、クストガリキジラミ (*Trioza camphorae*)、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*)、クリトガリキジラミ (*Trioza quercicola*)、クルミグンバイ (*Uhlirites latius*)、グレープリーフホッパー (*Erythroneura comes*)、クロアシホソナガカメムシ (*Paromius exiguus*)、クロカタマルカイガラムシ (*Duplaspidotus claviger*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus*)、クロトビカスミカメ (*Halticicellus insularis*)、クロフツノウンカ (*Perkinsiella saccharicida*)、クロリンゴキジラミ (*Psylla malivorella*)、クワキジラミ (*Anomomeura mori*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinis*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、クワワタカイガラムシ (*Pulvinaria kuwacola*)、コアオカスミカメ (*Apolygus lucorum*)、コバナヒョウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、コミカンアブラムシ (*Toxoptera aurantii*)、サトウキビコナカイガラムシ (*Saccharicoccus sacchari*)、サトウキビネワタムシ (*Geoica lucifuga*)、サトウノウスイロウンカ (*Numata muiri*)、サンホーゼカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、シトラススノースケール (*Unaspis citri*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、シラホシカメムシ (*Eysarcoris ventralis*)、シルバリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)、シロオオヨコバイ (*Cicadella spectra*)、シロマルカイガラムシ (*Aspidiotus hederiae*)、スカシヒメヘリカメムシ (*Liorhyssus hyalinus*)、セグロヒメキジラミ (*Calophya nigridorsalis*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ (*Megoura crassicauda*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ダイズアブラムシ (*Aphis glycines*)、タイワンクモヘリカメムシ (*Leptocorisa oratorius*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、タイワンヒゲナガアブラムシ (*Uroeucon formosanum*)、タバコカスミカメ (*Cyrtopeltis tenuis*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、チャノカタカイガラムシ (*Lecanium persicae*)、チャノクロホシカイガラムシ (*Parlatoria theae*)、チャノマルカイガラムシ (*Pseudaonidia paeoniae*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)、チャバナアオカメムシ (*Plautia stali*)、チューリップネアブラムシ (*Dysaphis tulipae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyrioides*)、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ツバキクロホシカイガラムシ (*Parlatoria camelliae*)、ツマグロアオカスミカメ (*Apolygus spinolai*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、ツヤアオカメムシ (*Glaucias subpunctatus*)、テンサイカスミカメ (*Orthotylus flavosparsus*)、トウモロコシアブラムシ (*Rhopalosiphum maidis*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris parvus*)、トコジラミ (*Cimex lectularius*)、トドキジラミ (*Psylla abietis*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、トベラキジラミ (*Psylla tobirae*)、ナガメ (*Eurydema rugosum*)、ナシアブラムシ (*Schizaphis piricola*)、ナシキジラミ (*Psylla pyricola*)、ナ

シクロホシカイガラムシ (*Parlatoreopsis pyri*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、ナシコナカイガラムシ (*Dysmicoccus wistariae*)、ナシシロナガカイガラムシ (*Lepholaucaspis japonica*)、ナシマルアブラムシ (*Sappaphis piri*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ネギアブラムシ (*Neotoxoptera formosana*)、ハスクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum nymphaeae*)、バラヒメヨコバイ (*Edwardsianarosae*)、ハランナガカイガラムシ (*Pinnaspisaspidistrae*)、ハンノキジラミ (*Psylla alni*)、ハンノナガヨコバイ (*Speusotettix subfuscus*)、ハンノヒメヨコバイ (*Alnetoidia alneti*)、ヒエウンカ (*Sogatella panicicola*)、ヒゲナガカスミカメ (*Adelphocoris lineolatus*)、ヒメアカホシカメムシ (*Dysdercus poecilus*)、ヒメクロカイガラムシ (*Parlatoria ziziphi*)、ヒメグンバイ (*Uhlerites debile*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、ヒメハリカメムシ (*Cletus trigonus*)、ヒメフタテナガアワフキ (*Clovium punctata*)、ヒメヨコバイ類 (*Empoasca* sp.)、ヒラタカカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ヒラタヒョウタンナガカメムシ (*Pachybrachius luridus*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、フタスジカスミカメ (*Stenotus binotatus*)、フタテンヒメヨコバイ (*Arboridia apicalis*)、フタテンヨコバイ (*Macrostes fascifrons*)、ブチヒゲカメムシ (*Dolycoris baccarum*)、ブチヒゲクロカスミカメ (*Adelphocoris triannulatus*)、ブドウネアブラムシ (*Viteus vitifolii*)、ホオズキカメムシ (*Acanthocoris sordidus*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocoris acuta*)、ホソコバナナガカメムシ (*Macropes obnubilus*)、ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、ポテトピシリド (*Paratrioza cockerelli*)、マエキアワフキ (*Aphrophora costalis*)、マキバカスミカメ (*Lygus disponi*)、マダラカスミカメ (*Lygus saundersi*)、マツコナカイガラムシ (*Crisicoccus pini*)、マツヒメヨコバイ (*Empoasca abietis*)、マツモトコナカイガラムシ (*Crisicoccus matsumotoi*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、マルカメムシ (*Megacopta punctatissimum*)、マルシラホシカメムシ (*Eysarcoris guttiger*)、ミカンカキカイガラムシ (*Lepidosaphes beckii*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*)、ミカンヒメコナカイガラムシ (*Pseudococcus citriculus*)、ミカンヒメヨコバイ (*Zyginella citri*)、ミカンヒメワタカイガラムシ (*Pulvinaria citricola*)、ミカンヒラタカイガラムシ (*Coccus discrepans*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria aurantii*)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、ムギカスミカメ (*Stenodema calcaratum*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ムギヒゲナガアブラムシ (*Sitobion akebiae*)、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphis graminum*)、ムギヨコバイ (*Sorhoanus tritici*)、ムギワラギクオマルアブラムシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ムラサキカメムシ (*Carpocoris purpureipennis*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*)、ヤナギアブラムシ (*Aphis farinose yanagicola*)、ヤナギグンバイ (*Metasalis populi*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)、ヤマアサキジラミ (*Mesohomotoma camphorae*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、リンゴアブラムシ (*Aphis pomi*)、リンゴカキカイガラムシ (*Lepidosaphes ulmi*)、リンゴキジラミ (*Psylla mali*)、リンゴクロカスミカメ (*Heterocordylus flavipes*)、リンゴコブアブラムシ (*Myzus malisuctus*)、リンゴネアブラムシ (*Aphidonuguis mali*)、リンゴマダラヨコバイ (*Orientus ishidai*)、リンゴミドリアブラムシ (*Ovatus malicolens*)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、及びワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) 等が挙げられる。

【 0 1 9 1 】

鞘翅目 (コウチュウ目) 害虫として例えば、アオスジカミキリ (*Xystrocera globosa*)、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*)、アオハナムグリ (*Eucetonia roelofsi*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、アリモドキゾウムシ (*Cylas formicari*)

us)、アルファルファタコゾウムシ(*Hypera postica*)、イネゾウムシ(*Echinocnemus squameus*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、イネネクイハムシ(*Donacia provosti*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、イモサルハムシ(*Colasposoma dauricum*)、イモゾウムシ(*Euscepes postfasciatus*)、インゲンテントウ(*Epilachna varivestis*)、インゲンマメゾウムシ(*Acanthoscelides obtectus*)、ウエスタンコーンルートワーム(*Diabrotica virgifera virgifera*)、ウメチョッキリゾウムシ(*Involvulus cupreus*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、エンドウゾウムシ(*Bruchus pisorum*)、オオニジュウヤホシテントウ(*Epilachna vigintioctomaculata*)、ガイマイデオキスイ(*Carpophilus dimidiatus*)、カメノコハムシ(*Cassida nebulosa*)、キアシノミハムシ(*Luperomorpha tunebrrosa*)、クスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、キボシカミキリ(*Psacotheta hilaris*)、キマダラカミキリ(*Aeolesthes chrysothrix*)、クリシギゾウムシ(*Curculio sikkimensis*)、クリヤケシキスイ(*Carpophilus hemipterus*)、コアオハナムグリ(*Oxycetonia jucunda*)、コーンルートワーム類(*Diabrotica* spp.)、コガネムシ(*Mimela splendens*)、コクゾウムシ(*Sitophilus zeamais*)、コクヌストモドキ(*Tribolium castaneum*)、ココクゾウムシ(*Sitophilus oryzae*)、コヒメコクヌストモドキ(*Palorus subdepressus*)、コフキコガネ(*Melolontha japonica*)、ゴマダラカミキリ(*Anoplophora malasiaca*)、ゴミムシダマシ(*Neatus picipes*)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)、サザンコーンルートワーム(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、シバオサゾウムシ(*Sphenophorus venatus*)、ジュウシホシクビナガハムシ(*Crioceris quatuordecimpunctata*)、スモモゾウムシ(*Conotrachelus nenuphar*)、ダイコンサルゾウムシ(*Ceuthorrhynchidius albosuturalis*)、ダイコンハムシ(*Phaedon brassicae*)、タバコシバンムシ(*Lasioderma serricornis*)、チビコフキゾウムシ(*Sitona japonicus*)、チャイロコガネ(*Adoretus tenuimaculatus*)、チャイロコメノゴミムシダマシ(*Tenebrio molitor*)、チャイロサルハムシ(*Basililepta balyi*)、ツメクサタコゾウムシ(*Hypera nigrirostris*)、テンサイトビハムシ(*Chaetocnema concinna*)、ドウガネブイブイ(*Anomala cuprea*)、ナガチャコガネ(*Heptophylla picea*)、ニジュウヤホシテントウ(*Epilachna vigintioctopunctata*)、ノーザンコーンルートワーム(*Diabrotica longicornis*)、ハナムグリ(*Eucetonia pilifera*)、ハリガネムシ類(*Agriotes* spp.)、ヒメカツオブシムシ(*Attagenus unicolor japonicus*)、ヒメキバネサルハムシ(*Pagria signata*)、ヒメコガネ(*Anomala rufocuprea*)、ヒメコクヌストモドキ(*Palorus ratzeburgii*)、ヒメゴミムシダマシ(*Alphitobius laevigatus*)、ヒメマルカツオブシムシ(*Anthrenus verbasci*)、ヒラタキクイムシ(*Lyctus brunneus*)、ヒラタコクヌストモドキ(*Tribolium confusum*)、フタスジヒメハムシ(*Medythia nigrobilineata*)、ブドウトラカミキリ(*Xylotrechus pyrrhoderus*)、ポテトフリービートル(*Epitrix cucumeris*)、マツノキクイムシ(*Tomicus piniperda*)、マツノマダラカミキリ(*Monochamus alternatus*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、マメハンミョウ(*Epicauta gorhami*)、メイズウィービル(*Sitophilus zeamais*)、モモチョッキリゾウムシ(*Rhynchites heros*)、ヤサイゾウムシ(*Listroderes costirostris*)、ヨツモンマメゾウムシ(*Callosobruchus maculatus*)、リンゴコフキゾウムシ(*Phyllobius armatus*)、リンゴハナゾウムシ(*Anthonomus pomorum*)、ルリハムシ(*Linnaeidea aenea*)、及びワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*)等が挙げられる。

【 0 1 9 2 】

双翅目(ハエ目)害虫として例えば、アカイエカ(*Culex pipiens pallens*)、アカザモグリハナバエ(*Pegomya hyoscyami*)、アシグロハモグリバエ(*Liriomyza huidobrensis*)、イエバエ(*Musca domestica*)、イネキモグリバエ(*Chlorops oryzae*)、イネクキミギワバエ(*Hydrellia sasakii*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、イネヒメハモグリバエ(*Hydrellia griseola*)、イネミギワバエ(*Hydrellia griseola*)、インゲンモグリバエ(*Ophiomyia phaseoli*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、オウトウシヨウジョウバエ(*Drosophila suzukii*)、オウトウハマダラミバエ(*Rhacochlaena japonica*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、オオキモンノミバエ(*Megaselia spiracularis*)等のノミバエ類、オオチョウバエ(*Clogmia albipunctata*)、キリウジガガンボ(*Tipula aino*)、クロキンバ

エ (*Phormia regina*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus*)、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*)、ダイコンバエ (*Hylemya brassicae*)、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia* sp.)、タネバエ (*Delia platura*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*)、ヨーロッパオウトウミバエ (*Rhagoletis cerasi*)、チカイエカ (*Culex pipiens molestus* Forskal)、チチュウカイミバエ (*Ceratitis capitata*)、チビクロバネキノコバエ (*Bradysia agrestis*)、テンサイモグリハナバエ (*Pegomya cunicularia*)、トマトハモグリバエ (*Liriomyza sativae*)、ナスハモグリバエ (*Liriomyza bryoniae*)、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*)、ネギハモグリバエ (*Liriomyza chinensis*)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*)、ネッタيشマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*)、トマトハモグリバエ (*Liriomyza sativae*)、ミカンコミバエ (*Dacus dorsalis*)、ミカンバエ (*Dacus tsuneonis*)、ムギアカタマバエ (*Sitodiplosis mosellana*)、ムギキモグリバエ (*Meromyza nigriventris*)、メキシコミバエ (*Anastrepha ludens*)、及びリンゴミバエ (*Rhagoletis pomonella*)等が挙げられる。

10

【0193】

膜翅目 (ハチ目) 害虫として例えば、アミメアリ (*Pristomyrmex pungens*)、アリガタバチ類、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、オオズアリ (*Pheidole noda*)、カブラハバチ (*Athalia rosae*)、クリタマバチ (*Dryocosmus kuriphilus*)、クロヤマアリ (*Formica fusca japonica*)、スズメバチ類、セグロカブラハバチ (*Athalia infumata infumata*)、チュウレンジハバチ (*Arge pagana*)、ニホンカブラハバチ (*Athalia japonica*)、ハキリアリ (*Acromyrmex* spp.)、ファイヤーアント (*Solenopsis* spp.)、リンゴハバチ (*Arge mali*)、及びルリアリ (*Ochetellus glaber*)等が挙げられる。

20

【0194】

直翅目 (バッタ目) 害虫として例えば、クサキリ (*Homorocoryphus lineosus*)、ケラ (*Grylotalpa* sp.)、コイナゴ (*Oxya hyla intricata*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、ハネナガイナゴ (*Oxya japonica*)、ヒメクサキリ (*Homorocoryphus jezoensis*)、及びエンマコオロギ (*Teleogryllus emma*)等が挙げられる。

【0195】

アザミウマ目害虫として例えば、アカオビアザミウマ (*Selenothrips rubrocinctus*)、イネアザミウマ (*Stenchaetothrips biformis*)、イネクダアザミウマ (*Haplothrips aculeatus*)、カキクダアザミウマ (*Ponticulothrips diospyrosi*)、キイロハナアザミウマ (*Thrips flavus*)、クサキイロアザミウマ (*Anaphothrips obscurus*)、クスクダアザミウマ (*Liothrips floridensis*)、グラジオラスアザミウマ (*Thrips simplex*)、クロゲハナアザミウマ (*Thrips nigropilosus*)、クロトンアザミウマ (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、クワアザミウマ (*Pseudodendrothrips mori*)、コスモスアザミウマ (*Microcephalothrips abdominalis*)、シイオナガクダアザミウマ (*Leeuwenia pasanii*)、シイマルクダアザミウマ (*Litotethrips pasaninae*)、シトラススリップス (*Scirtothrips citri*)、シナクダアザミウマ (*Haplothrips chinensis*)、ダイズアザミウマ (*Mycterothrips glycines*)、ダイズウスイロアザミウマ (*Thrips setosus*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、チャノクロアザミウマ (*Dendrothrips minowai*)、ツメクサクダアザミウマ (*Haplothrips niger*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ネギクロアザミウマ (*Thrips alliorum*)、ハナアザミウマ (*Thrips hawaiiensis*)、ハナクダアザミウマ (*Haplothrips kurdjumovi*)、ヒゲブトアザミウマ (*Chirothrips manicatus*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*)、ビワハナアザミウマ (*Thrips coloratus*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、ユリキイロアザミウマ (*Frankliniella lilivora*)、及びユリノクダアザミウマ (*Liothrips vaneeckei*)等が挙げられる。

30

40

【0196】

ダニ目害虫として例えば、アオツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*)、アシノワハダニ (*Tetranychus ludeni*)、アメリカンドックチック (*Dermacentor variabilis*)、イシイナミハダニ (*Tetranychus truncatus*)、イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*)、イヌニキビダニ (*Demodex canis*)、オウトウハダニ (*Tetranychus viennensis*)、カンザワハダニ (*Tetr*

50

anychus kanzawai)、クリイロコイタマダニ(*Rhipicephalus sanguineus*)等のマダニ類、クワガタツメダニ(*Cheyletus malaccensis*)、ケナガコナダニ(*Tyrophagus putrescentiae*)、コナヒョウヒダニ(*Dermatophagoides farinae*)、セアカゴケグモ(*Latrodectus hasseltii*)、タイワンカクマダニ(*Dermacentor taiwanicus*)、チャノナガサビダニ(*Acaphylla t heavagrans*)、チャノホコリダニ(*Polyphagotarsonemus latus*)、トマトサビダニ(*Aculops lycopersici*)、トリサシダニ(*Ornithonyssus sylvaivum*)、ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)、ニセナシサビダニ(*Eriophyes chibaensis*)、ヒゼンダニ(*Sarcoptes scabiei*)、フタトゲチマダニ(*Haemaphysalis longicornis*)、ブラックレグドチック(*Ixodes scapularis*)、ハウレンソウケナガコナダニ(*Tyrophagus similis*)、ホソツメダニ(*Cheyletus eruditus*)、ミカンハダニ(*Panonychus citri*)、ミナミツメダニ(*Cheyletus moorei*)、ミナミヒメハダニ(*Brevipalpus phoenicis*)、ミミヒゼンダニ(*Octodectes cynotis*)、ヤケヒョウヒダニ(*Dermatophagoides ptrenyssnus*)、ヤマトチマダニ(*Haemaphysalis flava*)、ヤマトマダニ(*Ixodes ovatus*)、リュウキュウミカンサビダニ(*Phyllocoptruta citri*)、リンゴサビダニ(*Aculus schlechtendali*)、リンゴハダニ(*Panonychus ulmi*)、ローンスターチック(*Amblyomma americanum*)、及びワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、ロビンネダニ(*Rhizoglyphus robini*)、ネダニモドキの一種(*Sancassania sp.*)等が挙げられる。

【0197】

シロアリ目害虫として例えば、アマミシロアリ(*Reticulitermes miyatakei*)、アメリカカンザイシロアリ(*Incisitermes minor*)、イエシロアリ(*Coptotermes formosanus*)、オオシロアリ(*Hodotermopsis japonica*)、カンモンシロアリ(*Reticulitermes sp.*)、キアシシロアリ(*Reticulitermes flaviceps amamianus*)、クシモトシロアリ(*Glyptotermes kushimensis*)、コウシュウイエシロアリ(*Coptotermes guangzhoensis*)、コウシュンシロアリ(*Neotermes koshunensis*)、コダマシロアリ(*Glyptotermes kodamai*)、サツマシロアリ(*Glyptotermes satsumensis*)、ダイコクシロアリ(*Cryptotermes domesticus*)、タイワンシロアリ(*Odontotermes formosanus*)、ナカジマシロアリ(*Glyptotermes nakajimai*)、ニトベシロアリ(*Pericapritermes nitobei*)、及びヤマトシロアリ(*Reticulitermes speratus*)等が挙げられる。

【0198】

ゴキブリ目害虫として例えば、クロゴキブリ(*Periplaneta fuliginosa*)、チャバネゴキブリ(*Blattella germanica*)、トウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis*)、トビイロゴキブリ(*Periplaneta brunnea*)、ヒメチャバネゴキブリ(*Blattella lituricollis*)、ヤマトゴキブリ(*Periplaneta japonica*)、及びワモンゴキブリ(*Periplaneta americana*)等が挙げられる。

【0199】

ノミ目として例えば、ヒトノミ(*Pulex irritans*)、ネコノミ(*Ctenocephalides felis*)、及びニワトリノミ(*Ceratophyllus gallinae*)等が挙げられる。

【0200】

線虫類として例えば、イチゴメセンチュウ(*Nothotylenchus acris*)、イネシンガレセンチュウ(*Aphelenchoides besseyi*)、キタネグサレセンチュウ(*Pratylenchus penetrans*)、キタネコブセンチュウ(*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ(*Meloidogyne incognita*)、ジャガイモシストセンチュウ(*Globodera rostochiensis*)、ジャワネコブセンチュウ(*Meloidogyne javanica*)、ダイズシストセンチュウ(*Heterodera glycines*)、ミナミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus coffeae*)、ムギネグサレセンチュウ(*Pratylenchus neglectus*)、及びミカンネセンチュウ(*Tylenchus semipenetrans*)等が挙げられる。

【0201】

軟体動物類として例えば、スクミリンゴガイ(*Pomacea canaliculata*)、アフリカマイマイ(*Achatina fulica*)、ナメクジ(*Meghimatium bilineatum*)、チャコウラナメクジ(*Lehmannina valentiana*)、コウラナメクジ(*Limax flavus*)、及びウスカワマイマイ(*Acusta despecta sieboldiana*)等が挙げられる。

10

20

30

40

50

【 0 2 0 2 】

また、本発明の農園芸用殺虫剤は、その他の害虫としてトマトキバガ (*Tuta absoluta*) に対しても強い殺虫効果を有するものである。

【 0 2 0 3 】

また防除対象の一つである動物寄生性のダニとして例えば、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campanulata*)、イスカチマダニ (*Haemaphysalis concinna*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis japonica*)、ヒゲナガチマダニ (*Haemaphysalis kitaokai*)、イヤスチマダニ (*Haemaphysalis ias*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*)、シュルツエマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megaspinosa*)、アミノカクマダニ (*Dermacentor reticulatus*)、及びタイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanesis*) のようなマダニ類、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、及びミナミトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*) のようなトリサシダニ類、ナンヨウツツガムシ (*Eutrombicula wichmanni*)、アカツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*)、フトゲツツガムシ (*Leptotrombidium pallidum*)、フジツツガムシ (*Leptotrombidium fuji*)、トサツツガムシ (*Leptotrombidium tosa*)、ヨーロッパアキダニ (*Neotrombicula autumnalis*)、アメリカツツガムシ (*Eutrombicula alfreddugesi*)、及びミヤガワタマツツガムシ (*Helenicula miyagawai*) のようなツツガムシ類、イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*)、ウサギツメダニ (*Cheyletiella parasitivorax*)、及びネコツメダニ (*Cheyletiella blakei*) のようなツメダニ類、ウサギキュウセンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウシシヨクヒダニ (*Chorioptes bovis*)、イヌミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、及びネコシヨウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*) のようなヒゼンダニ類、並びにイヌニキビダニ (*Demodex canis*) のようなニキビダニ類等が挙げられる。

【 0 2 0 4 】

他の防除対象であるノミとして例えば、ノミ目 (*Siphonaptera*) に属する外部寄生性無翅昆虫、より具体的には、ヒトノミ科 (*Pulicidae*)、及びナガノミ科 (*Ceratophyllus*) などに属するノミ類が挙げられる。ヒトノミ科に属するノミ類としては、例えば、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、ニワトリフトノミ (*Echidnophaga gallinacea*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)、メクラネズミノミ (*Leptopsylla segnis*)、ヨーロッパネズミノミ (*Nosopsyllus fasciatus*)、及びヤマトネズミノミ (*Monopsyllus anisus*) 等が挙げられる。

【 0 2 0 5 】

さらに他の防除対象である外部寄生生物としては例えば、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ウマジラミ (*Haematopinus asini*)、ヒツジジラミ (*Dalmanella ovis*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ケジラミ (*Phthirus pubis*)、及びアタマジラミ (*Pediculus capitis*) のようなシラミ類、並びにイヌハジラミ (*Trichodectes canis*) のようなハジラミ類、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、ウアイヌカ (*Culicoides schultzei*)、及びツメトゲブユ (*Simulium ornatum*) のような吸血性双翅目害虫などが挙げられる。また内部寄生生物としては例えば、肺虫、ベンチュウ、結節状ウオーム、胃内寄生虫、回虫、及び糸状虫類のような線虫類、マンソン裂頭条虫、広節裂頭条虫、瓜実条虫、多頭条虫、単包条虫、及び多包条虫のような条虫類、日本住血吸虫、及び肝蛭のような吸虫類、並びにコクシジウム、マラリア原虫、腸内肉胞子虫、トキソプラズマ、及びクリプトスポリジウムのような原生動物等が挙げられる。

【 0 2 0 6 】

本発明の一般式 (1) で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花

10

20

30

40

50

卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で育苗施設、水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌等の栽培担体等に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。中でも、作物、花卉等の育苗土壌、移植時の植え穴土壌、株元、灌漑水、水耕栽培における栽培水等に処理して、土壌を介し又は介さずして根から本発明化合物を吸収させることによるいわゆる浸透移行性を利用した施用が好ましい使用形態である。

【0207】

本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる有用植物は特に限定されるものではないが、例えば穀類（例えば、稲、大麦、小麦、ライ麦、オート麦、とうもろこし等）、豆類（大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、いんげん豆、落花生等）、果樹・果実類（林檎、柑橘類、梨、葡萄、桃、梅、桜桃、胡桃、栗、アーモンド、バナナ等）、葉・果菜類（キャベツ、トマト、ほうれんそう、ブロッコリー、レタス、たまねぎ、ねぎ（あさつき、わけぎ）、ピーマン、なす、いちご、ペッパー、おくら、にら等）、根菜類（にんじん、馬鈴薯、さつまいも、さといも、だいこん、かぶ、れんこん、ごぼう、にんにく、らっきょう等）、加工用作物（棉、麻、ビート、ホップ、さとうきび、てんさい、オリーブ、ゴム、コーヒー、タバコ、茶等）、ウリ類（かぼちゃ、きゅうり、すいか、まくわうり、メロン等）、牧草類（オーチャードグラス、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファ等）、芝類（高麗芝、ベントグラス等）、香料等鑑賞用作物（ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、胡椒、生姜等）、花卉類（きく、ばら、カーネーション、蘭、チューリップ、ゆり等）、庭木（いちょう、さくら類、あおき等）、林木（トドマツ類、エゾマツ類、松類、ヒバ、杉、桧、コウカリ等）等の植物を挙げることができる。

【0208】

上記「植物」には、イソキサフルトール等のHPPD阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のALS阻害剤、グリホサート等のEPSP合成酵素阻害剤、グルホシネート等のグルタミン合成酵素阻害剤、セトキシジム等のアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤、プロモキシニル、ジカンバ、2,4-D等の除草剤に対する耐性を古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により耐性を付与された植物も含まれる。

【0209】

古典的な育種法により耐性を付与された「植物」の例としては、イマゼタピル等のイミダゾリノン系ALS阻害型除草剤に耐性のナタネ、コムギ、ヒマワリ、イネがありClearfield（登録商標）の商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によるチフェンスルフロンメチル等のスルホニルウレア系ALS阻害型除草剤に耐性のダイズがあり、STSダイズの商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によりトリオンオキシム系、アリアルオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤などのアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物の例としてSRコーン等がある。

またアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物はプロシーディングズ・オブ・ザ・ナショナル・アカデミー・オブ・サイエンシーズ・オブ・ザ・ユナイテッド・ステーツ・オブ・アメリカ（Proc. Natl. Acad. Sci. USA）87巻、7175～7179頁（1990年）等に記載されている。またアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の変異アセチルCoAカルボキシラーゼがウィード・サイエンス（Weed Science）53巻、728～746頁（2005年）等に報告されており、こうした変異アセチルCoAカルボキシラーゼ遺伝子を遺伝子組換え技術により植物に導入するもしくは抵抗性付与に関わる変異を植物アセチルCoAカルボキシラーゼに導入する事により、アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の植物を作出することができ、さらに、キメラプラスティ技術（Gurata, 1999, Repairing the Genome's Spelling Mistakes, Science 285: 316-318.）に代表される塩基置換変異導入核酸を植物細胞内に導入して植物のアセチルCoAカルボキシラーゼ遺伝子やALS遺伝子等に部位特異的アミノ酸置換変異を導入することにより、アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤やALS阻

10

20

30

40

50

害剤等に耐性の植物を作出することができ、これらの植物に対しても本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる。

【0210】

更に遺伝子組換え植物で発現される毒素として、バチルス・セレウスやバチルス・ポリリエ由来の殺虫性タンパク、バチルス・チューリングェンシス由来のCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C等の - エンドトキシン、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパク、線虫由来の殺虫タンパク、さそり毒素、クモ毒素、ハチ毒素または昆虫特異的神経毒素等動物によって産生される毒素、糸状菌類毒素、植物レクチン、アグルチニン、トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パバイン阻害剤等のプロテアーゼ阻害剤、リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サボリン、プリオジン等のリボゾーム不活性化タンパク(RIP)、3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グルコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ等のステロイド代謝酵素、エクダイソン阻害剤、HMG-CoAリダクターゼ、ナトリウムチャンネル、カルシウムチャンネル阻害剤等のイオンチャンネル阻害剤、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼ、グルカナーゼ等が挙げられる。

10

【0211】

またこの様な遺伝子組換え植物で発現される毒素として、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1、Cry9C、Cry34AbまたはCry35Ab等の - エンドトキシンタンパク、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパクのハイブリッド毒素、一部を欠損した毒素、修飾された毒素も含まれる。ハイブリッド毒素は組換え技術を用いて、これらタンパクの異なるドメインの新しい組み合わせによって作り出される。一部を欠損した毒素としては、アミノ酸配列の一部を欠損したCry1Abが知られている。修飾された毒素としては、天然型の毒素のアミノ酸の1つまたは複数置換されている。

20

これら毒素の例及びこれら毒素を合成することができる組換え植物は、EP-A-0374753、WO93/07278、WO95/34656、EP-A-0427529、EP-A-451878、WO03/052073等に記載されている。

【0212】

これらの組換え植物に含まれる毒素は、特に、甲虫目害虫、半翅目害虫、双翅目害虫、鱗翅目害虫、線虫類への耐性を植物に付与する。本発明の農園芸用殺虫剤はそれらの技術と併用、あるいは体系化して用いることもできる。

30

【0213】

本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫あるいは線虫防除に有効な量を当該害虫および線虫の発生が予測される植物に使用すればよく、例えば果樹、穀類、野菜等において発生する害虫および線虫に対しては茎葉部に散布する他に、種子の薬剤への浸漬、種子粉衣、カルパー処理等の種子処理、土壌全層混和、作条施用、床土混和、セル苗処理、植え穴処理、株元処理、トップドレス、イネの箱処理、水面施用等、土壌等に処理して根から吸収させて使用することもできる。加えて、養液(水耕)栽培における養液への施用、くん煙あるいは樹幹注入等による使用もできる。

40

更に、本発明の農園芸用殺虫剤は、そのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される場所に使用すればよく、例えば貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫、森林害虫等に散布する他に、家屋建材への塗布、くん煙、ベイト等として使用することもできる。

【0214】

種子処理の方法としては、例えば、液状又は固体状の製剤を希釈又は希釈せずして液体状態にて種子を浸漬して薬剤を浸透させる方法、固形製剤又は液状製剤を種子と混和、粉衣処理して種子の表面に付着させる方法、樹脂、ポリマー等の付着性の担体と混和して種

50

子にコーティングする方法、植え付けと同時に種子付近に散布する方法等が挙げられる。

当該種子処理を行う「種子」とは、植物の繁殖に用いられる栽培初期の植物体を意味し、例えば、種子の他、球根、塊茎、種芋、株芽、むかご、鱗茎、あるいは挿し木栽培用の栄養繁殖用の植物体を挙げることができる。

本発明の使用方法を実施する場合の植物の「土壌」又は「栽培担体」とは、作物を栽培するための支持体、特に根を生えさせる支持体を示すものであり、材質は特に制限されないが、植物が生育しうる材質であれば良く、いわゆる土壌、育苗マット、水等であっても良く、具体的な素材としては例えば、砂、軽石、パーミキュライト、珪藻土、寒天、ゲル状物質、高分子物質、ロックウール、グラスウール、木材チップ、パーク等であっても良い。

10

【0215】

作物茎葉部又は貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫若しくは森林害虫等への散布方法としては、乳剤、フロアブル剤等の液体製剤又は水和剤もしくは顆粒水和剤等の固形製剤を水で適宜希釈し、散布する方法、粉剤を散布する方法、又はくん煙等が挙げられる。

土壌への施用方法としては、例えば、液体製剤を水に希釈又は希釈せずして植物体の株元または育苗用苗床等に施用する方法、粒剤を植物体の株元又は育苗のための苗床等に散布する方法、播種前または移植前に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布し土壌全体と混和する方法、播種前または植物体を植える前に植え穴、作条等に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布する方法等が挙げられる。

【0216】

20

水稻の育苗箱への施用方法としては、剤型は、例えば播種時施用、緑化期施用、移植時施用などの施用時期により異なる場合もあるが、粉剤、顆粒水和剤、粒剤等の剤型で施用すればよい。培土との混和によっても施用することができ、培土と粉剤、顆粒水和剤又は粒剤等との混和、例えば、床土混和、覆土混和、培土全体への混和等することができる。単に、培土と各種製剤を交互に層状にして施用してもよい。

水田への施用方法としては、ジャンボ剤、パック剤、粒剤、顆粒水和剤等の固形製剤、フロアブル、乳剤等の液体状製剤を、通常は、湛水状態の水田に散布する。その他、田植え時には、適当な製剤をそのまま、あるいは、肥料に混和して土壌に散布、注入することもできる。また、水口や灌漑装置等の水田への水の流入元に乳剤、フロアブル等の薬液を利用することにより、水の供給に伴い省力的に施用することもできる。

30

【0217】

畑作物においては、播種から育苗期において、種子又は植物体に近接する栽培担体等へ処理ができる。畑に直接播種する植物においては、種子への直接処理の他、栽培中の植物の株元への処理が好適である。粒剤を用いて散布処理又は水に希釈あるいは希釈しない薬剤を液状にて灌注処理を行うこと等ができる。粒剤を播種前の栽培担体と混和させた後、播種するのも好ましい処理である。

移植を行う栽培植物の播種、育苗期の処理としては、種子への直接処理の他、育苗用苗床への、液状とした薬剤の灌注処理又は粒剤の散布処理が好ましい。また、定植時に粒剤を植え穴に処理をしたり、移植場所近辺の栽培担体に混和することも好ましい処理である。

40

本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

【0218】

本発明の組成物(農園芸用殺虫剤又は動物寄生生物防除剤)は、有効成分の他に必要に応じて農薬製剤又は動物寄生生物防除剤に通常用いられる添加成分を含有することができ

50

る。この添加成分としては、固体担体、液体担体等の担体、界面活性剤、分散剤、湿潤剤、結合剤、粘着付与剤、増粘剤、着色剤、拡張剤、展着剤、凍結防止剤、固結防止剤、崩壊剤、分解防止剤等が挙げられる。その他必要に応じ、防腐剤、植物片等を添加成分に用いてもよい。これらの添加成分は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

【0219】

固体担体としては、例えば石英、クレー、カオリナイト、ピロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト、珪藻土等の天然鉱物類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、塩化カリウム等の無機塩類、合成ケイ酸、合成ケイ酸塩、デンプン、セルロース、植物粉末（例えばおがくず、ヤシガラ、トウモロコシ穂軸、タバコ茎等）等の有機固体担体、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、尿素、無機中空体、プラスチック中空体、フュード シリカ (fumed silica, ホワイトカーボン) 等が挙げられる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

10

【0220】

液体担体としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール等の一価アルコール類や、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、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、グリセリン等の多価アルコール類のようなアルコール類、プロピレングリコールエーテル等の多価アルコール化合物類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、エチルエーテル、ジオキサン、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ノルマルパラフィン、ナフテン、イソパラフィン、ケロシン、鉱油等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート、アジピン酸ジメチル等のエステル類、 γ -ブチロラクトン等のラクトン類、ジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-アルキルピロリジノン等のアミド類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド等の硫黄化合物類、大豆油、なたね油、綿実油、ヒマシ油等の植物油、水等を挙げることができる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

20

30

【0221】

分散剤や湿展剤として用いる界面活性剤としては、例えば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、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸ジエステル、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アリアルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンジアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルホルマリン縮合物、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、ポリスチレンポリオキシエチレンブロックポリマー、アルキルポリオキシエチレンポリプロピレンブロックコポリマーエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアミン、ポリオキシエチレン脂肪酸アミド、ポリオキシエチレン脂肪酸ビスフェニルエーテル、ポリアルキレンベンジルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレンスチリルフェニルエーテル、アセチレンジオール、ポリオキシアルキレン付加アセチレンジオール、ポリオキシエチレンエーテル型シリコーン、エステル型シリコーン、フッ素系界面活性剤、ポリオキシエチレンひまし油、ポリオキシエチレン硬化ひまし油等の非イオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキルアリアルスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンス

40

50

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、脂肪酸塩、ポリカルボン酸塩、ポリアクリル酸塩、N-メチル-脂肪酸サルコシネート、樹脂酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルリン酸塩等のアニオン性界面活性剤、ラウリルアミン塩酸塩、ステアリルアミン塩酸塩、オレイルアミン塩酸塩、ステアリルアミン酢酸塩、ステアリルアミノプロピルアミン酢酸塩、アルキルトリメチルアンモニウムクロライド、アルキルジメチルベンザルコニウムクロライド等のアルキルアミン塩等のカチオン界面活性剤、アミノ酸型又はベタイン型等の両性界面活性剤等が挙げられる。これらの界面活性剤は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

10

【0222】

結合剤や粘着付与剤としては、例えばカルボキシメチルセルロースやその塩、デキストリン、水溶性デンプン、キサンタンガム、グアーガム、蔗糖、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリビニルアセテート、ポリアクリル酸ナトリウム、平均分子量6000~20000のポリエチレングリコール、平均分子量10万~500万のポリエチレンオキサイド、燐脂質(例えばセファリン、レシチン等)セルロース粉末、デキストリン、加工デンプン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、架橋ポリビニルピロリドン、マレイン酸とスチレン類の共重合体、(メタ)アクリル酸系共重合体、多価アルコールからなるポリマーとジカルボン酸無水物とのハーフエステル、ポリスチレンスルホン酸の水溶性塩、パラフィン、テルペン、ポリアミド樹脂、ポリアクリル酸塩、ポリオキシエチレン、ワックス、ポリビニルアルキルエーテル、アルキルフェノールホルマリン縮合物、合成樹脂エマルジョン等が挙げられる。

20

【0223】

増粘剤としては、例えばキサンタンガム、グアーガム、ダイユウタンガム、カルボキシメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、アクリル系ポリマー、デンプン化合物、多糖類のような水溶性高分子、高純度ベントナイト、フュームドシリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)のような無機微粉等が挙げられる。

【0224】

着色剤としては、例えば酸化鉄、酸化チタン、ブルシアンブルーのような無機顔料、アリザリン染料、アゾ染料、金属フタロシアニン染料のような有機染料等が挙げられる。

30

【0225】

凍結防止剤としては、例えば、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類等が挙げられる。

【0226】

固結防止や崩壊促進のための補助剤としては、例えばデンプン、アルギン酸、マンノース、ガラクトース等の多糖類、ポリビニルピロリドン、フュームドシリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)、エステルガム、石油樹脂、トリポリリン酸ナトリウム、ヘキサメタリン酸ナトリウム、ステアリン酸金属塩、セルロース粉末、デキストリン、メタクリル酸エステルの共重合体、ポリビニルピロリドン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、スルホン化スチレン・イソブチレン・無水マレイン酸共重合体、デンプン・ポリアクリロニトリルグラフト共重合体等が挙げられる。

40

【0227】

分解防止剤としては、例えばゼオライト、生石灰、酸化マグネシウムのような乾燥剤、フェノール化合物、アミン化合物、硫黄化合物、リン酸化合物等の酸化防止剤、サリチル酸化合物、ベンゾフェノン化合物等の紫外線吸収剤等が挙げられる。

【0228】

防腐剤としては、例えばソルビン酸カリウム、1,2-ベンゾチアゾリン-3-オン等が挙げられる。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等

50

その他の補助剤も使用することができる。

【0229】

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、本発明の農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01~90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば、粉剤、粒剤、乳剤又は水和剤とする場合は0.01~50重量部(農園芸用殺虫剤全体の重量に対して0.01~50重量%)が適当である。

【0230】

本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g~10kg、好ましくは0.01g~1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤は、防除対象病虫害、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、また、使用場面に依りて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

【0231】

かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤として例えば、3,5-xylyl methylcarbamate(XMC)、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis*、*Bacillus thuringiensis*が生成する結晶タンパク毒素、BPMC、Btトキシン系殺虫性化合物、CPCBS(chlorfenson)、DCIP(dichlorodiiisopropyl ether)、D-D(1, 3-Dichloropropene)、DDT、NAC、O-4-dimethylsulfamoylphenyl 0, 0-diethyl phosphorothioate(DSP)、O-ethyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate(EPN)、tripropylisocyanurate (TPIC)、アクリナトリン(acrinathrin)、アザディラクチン(azadirachtin)、アジンホス・メチル(azinphos-methyl)、アセキノシル(acequinocyl)、アセタミプリド(acetamiprid)、アセトプロール(acetoprole)、アセフェート(acephate)、アバメクチン(abamectin)、アベルメクチン(ivermectin-B)、アミドフルメット(amidoflumet)、アミトラズ(amtiaz)、アラニカルブ(alanycarb)、アルジカルブ(aldicarb)、アルドキシカルブ(aldoxycarb)、アルドリン(aldrin)、アルファ-エンドスルファン(alpha-endosulfan)、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、アルベンダゾール(albendazole)、アレスリン(allethrin)、イサゾホス(isazofos)、イサミドホス(isamidofos)、イソアミドホス(isoamidofos)、イソキサチオン(isoxathion)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロカルブ(isoprocarb: MIPC)、イベルメクチン(ivermectin)、イミシアホス(imicyafos)、イミダクロプリド(imidacloprid)、イミプロトリン(imiprothrin)、インドキサカルブ(indoxacarb)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、エチオン(ethion)、エチプロール(ethiprole)、エトキサゾール(etoxazole)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrifos)、エマメクチン(emamectin)、エマメクチンベンゾエート(emamectin-benzoate)、エンドスルファン(endosulfan)、エンペントリン(empenthrin)、オキサミル(oxamyl)、オキシジメトン・メチル(oxdemeton-methyl)、オキシデプロホス(oxdeprofos: ESP)、オキシベンダゾール(oxibendazole)、オクスフェンダゾール(oxfendazole)、オレイン酸カリウム(Potassium oleate)、オレイン酸ナトリウム(sodium oleate)、カズサホス(cadusafos)、カルタップ(cartap)、カルバリル(carbaryl)、カルボスルファン(carbosulfan)、カルボフラン(carbofuran)、ガンマシハロトリン(gamma-cyhalothrin)、キシリルカルブ(xylylcarb)、キナルホス(quinalphos)、キノブレン(kinoprene)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロエトカルブ(cloethocarb)、クロチアニジン(clotianidin)、クロフェンテジン(clofentazine)、クロマフェノジド(chromafenozide)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルジメホルム(chlordimeform)、クロルデン(chlordane)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クロルフェナピル(chlorphen

10

20

30

40

50

apyr)、クロルフェンソン(chlorfenson)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、クロルベンジレート(chlorobenzilate)、クロロベンゾエート(chlorobenzoate)、ケルセン(ジコホル: dicofol)、サリチオン(salithion)、シアノホス(cyanophos: CYAP)、ジアフェンチウロン(diafenthuron)、ジアミダホス(diamidafos)、シアントラニリプロール(cyantraniliprole)、シータ-シベルメトリン(theta-cypermethrin)、ジエノクロル(dienochlor)、シエノピラフェン(cyenopyrafen)、ジオキサベンゾホス(dioxabenzofos)、ジオフェノラン(diufenolan)、シグマ-サイパーメトリン(sigma-cypermethrin)、ジクロフェンチオン(dichlofenthion: ECP)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、ジクロルボス(dichlorvos: DDVP)、ジスルホトン(disulfoton)、ジノテフラン(dinotefuran)、シハロトリン(cyhalothrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、ジフロビダジン(diflovidazin)、シヘキサチン(cyhexatin)、シベルメトリン(cypermethrin)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメフルスリン(dimefluthrin)、シラフルオフエン(silafluofen)、シロマジン(cyromazine)、スピネトラム(spinetoram)、スピノサッド(spinosad)、スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロテトラマト(spirotetramat)、スピロメシフェン(spiromesifen)、スルフルラミド(sulfluramid)、スルプロホス(sulprofos)、スルホキサフロール(sulfoxafloer)、ゼータ-シベルメトリン(zeta-cypermethrin)、ダイアジノン(diazinon)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、ダゾメット(dazomet)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオシクラム(thiocyclam)、チオスルタップ(thiosultap)、チオスルタップナトリウム(thiosultap-sodium)、チオナジン(thionazin)、チオメトン(thiometon)、ディート(deet)、ディルドリン(dieldrin)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、テトラジホン(tetradifon)、テトラメチルフルトリン(tetramethylfluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テブフェノジド(tebufenozide)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、テフルトリン(tefluthrin)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、テムホス(temephos)、デルタメトリン(deltamethrin)、テルブホス(terbufos)、トラロピリル(tralopyril)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、トリアザメート(triazamate)、トリアズロン(triazuron)、トリクラミド(trichlamide)、トリクロルホン(trichlorphon: DEP)、トリフルムロン(triflumuron)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、ナレッド(naled: BRP)、ニチアジン(nithiazine)、ニテンピラム(nitenpyram)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、ハイドロブレン(hydroprene)、バニリプロール(vaniliprole)、バミドチオン(vamidothion)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、ハロフェノジド(halofenozide)、ピストリフルロン(bistrifluron)、ビスルタップ(bisultap)、ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、ヒドロキシプロピルデンブン(hydroxy propyl starch)、ビナパクリル(binapacryl)、ピフェナゼート(bifenazate)、ピフェントリン(bifenthrin)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピラクロホス(pyraclorfos)、ピラフルプロール(pyrafluprole)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、ピリダベン(pyridaben)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、ピリプロール(pyriprole)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、ピリミカーブ(pirimicarb)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ピレトリン(pyrethrins)、フィプロニル(fipronil)、フェナザキン(fenazaquin)、フェナミフォス(fenamiphos)、フェニソプロモレート(bromopropylate)、フェニトロチオン(fenitrothion: MEP)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノトリン(phenothrin)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェンスルフォチオン(fensulfothion)、フェンチオン(fenthion: MPP)、フェントエート(phenthoate: PAP)、フェンバレレート(fenvalerate)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンベンダゾール(fenbendazole)、フォスチアゼート(fosthiazate)、フォルメタネート(formetanate)、ブタチオホス(butathiofos)、ブプロフェ

10

20

30

40

50

ジン(buprofezin)、フラチオカルブ(furathiocarb)、プラレトリン(prallethrin)、フル
 アクリピリム(flucacrypyrim)、フルアジナム(fluzinam)、フルアズロン(fluzaron)、フル
 エンスルホン(fluensulfone)、フルシクロクスロン(flucyclooxuron)、フルシトリネ
 ート(flucythrinate)、フルバリネート(flualinate)、フルピラゾホス(flupyrzofos)、
 フルフェネリム(flufenerim)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、フルフェンジン(flu
 fenazine)、フルフェンプロックス(flufenoprox)、フルプロキシフェン(fluproxyfen)、フル
 プロシスリネート(flubrocycythrinate)、フルベンジアミド(flubendiamide)、フルメト
 リン(flumethrin)、フルリムフェン(flurimfen)、プロチオホス(prothiofos)、プロトリ
 フェンブト(protrifenbute)、フロニカミド(flonicamid)、プロパホス(propaphos)、プロ
 パルギット(propargite: BPPS)、プロフェノホス(profenofos)、プロフルスリン(proflu
 thrin)、プロポキスル(propoxur: PHC)、プロモプロピレート(bromopropylate)、ベータ
 -シフルトリン(beta-cyfluthrin)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ヘキシチアゾクス
 (hexythiazox)、ヘプテノホス(heptenophos)、ペルメトリン(permethrin)、ベンクロチア
 ズ(benclothiaz)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンスルタップ(bensultap)、ベンゾキ
 シメート(benzoximate)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ホキシム(phoxim)、ホサロン(p
 hosalone)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ホスチエタン(fosthietan)、ホスファミドン
 (phosphamidon)、ホスホカルブ(phosphocarb)、ホスメット(phosmet: PMP)、ポリナク
 チン複合体(polynactins)、ホルメタネート(formetanate)、ホルモチオン(formothion)、
 ホレート(phorate)、マシン油(machine oil)、マラチオン(malathion)、ミルベマイシン
 (milbemycin)、ミルベマイシンA(milbemycin-A)、ミルベメクチン(milbemectin)、メカ
 ルバム(mecarbam)、メスルフェンホス(mesulfenfos)、メソミル(methomyl)、メタアルデ
 ヒド(metaldehyde)、メタフルミゾン(metaflumizone)、メタミドホス(methamidophos)
 、メタム・アンモニウム(metam-ammonium)、メタム・ナトリウム(metam-sodium)、メチオ
 カルブ(methiocarb)、メチダチオン(methidathion: DMTP)、メチルイソチオシアネート(m
 ethylisothiocyanate)、メチルネオデカナミド(methylneodecanamide)、メチルパラチオ
 ン(methylparathion)、メトキサジアゾン(metoxadiazone)、メトキシクロル(methoxychlo
 r)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、メトフルトリン(metofluthrin)、メトプレ
 ン(methoprene)、メトルカルブ(metolcarb)、メルフルスリン(meperfluthrin)、メビン
 ホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、モノスルタップ(monosultap)、ラム
 ダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、リアノジン(ryanodine)、ルフエヌロン(lufen
 uron)、レスメトリン(resmethrin)、レピメクチン(lepimectin)、ロテノン(rotenone)、
 塩酸レバミゾール(levamisol hydrochloride)、酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)
 、酒石酸モランテル(morantel tartarate)、臭化メチル(methyl bromide)、水酸化トリシ
 クロヘキシルスズ(cyhexatin)、石灰窒素(calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤(calcium p
 olysulfide)、硫黄(sulfur)、及び硫酸ニコチン(nicotine-sulfate)等を例示することが
 できる。

【0232】

同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤として例えば、アウレオフンギン(aureofungin)
)、アザコナゾール(azaconazole)、アジチラム(azithiram)、アシペタックス(acyp
 etacs)、アシベンゾラル(acibenzolar)、アシベンゾラルSメチル(acibenzolar-S-met
 hyl)、アゾキシストロピン(azoxystrobin)、アニラジン(anilazine)、アミスルプロ
 ム(amisulbrom)、アムプロピルホス(ampropylfos)、アメトクトラジン(ametocradi
 n)、アリルアルコール(allyl alcohol)、アルジモルフ(aldimorph)、アンバム(amob
 am)、イソチアニル(isotianil)、イソバレジオン(isovalledione)、イソピラザム(i
 sopyrazam)、イソプロチオラン(isoprothiolane)、イブコナゾール(ipconazole)、
 イプロジオン(iprodione)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)、イプロベンホス(ipr
 obenfos)、イマザリル(imazalil)、イミノクタジン(iminoctadine)、イミノクタジ
 ンアルベシル酸塩(iminoctadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩(iminoctadine-tr
 iacetate)、イミベンコナゾール(imibenconazole)、ウニコナゾール(uniconazole)
 、ウニコナゾールP(uniconazole-P)、エクロメゾール(echlomezole)、エジフェンホ

ス(edifenphos)、エタコナゾール(etaconazole)、エタボキサム(ethaboxam)、エチ
 リモール(ethirimol)、エテム(etem)、エトキシキン(ethoxyquin)、エトリジアゾ
 ール(etridiazole)、エネストロブリン(enestroburin)、エポキシコナゾール(epoxic
 onazole)、オキサジキシル(oxadixyl)、オキシカルボキシ(oxycarboxin)、オキシ
 キノリン銅(copper-8-quinolinolate)、オキシテトラサイクリン(oxytetracycline)
 、オキシ銅(copper-oxinate)、オクスポコナゾール(oxpoconazole)、オクスポコナゾ
 ールフマル酸塩(oxpoconazole-fumarate)、オキシリニック酸(oxolinic acid)、オク
 チリノン(octhilinone)、オフラセ(ofurace)、オリサストロビン(orysastrobin)、
 カーバム(metam-sodium)、カスガマイシン(kasugamycin)、カルバモルフ(carbamorph)
)、カルプロパミド(carpropamid)、カルベンダジム(carbendazim)、カルボキシ(10
 carboxin)、カルボン(carvone)、キナザミド(quinazamid)、キナセトール(quinace
 tol)、キノキシフェン(quinoxyfen)、キノメチオネート(quinomethionate)、キャプ
 タホル(captafol)、キャプタン(captan)、キララキシル(kiralaxyl)、キンコナ
 ザール(quinconazole)、キントゼン(quintozene)、グアザチン(guazatine)、クフ
 ラネブ(cufraneb)、クプロバム(cuprobam)、グリオジン(glyodin)、グリセオフル
 ビン(griseofulvin)、クリムバゾール(climbazole)、クレゾール(cresol)、クレソ
 キシムメチル(kresoxim-methyl)、クロゾリネート(chlozolate)、クロトリマゾール
 (clotrimazole)、クロベンチアゾン(chlobenthiazole)、クロラニホルメタン(chlor
 aniformethan)、クロラニル(chloranil)、クロルキノックス(chlorquinox)、クロル
 ピクリン(chloropicrin)、クロルフェナゾール(chlorfenazole)、クロロジニトロナ 20
 フタレン(chlorodinitronaphthalene)、クロロタロニル(chlorothalonil)、クロロネ
 ブ(chloroneb)、ザリラミド(zarilamid)、サリチルアニリド(salicylanilide)、シ
 アゾファミド(cyazofamid)、ジエチルピロパカーボナート(diethyl pyrocarbonate)
 、ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、シクラフラミド(cyclafuramid)、シクロシ
 メット(diclocymet)、ジクロゾリン(dichlozoline)、ジクロブトラゾール(diclobut
 razol)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)、シクロヘキシミド(cycloheximide)、ジ
 クロメジン(diclomezine)、ジクロラン(dicloran)、ジクロロフェン(dichlorophen
)、ジクロン(dichlone)、ジスルフィラム(disulfiram)、ジタリムフォス(ditalimf
 os)、ジチアノン(dithianon)、ジニコナゾール(diniconazole)、ジニコナゾールM 30
 (diniconazole-M)、ジネブ(zineb)、ジノカップ(dinocap)、ジノクトン(dinocton
)、ジノスルホン(dinosulfon)、ジノテルボン(dinoterbon)、ジノブトン(dinobuto
 n)、ジノペントン(dinopenton)、ジピリチオン(dipyriithione)、ジフェニルアミン
 (diphenylamine)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、シフルフェナミド(cyflu
 fenamid)、ジフルメトリム(diflumetorim)、シプロコナゾール(cyproconazole)、シ
 プロジニル(cyprodinil)、シプロフラム(cyprofuram)、シペンダゾール(cypendazol
 e)、シメコナゾール(simeconazole)、ジメチリモール(dimethirimol)、ジメトモル
 フ(dimethomorph)、シモキサニル(cymoxanil)、ジモキシストロビン(dimoxystrobin
)、臭化メチル(methyl bromide)、ジラム(ziram)、シルチオフアム(silthiofam)
 、ストレプトマイシン(streptomycin)、スピロキサミン(spiroxamine)、スルトロペ
 ン(sultropen)、セダキサ(sedaxane)、ゾキサミド(zoxamide)、ダゾメット(daz 40
 omet)、チアジアジン(thiadiazin)、チアジニル(tiadinil)、チアジフルオル(thiad
 ifluor)、チアベンダゾール(thiabendazole)、チオキシミド(tioxyimid)、チオクロ
 ルフェンフィム(thiochlorfenphim)、チオフアネート(thiophanate)、チオフアネー
 トメチル(thiophanate-methyl)、チシオフエン(thicyofen)、チノキノックス(thioq
 uinox)、キノメチオネート(chinomethionat)、チオフルザミド(thifluzamide)、チラ
 ム(thiram)、デカフェンチン(decapentin)、テクナゼン(tecnazene)、テクロフタ
 ラム(tecloftalam)、テコラム(tecoram)、テトラコナゾール(tetraconazole)、デ
 バカルブ(debacarb)、デヒドロ酢酸(dehydroacetic acid)、テブコナゾール(tebuco
 nazole)、テブフロキン(tebufloquin)、ドジシン(dodicin)、ドジン(dodine)、ド
 デシルベンゼンスルホン酸ビスエチレンジアミン銅錯塩(II)(DBEDC)、ドデモルフ(do 50

demorph)、ドラゾキシロン(drazoxolon)、トリアジメノール(triadimenol)、トリアジメホン(triadimefon)、トリアズブチル(triazbutil)、トリアゾキシド(triazoxide)、トリアミホス(triamiphos)、トリアリモール(triarimol)、トリクラミド(triclamide)、トリシクラゾール(tricyclazole)、トリチコナゾール(triticonazole)、トリデモルフ(tridemorph)、トリブチルチンオキシド(tributyltin oxide)、トリフルミゾール(triflumizole)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)、トリホリン(triforine)、トリルフルアラニド(tolylfluanid)、トルクロホスメチル(tolclofos-methyl)、ナタマイシン(natamycin)、ナバム(nabam)、ニトロタサルイソプロピル(nitrothal-isopropyl)、ニトロスチレン(nitrostyrene)、ヌアリモール(nuarimol)、ノニルフェノールスルホン酸銅(copper nonylphenol sulfonate)、ハラクリネート(halacrinat) 10、バリダマイシン(validamycin)、バリフェナラート(valifenalate)、ハルピンタンパク(harpin protein)、ビキサフェン(bixafen)、ピコキシストロビン(picoxystrobin)、ピコベンザミド(picobenzamide)、ピチオノール(bithionol)、ピテルタノール(bitertanol)、ヒドロキシイソキサゾール(hydroxyisoxazole)、ヒドロキシイソキサゾールカリウム(hydroisoxazole-potassium)、ビナバクリル(binapacryl)、ピフェニル(biphenyl)、ピペラリン(piperalin)、ヒメキサゾール(hymexazol)、ピラオキシストロビン(pyraoxystrobin)、ピラカルボリド(pyracarbolid)、ピラクロストロビン(pyraclostrobin)、ピラゾホス(pyrazophos)、ピラメトストロビン(pyrametostrobin)、ピリオフェノン(pyriofenone)、ピリジニトリル(pyridinitril)、ピリフェノックス(pyrifenox)、ピリベンカルブ(pyribencarb)、ピリメタニル(pyrimethanil) 20、ピロキシクロル(pyroxychlor)、ピロキシフル(pyroxyfur)、ピロキロン(pyroquilon)、ビンクロゾリン(vinclozolin)、ファミキサドン(famoxadone)、フェナパニル(fenapanil)、フェナミドン(fenamidone)、フェナミノスルフ(fenamino sulf)、フェナリモール(fenarimol)、フェニトロパン(fenitropan)、フェノキサニル(fenoxanil)、フェリムゾン(ferimzone)、フェルバム(ferbam)、フェンチン(fentin)、フェンピクロニル(fenpiclonil)、フェンピラザミン(fenpyrazamine)、フェンブコナゾール(fenbuconazole)、フェンフラム(fenfuram)、フェンプロピジン(fenpropidin)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、フェンヘキサミド(fenhexamid)、フタリド(phthalide)、ブチオベート(buthiobate)、ブチルアミン(butylamine)、ブピリメート(bupirimate)、フベリダゾール(fuberidazole)、ブラストサイジンS(blasticidin-S) 30、フラメトビル(furametpyr)、フララキシル(furalaxyl)、フルアクリピリム(flucacrypyrim)、フルアジナム(fluzazinam)、フルオキサストロビン(fluxastrobin)、フルオトリマゾール(flutrimazole)、フルオピコリド(flupicolide)、フルオピラム(flupopyram)、フルオロイミド(fluoroimide)、フルカルバニル(furcarbamil)、フルキサピロキサド(fluxapyroxad)、フルキンコナゾール(flquinconazole)、フルコナゾール(furconazole)、フルコナゾール-シス(furconazole-cis)、フルジオキシニル(fludioxonil)、フルシラゾール(flusilazole)、フルスルフアミド(flusulfamide)、フルチアニル(flutianil)、フルトラニル(flutolanil)、フルトリアホル(flutriafol)、フルフラール(furfural)、フルメシクロックス(furmecyclox) 40、フルメットベル(flumetover)、フルモルフ(flumorph)、プロキナジド(proquinazid)、プロクロラズ(prochloraz)、プロシミドン(procymidone)、プロチオカルブ(prothiocarb)、プロチオコナゾール(prothioconazole)、プロパモカルブ(propamocarb)、プロピコナゾール(propiconazole)、プロピネブ(propineb)、フロファネート(furophanate)、プロベナゾール(probenazole)、ブロムコナゾール(bromconazole)、ヘキサクロロブタジエン(hexachlorobutadiene)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、ヘキシルチオホス(hexylthiofos)、ベトキサジン(bethoxazin)、ベナラキシル(benalaxyl)、ベナラキシルM(benalaxyl-M)、ベノダニル(benodanil)、ベノミル(benomyl)、ペフラゾエート(pefurazoate)、ベンキノックス(benquinox)、ベンコナゾール(penconazole)、ベンザモルフ(benzamorf)、ペンシクロン(pencycuron)、ベンゾヒドロキサム酸(benzohydroxamic acid)、ベントラルロン(bentaluron)、ベンチアゾ

10

20

30

40

50

ール(benthiazole)、ベンチアバリカルブ-イソプロピル(benthiavalicarb-isopropyl)、ベンチオピラド(penthiopyrad)、ペンフルフェン(penflufen)、ボスカリド(boscalid)、ホスジフェン(phosdiphen)、ホセチル(fosetyl)、ホセチルアルミニウム(fosetyl Al)、ポリオキシソリン(polyoxosilin)、ポリオキシソリン(polyoxorim)、ポリカーバメート(polycarbamate)、ホルベット(folpet)、ホルムアルデヒド(formaldehyde)、マシン油(machine oil)、マネブ(maneb)、マンコゼブ(mancozeb)、マンジプロパミド(mandipropamid)、ミクロゾリン(myclozolin)、ミクロブタニル(myclobutanil)、ミルディオマイシン(mildiomycin)、ミルネブ(milneb)、メカルビンジド(mecarbinid)、メタスルホカルブ(methasulfocarb)、メタゾキシロン(metazoxolon)、メタム(metam)、メタムナトリウム塩(metam sodium)、メタラキシル(metalaxyl)、メタラキシルM(metalaxyl-M)、メチラム(metiram)、メチルイソチオシアナート(methyl isothiocyanate)、メチルジノカップ(mephtyldinocap)、メトコナゾール(metconazole)、メトスルホバックス(metsulfobax)、メトフロキサム(methfuroxam)、メトミノストロビン(metominostrobin)、メトラフェノン(metrafenone)、メパニピリム(mepanipyrim)、メフェノキサム(mefenoxam)、メプチルジノカップ(meptyldinocap)、メプロニル(mepronil)、メベニル(mebenil)、ヨウ化メチル(iodomethane)、ラベンザゾール(rabenzazole)、塩化ベンザルコニウム(benzalkonium chloride)、塩基性塩化銅(basic copper chloride)、塩基性硫酸銅(basic copper sulfate)、金属銀(silver)等の無機殺菌剤、次亜塩素酸ナトリウム(sodium hypochlorite)、水酸化第二銅(cupric hydroxide)、水和硫黄剤(wettable sulfur)、石灰硫黄合剤(calcium polysulfide)、炭酸水素カリウム(potassium hydrogen carbonate)、炭酸水素ナトリウム(sodium hydrogen carbonate)、無機硫黄(sulfur)、無水硫酸銅(copper sulfate anhydride)、ジメチルジチオカルバミド酸ニッケル(nickel dimethyldithiocarbamate)、8-ヒドロキシキノリン銅(oxine copper)のような銅系化合物、硫酸亜鉛(zinc sulfate)、硫酸銅五水塩(copper sulfate pentahydrate)等を例示することができる。

【 0 2 3 3 】

同様に除草剤として例えば、1-ナフチルアセトアミド、2,4-PA、2,3,6-TBA、2,4,5-T、2,4,5-TB、2,4-D、2,4-DB、2,4-DEB、2,4-DEP、3,4-DA、3,4-DB、3,4-DP、4-CPA、4-CPB、4-CPP、MCP、MCPA、MCPAチオエチル、MCPB、アイオキシニル(ioxynil)、アクロニフェン(aclonifen)、アザフェニジン(azafenidin)、アシフルオルフェン(acifluorfen)、アジプロトリン(aziprotryne)、アジムスルフロン(azimsulfuron)、アシュラム(asulam)、アセトクロール(acetochlor)、アトラジン(atrazine)、アトラトン(atraton)、アニスロン(anisuron)、アニロホス(anilofos)、アビグリシン(aviglycine)、アブシジン酸(abscisic acid)、アミカルバゾン(amicarbazone)、アミドスルフロン(amidosulfuron)、アミトロール(amtrole)、アミノシクロピラクロール(aminocyclopyrachlor)、アミノピラリド(aminopyralid)、アミブジン(amibuzin)、アミプロホスメチル(amiprofos-methyl)、アメトリジオン(ametridione)、アメトリン(ametryn)、アラクロール(alachlor)、アリドクロール(allidochlor)、アロキシジム(alloxydim)、アロラック(alorac)、イソウロン(isouron)、イソカルバミド(isocarbamid)、イソキサクロルトール(isoxachlortole)、イソキサピリホップ(isoxapyrifop)、イソキサフルトール(isoxaflutole)、イソキサベン(isoxaben)、イソシル(isocil)、イソノルロン(isonoruron)、イソプロツロン(isoproturon)、イソプロパリン(isopropalin)、イソポリナート(isopolinate)、イソメチオジン(isomethiozin)、イナベンフィド(inabenfide)、イパジン(ipazine)、イプフェンカルバゾン(ipfencarbazone)、イプリミダム(iprymidam)、イマザキン(imazaquin)、イマザピック(imazapic)、イマザピル(imazapyr)、イマザメタピル(imazamethapyr)、イマザメタベンズ(imazamethabenz)、イマザメタベンズメチル(imazamethabenz-methyl)、イマザモックス(imazamox)、イマゼタピル(imazethapyr)、イマゾスルフロン(imazosulfuron)、インダジフラム(indaziflam)、インダノファン(indanofan)、インドール酪酸(indolebuty

10

20

30

40

50

ric acid)、ウニコナゾール-P(uniconazole-P)、エグリナジン (eglinazine)、エスプロカルブ (esprocarb)、エタメスルフロン (ethametsulfuron)、エタメスルフロンメチル(ethametsulfuron-methyl)、エタルフルラリン (ethalfluralin)、エチオレート (ethiolate)、エチクロゼート-エチル(ethychlozate ethyl)、エチジムロン (ethidimuron)、エチノフェン (etinofen)、エテホン(ethephon)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、エトキシフェン (ethoxyfen)、エトニプロミド (etnipromid)、エトフメセート (ethofumesate)、エトベンザニド (etobenzanid)、エプロナズ (epronaz)、エルボン (erbon)、エンドタル (endothal)、オキサジアゾン (oxadiazon)、オキサジアールギル (oxadiargyl)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、オキサピラゾン (oxapyrazon)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、オリザリン (oryzalin)、オルソスルファミロン (orthosulfamuron)、オルベンカルブ (orbencarb)、カフェンストロール (cafenstrole)、カムベンジクロール (cambendichlor)、カルバスラム (carbasulam)、カルフェントラゾン (carfentrazone)、カルフェントラゾン-エチル(carfentrazone-ethyl)、カルブチレート (karbutilate)、カルベタミド (carbetamide)、カルボキサゾール (carboxazole)、キザロホップ (quizalofop)、キザロホップ-P (quizalofop-P)、キザロホップ-エチル(quizalofop-ethyl)、キシラクロール (xylachlor)、キノクラミン (quinoclamine)、キノナミド (quinonamid)、キンクロラック (quinclorac)、キンメラック (quinmerac)、クミルロン (cumyluron)、クリオジネート (cliodinate)、グリホサート(glyphosate)、グルホシネート (glufosinate)、グルホシネート-P (glufosinate-P)、クレダジン (credazine)、クレトジム (clethodim)、クロキシホナック(cloxyfonac)、クロジナホップ (clodinafop)、クロジナホップ-プロパルギル(clodinafop-propargyl)、クロトルロン (chlorotoluron)、クロピラリド (clopypalid)、クロプロキシジム (cloproxydim)、クロプロップ (cloprop)、クロブロムロン (chlorbromuron)、クロホップ (clofop)、クロマゾン (clomazone)、クロメトキシニル(chlometoxyini1)、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen)、クロメプロップ (clomeprop)、クロラジホップ (chlorazifop)、クロラジン (chlorazine)、クロラスラム (cloransulam)、クロラノクリル (chloranocryl)、クロラムベン (chloramben)、クロランスラム-メチル(cloransulam-methyl)、クロリダゾン (chloridazon)、クロリムロン (chlorimuron)、クロリムロン-エチル(chlorimuron-ethyl)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、クロルタル (chlorthal)、クロルチアミド (chlorthiamid)、クロルトルロン(chlortoluron)、クロルニトロフェン (chlornitrofen)、クロルフェナック (chlorfenac)、クロルフェンプロップ (chlorfenprop)、クロルブファミン (chlorbufam)、クロルフルラゾール (chlorflurazole)、クロルフルレノール (chlorflurenol)、クロルプロカルブ (chlorprocarb)、クロルプロファミン (chlorpropham)、クロルメコート(chlormequat)、クロレツロン (chloreturon)、クロロキシニル (chloroxynil)、クロロクスロン (chloroxuron)、クロロポン (chloropon)、サフルフェナシル (saflufenacil)、シアナジン (cyanazine)、シアナトリン (cyanatryn)、ジアレート(diallate)、ジウロン (diuron)、ジエタムコート (diethamquat)、ジカンバ (dicamba)、シクルロン (cycluron)、シクロエート (cycloate)、シクロキシジム (cycloxydim)、ジクロスラム (diclosulam)、シクロスルファミロン (cyclosulfamuron)、ジクロプロップ (dichlorprop)、ジクロプロップ-P (dichlorprop-P)、ジクロベニル (dichlobenil)、ジクロホップ (diclofop)、ジクロホップメチル(diclofop-methyl)、ジクロメート (dichlormate)、ジクロラルウレア (dichloralurea)、ジクワット (diquat)、シサニリド (cisanylide)、ジスル (disul)、シズロン (siduron)、ジチオピル (dithiopyr)、ジニトラミン (dinitramine)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、ジノサム (dinosam)、シノスルフロン (cinosulfuron)、ジノセブ (dinoseb)、ジノテルブ (dinoterb)、ジノフェナート (dinofenat)、ジノプロップ (dinoprop)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、ジフェナミド (diphenamid)、ジフェノクスロン (difenoxuron)、ジフェノペンテン (difenopenten)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、シブトリン (cybutryne)、シブラジン (cyprazine)、シブラゾール (cyprazole)、ジフルフェ

10

20

30

40

50

ニカン (diflufenican)、ジフルフェンゾピル (diflufenzopyr)、ジプロペトリン (diproprymetyn)、シプロミド (cypromid)、シベルコート (cyperquat)、ジベレリン (gibberellin)、シマジン (simazine)、ジメキサノ (dimexano)、ジメタクロール (dimethachlor)、ジメダゾン (dimidazon)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジメテナミド (dimethenamid)、シメトリン (simetryn)、シメトン (simeton)、ジメピペレート (dimepiperate)、ジメフロン (dimefuron)、シンメチリン (cinmethylin)、スエップ (sweep)、スルグリカピン (sulglycapin)、スルコトリオン (sulcotrione)、スルファレート (sulfallate)、スルフェントラゾン (sulfentrazone)、スルホスルフロン (sulfosulfuron)、スルホメツロン (sulfometuron)、スルホメツロンメチル (sulfometuron-methyl)、セクブメトン (secbumeton)、セトキシジム (sethoxydim)、セブチラジン (sebutylazine)、ターバシル (terbacil)、ダイムロン (daimuron)、ダゾメット (dazomet)、ダラポン (dalapon)、チアザフルロン (thiazafuron)、チアゾピル (thiazopyr)、チエンカルバゾン (thiencarbazon)、チエンカルバゾンメチル (thiencarbazon-methyl)、チオカルバジル (tiocarbamil)、チオクロリム (tioclorim)、チオベンカルブ (thiobencarb)、チジアジミン (thidiazimin)、チジアズロン (thidiazuron)、チフェンスルフロン (thifensulfuron)、チフェンスルフロンメチル (thifensulfuron-methyl)、デスメディファム (desmedipham)、デスメトリン (desmetryn)、テトラフルロン (tetrafluron)、テニルクロール (thenylchlor)、テブタム (tebutam)、テブチウロン (tebuthiuron)、テルブメトン (terbumeton)、テブラロキシジム (tepraloxymid)、テフリールトリオン (tefuryltrione)、テムボトリオン (tembotrione)、デラクロール (delachlor)、テルバシル (terbacil)、テルブカルブ (terbucarb)、テルブクロール (terbucchlor)、テルブチラジン (terbutylazine)、テルブトリン (terbutryn)、トブラメゾン (topramezone)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、トリアジフラム (triaziflam)、トリアスルフロン (triasulfuron)、トリアレート (tri-allylate)、トリエタジン (trietazine)、トリカンバ (tricamba)、トリクロピル (triclopyr)、トリジファン (tridiphane)、トリタック (tritac)、トリトスルフロン (tritosulfuron)、トリフルスルフロン (triflusulfuron)、トリフルスルフロンメチル (triflusulfuron-methyl)、トリフルラリン (trifluralin)、トリフロキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリプロピندان (tripropindan)、トリベニユロンメチル (tribenuron-methyl)、トリベヌロン (tribenuron)、トリホップ (trifop)、トリホブシメ (trifopsime)、トリメツロン (trimeturon)、ナプタラム (naptalam)、ナプロアニリド (naproanilide)、ナプロパミド (napropamide)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、ニトラリン (nitralin)、ニトロフェン (nitrofen)、ニトロフルオルフェン (nitrofluorfen)、ニピラクロフェン (nipyraclufen)、ネブロン (neburon)、ノルフルラゾン (norflurazon)、ノルロン (noruron)、バーバン (barban)、パクロブトラゾール (paclobutrazol)、パラコート (paraquat)、パラフルロン (parafluron)、ハロキシジン (haloxydine)、ハロキシホップ (haloxyfop)、ハロキシホップ-P (haloxyfop-P)、ハロキシホップメチル (haloxyfop-methyl)、ハロサフェン (halosafen)、ハロスルフロン (halosulfuron)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl)、ピクロラム (picloram)、ピコリナフェン (picolinafen)、ビシクロピロン (bicyclopyrone)、ビスピリバック (bispyribac)、ビスピリバックナトリウム (bispyribac-sodium)、ピダノン (pydanon)、ピノキサデン (pinoxaden)、ピフェノックス (bifenox)、ピペロホス (piperophos)、ヒメキサゾール (hymexazol)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピラスルホトール (pyrasulfotole)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ピラゾスルフロン (pyrazosulfuron)、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラナホス (bilanafos)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl)、ピリクロール (pyriclor)、ピリダホル (pyridafol)、ピリチオバック (pyrithiobac)、ピリチオバックナトリウム (pyrithiobac-sodium)、ピリデート (pyridate)、ピリフタリド (pyriftalid)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリミスルファン (pyrimisulfan)、ピリミスルフロン (primisulfuron)、ピリミノバックメチル (pyriminobac-methyl)、

ピロキサスルホン (pyroxasulfone)、ピロクスラム (pyroxsulam)、フェナスラム (fenasulam)、フェニソファム (phenisopham)、フェヌロン (fenuron)、フェノキサスルホン (fenoxasulfone)、フェノキサプロップ (fenoxaprop)、フェノキサプロップ-P (fenoxaprop-P)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl)、フェノチオール (phenothio1)、フェノプロップ (fenoprop)、フェノベンズロン (phenobenzuron)、フェンチアプロップ (fenthiaaprop)、フェンテラコール (fenteracol)、フェントラザミド (fentrazamide)、フェンメディファム (phenmedipham)、フェンメディファムエチル (phenmedipham-ethyl)、ブタクロール (butachlor)、ブタフェナシル (butafenacil)、ブタミホス (butamifos)、ブチウロン (buthiuron)、ブチダゾール (buthidazole)、ブチレート (butylate)、ブツロン (buturon)、ブテナクロール (butenachlor)、ブトキシジム (butoxydim)、ブトラリン (butralin)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、フラムプロップ (flamprop)、フリロオキシフェン (furyloxyfen)、プリナクロール (prynachlor)、プリミスルフロンメチル (primisulfuron-methyl)、フルアジホップ (fluazifop)、フルアジホップ-P (fluazifop-P)、フルアジホップブチル (fluazifop-butyl)、フルアゾレート (fluazolate)、フルロキシピル (fluroxypyr)、フルオチウロン (fluothiuron)、フルオメツロン (fluometuron)、フルオログリコフェン (fluoroglycofen)、フルロクロリドン (flurochloridone)、フルオロジフェン (fluorodifen)、フルオロニトロフェン (fluoronitrofen)、フルオロミジン (fluoromidine)、フルカルバゾン (flucarbazone)、フルカルバゾンナトリウム (flucarbazone-sodium)、フルクロラリン (fluchloralin)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron)、フルチアセット (fluthiacet)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl)、フルピルスルフロン (flupyrsulfuron)、フルフェナセット (flufenacet)、フルフェニカン (flufenican)、フルフェンピル (flufenpyr)、フルプロパシル (flupropacil)、フルプロパナート (flupropanate)、フルポキサム (flupoxam)、フルミオキサジン (flumioxazin)、フルミクロラック (flumiclorac)、フルミクロラックペンチル (flumiclorac-pentyl)、フルミプロピン (flumipropyn)、フルメジン (flumezin)、フルオメツロン (fluometuron)、フルメトスラム (flumetsulam)、フルリドン (fluridone)、フルルタモン (flurtamone)、フルロキシピル (fluroxypyr)、プレチラクロール (pretilachlor)、プロキサン (proxan)、プログリナジン (proglinazine)、プロシアジン (procyazine)、プロジアミン (prodiamine)、プロスルファリン (prosulfalin)、プロスルフロン (prosulfuron)、プロスルホカルブ (prosulfocarb)、プロパキサホップ (propaquizaop)、プロパクロール (propachlor)、プロパジン (propazine)、プロパニル (propanil)、プロピザミド (propyzamide)、プロピソクロール (propisochlor)、プロヒドロジャスモン (prohydrojasmon)、プロピリスルフロン (propyrisulfuron)、プロファム (propham)、プロフルアゾール (profluazol)、プロフルラリン (profluralin)、プロヘキサジオンカルシウム (prohexadione-calcium)、プロポキシカルバゾン (propoxycarbazine)、プロポキシカルバゾンナトリウム (propoxycarbazine-sodium)、プロホキシジム (profoxydim)、プロマシル (bromacil)、ブロムピラゾン (brompyrazon)、プロメトリン (prometryn)、プロメトン (prometon)、プロモキシニル (bromoxynil)、プロモフェノキシム (bromofenoxim)、プロモブチド (bromobutide)、プロモボニル (bromobonil)、フロラスラム (florasulam)、ヘキサクロロアセトン (hexachloroacetone)、ヘキサジノン (hexazinone)、ペトキサミド (pethoxamid)、ベナゾリン (benazolin)、ペノクスラム (penoxsulam)、ペブレート (pebulate)、ペフルブタミド (beflubutamid)、ベルノレート (vernolate)、ペルフルイドン (perfluidone)、ベンカルバゾン (bencarbazine)、ベンザドックス (benzadox)、ベンジプラム (benzipram)、ベンジルアミノプリン (benzylaminopurine)、ベンズチアズロン (benzthiazuron)、ベンズフェンジゾン (benzfendizone)、ベンスリド (bensulide)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、ベンゾイルプロップ (benzoylprop)、ベンゾビシクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ベンゾフルオール (benzofluor)、ベントアゾン (bentazone)、ベントノクロール (pentanochlor)、ベンチオカーブ (benthiocar

10

20

30

40

50

b)、ペンディメタリン (pendimethalin)、ペントキサゾン (pentoxazone)、ベンフラリン (benfluralin)、ベンフレセート (benfuresate)、ホサミン (fosamine)、ホメサフェン (fomesafen)、ホラムスルフロン (foramsulfuron)、ホルクロルフエニユロン (forchlorfenuron)、マレイン酸ヒドラジド (maleic hydrazide)、メコプロップ (mecoprop)、メコプロップ-P (mecoprop-P)、メジノテルブ (medinoterb)、メソスルフロン (mesosulfuron)、メソスルフロンメチル (mesosulfuron-methyl)、メソトリオン (mesotrione)、メソプラジン (mesoprazine)、メソプロトリン (methoprotetryne)、メタザクロール (metazachlor)、メタゾール (methazole)、メタゾスルフロン (metazosulfuron)、メタバズチアズロン (methabenzthiazuron)、メタミトロン (metamitron)、メタミホップ (metamifop)、メタム (metam)、メタルプロパリン (methalpropalin)、メチウロン (methiuron)、メチオゾリン (methiozolin)、メチオベンカルブ (methiobencarb)、メチルダイムロン (methyldymron)、メトクスロン (metoxuron)、メトスラム (metosulam)、メトスルフロン (metsulfuron)、メトスルフロンメチル (metsulfuron-methyl)、メトフラゾン (metflurazon)、メトブロムロン (metobromuron)、メトベンズロン (metobenzuron)、メトメトン (methometon)、メトラクロール (metolachlor)、メトリブジン (metribuzin)、メピコートクロリド (mepiquat-chloride)、メフェナセツト (mefenacet)、メフルイジド (mefluidide)、モナリド (monalide)、モニソウロン (monisouron)、モニユヌロン (monuron)、モノクロル酢酸 (monochloroacetic acid)、モノリニユロン (monolinuron)、モリネート (molinate)、モルフアムコート (morfamquat)、ヨードスルフロン (iodosulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム (iodosulfuron-methyl-sodium)、ヨードボニル (iodobonil)、ヨードメタン (iodomethane)、ラクトフェン (lactofen)、リヌロン (linuron)、リムスルフロン (rimsulfuron)、レナシル (lenacil)、ローデタニル (rhodethanil)、過酸化カルシウム (calcium peroxide)、臭化メチル (methyl bromide) 等を例示することができる。

【0234】

また、生物農薬として例えば、核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus、NPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ポックスウイルス (Entomopoxi virus、EPV) 等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトパガム (Monacrosporium phymatophagum)、スタイナ・ネマ・カーポカプサエ (Steinernema carpocapsae)、スタイナ・ネマ・クシダエ (Steinernema kushidai)、パスツールリア・ペネトランス (Pasteuria penetrans) 等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウム・ラジオブクター (Agrobacterium radiobacter)、非病原性エルビニア・カロトボラ (Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (Xanthomonas campestris) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

【0235】

更に、生物農薬として例えば、オンシツツヤコバチ (Encarsia formosa)、コレマンアブラバチ (Aphidius colemani)、シヨクガタマバエ (Aphidoletes aphidimyza)、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea)、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica)、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis)、ククメリスカブリダニ (Amblyseius cucumeris)、ナミヒメハナカメムシ (Orius sauteri) 等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (Beauveria brongniartii) 等の微生物農薬、(Z)-10-テトラデセニル=アセタート、(E,Z)-4,10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z)-8-ドデセニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、14-メチル-1-オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

【0236】

以下に本発明の代表的な化合物、及び製造中間体の製造例によりさらに詳しく説明する

10

20

30

40

50

が、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

【0237】

以下に本発明の代表的な化合物、及び製造中間体の製造例によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

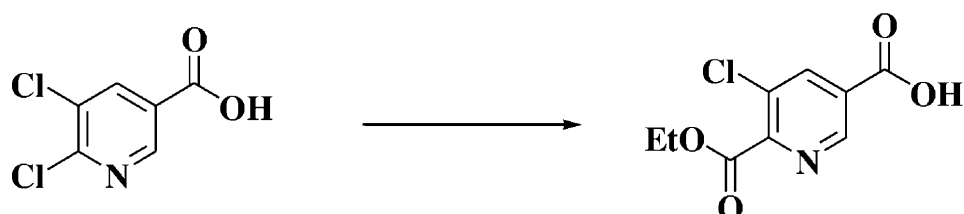
【実施例】

【0238】

中間体(2)の製造例1.

5 クロロ 6 エトキシカルボニルピリジン 3 カルボン酸の製造方法

【化20】



10

オートクレーブ中、5, 6 ジクロロピリジン 3 カルボン酸 (10 g, 52 mmol) のエタノール (60 mL) 溶液に DPPB (1,4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン) (2.2 g, 10 mol%), トリエチルアミン (14 g, 2.5 当量)、PdCl₂(PPh₃)₂ (911 mg, 2.5 mol%) を加え、反応系を一酸化炭素置換し (CO 圧、4.0 MPa)、135 °C で4時間撹拌した。反応混合物に水、3 N 塩酸を加えて水層を酸性にした後に、酢酸エチルで数回抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後に濃縮し、得られた固体をヘキサン 酢酸エチル = 2 : 1 (v/v) の溶液で洗い、目的の 5 クロロ 6 エトキシカルボニルピリジン 3 カルボン酸 (10.9 g, 76%) を得た。
物性: ¹H NMR (CDCl₃): 9.02 (d, 1H)、8.44 (d, 1H)、4.42 (dd, 2H)、1.33 (t, 3H)

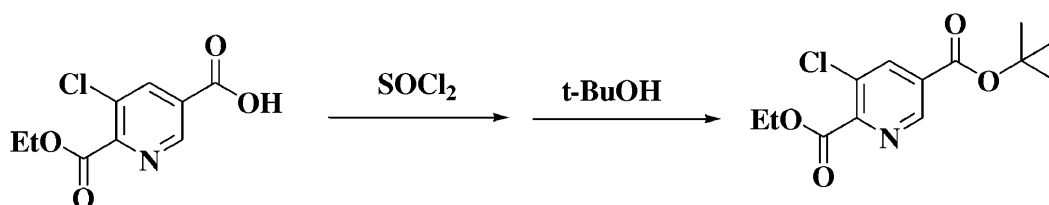
20

【0239】

中間体(2)の製造例2.

5 クロロ 6 エトキシカルボニルピリジン 3 カルボン酸 t ブチルエステルの製造方法

【化21】



30

前工程で得られた 5 クロロ 6 エトキシカルボニルピリジン 3 カルボン酸 (10.9 g, 47.6 mmol) をトルエン (30 mL) に溶解し、DMF (ジメチルホルムアミド) (4 mL) を加えた。続いて、塩化チオニル (11 g, 2 当量) を加え、90 °C で3時間加熱撹拌した。反応溶液を室温に戻し、濃縮した。別の容器に t ブタノール (35 mL, 10 当量)、THF (テトラヒドロフラン) (100 mL)、ジイソプロピルエチルアミン (50 mL, 7 当量)、DMA P (N,N-ジメチル-4-アミノピリジン) (6 g, 1 当量) の混合溶液に氷冷下、上述した濃縮残渣をゆっくりと加えた。反応混合物を3時間加熱還流し、室温まで冷却後、水、酢酸エチルを加えて数回抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィー (ヘキサン AcOEt (酢酸エチルエステル) = 5 : 1 (v/v)) に付し、目的の 5 クロロ 6 エトキシカルボニルピリジン 3 カルボン酸 t ブチルエステル (8.43 g, 62%) を得た。
物性: ¹H NMR (CDCl₃): 9.05 (d, 1H)、8.30 (d, 1H)、4.50 (dd, 2H)、1.61 (s, 9H)、1.44 (t, 3H)

40

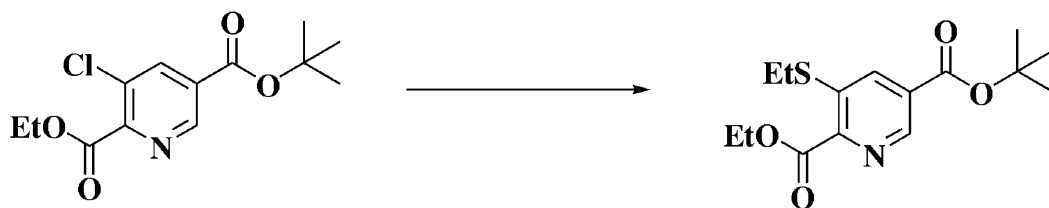
50

【0240】

中間体(2)の製造例3.

5 エチルチオ 6 エトキシカルボニルピリジン 3 カルボン酸 t-ブチルエ
テルの製造方法

【化22】



10

5 クロロ 6 エトキシカルボニルピリジン 3 カルボン酸 t-ブチルエステル
(8.43 g, 21.65 mmol)をDMF(100 mL)に溶解した。氷冷下、ナトリ
ウムエタンチオレート(2.27 g, 1当量)をゆっくりと加え、5分撹拌した後、水を
加え、続けて0.5 N塩酸を加えた。酢酸エチルで数回抽出した後、有機層を硫酸ナトリ
ウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン AcOEt = 5 : 1 (v
/ v))に付し、目的の5 エチルチオ 6 エトキシカルボニルピリジン 3 カルボ
ン酸 t-ブチルエステル(6.17 g, 92%)を得た。

物性：¹H NMR(CDCl₃): 8.91 (d, 1H)、8.22 (d, 1H)、4.
49 (dd, 2H)、2.99 (dd, 2H)、1.61 (s, 9H)、1.45 (t,
3H)、1.40 (t, 3H)

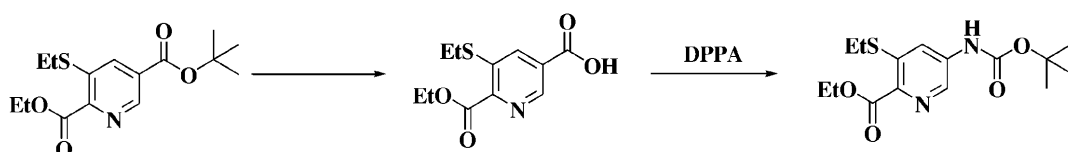
20

【0241】

中間体(2)の製造例4.

3 エチルチオ 5 t-ブトキシカルボニルアミノピリジン 2 カルボン酸 エチ
ルエステルの製造方法

【化23】



30

5 エチルチオ 6 エトキシカルボニルピリジン 3 カルボン酸 t-ブチル(6
.17 g, 19.9 mmol)をトリフルオロ酢酸(30 mL)に溶解し、30分間加熱還
流した。反応溶液を濃縮し、トルエン及び酢酸エチルを加え、再度濃縮した。残渣にt-
ブタノール(100 mL)、トリエチルアミン(6.5 g, 3当量)、DPPA(ジフェ
ニルリン酸アジド)(11.74 g, 2当量)を加え、室温で1時間撹拌した後に4時間
還流した。反応溶液を濃縮し、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン 酢酸エチル = 2 :
1 (v / v))に付し、目的の3 エチルチオ 5 t-ブトキシカルボニルアミノピリ
ジン 2 カルボン酸 エチルエステル(3.63 g, 56%)を得た。

40

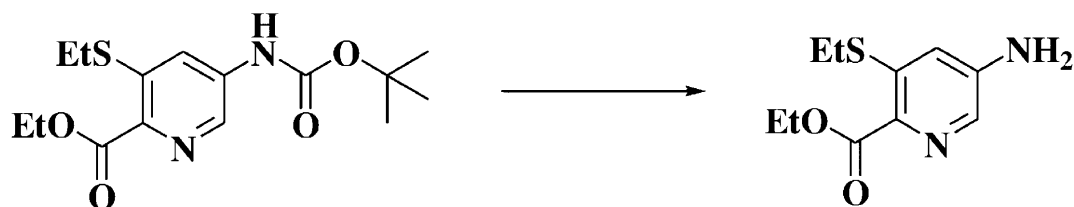
物性：¹H NMR(CDCl₃): 8.25 (d, 1H)、8.09 (d, 1H)、6.
74 (s, 1H)、4.46 (dd, 2H)、2.97 (dd, 2H)、1.53 (s,
9H)、1.44 (t, 3H)、1.41 (t, 3H)

【0242】

中間体(2)の製造例5.

5 アミノ 3 エチルチオピリジン 2 カルボン酸 エチルエステルの製造方法

【化24】



3 エチルチオ 5 t ブトキシカルボニルアミノピリジン 2 カルボン酸 エチルエステル (670 mg, 2.06 mmol) をトリフルオロ酢酸 (30 mL) に溶解し、30 分間室温で撹拌した。反応溶液を濃縮し、水及び酢酸エチル、炭酸カリウムを加えた。酢酸エチルで数回抽出した後、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィー (ヘキサン AcOEt = 1 : 3 (v/v)) に付し、目的の 5 アミノ 3 エチルチオピリジン 2 カルボン酸 エチルエステル (358 mg, 77%) を得た。

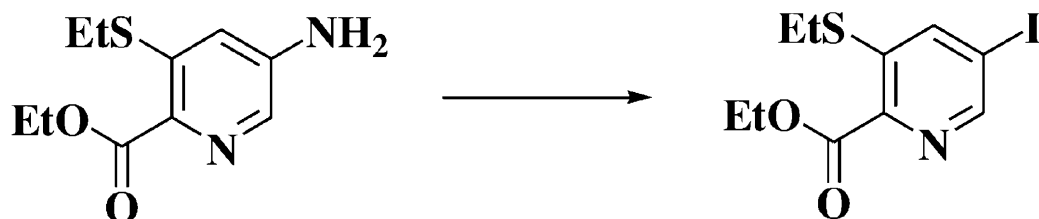
物性：¹H NMR (CDCl₃): 7.89 (d, 1H)、6.80 (s, 1H)、4.43 (dd, 2H)、4.08 (s, 2H)、2.88 (dd, 2H)、1.56 (s, 9H)、1.42 (t, 3H)、1.40 (t, 3H)

【0243】

中間体 (2) の製造例 6 .

3 エチルチオ 5 ヨードピリジン 2 カルボン酸 エチルエステルの製造方法

【化25】



5 アミノ 3 エチルチオピリジン 2 カルボン酸 エチルエステル (1 g, 4.44 mmol) をアセトニトリル (10 mL) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (500 mg, 1当量) 及び p トルエンスルホン酸 (2.6 g, 3当量) を加え、5 程度の水浴で冷却した。別の容器に調整したヨウ化カリウム (2.25 g, 3当量) と亜硝酸ナトリウム (612 mg, 2当量) の水溶液 (10 mL) を前述した反応液にゆっくりと加えた。そのまま 30 分撹拌し、さらに室温で 30 分撹拌した。反応溶液にハイポ水を加え、酢酸エチルで数回抽出した後に有機層を乾燥、濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の 3 エチルチオ 5 ヨードピリジン 2 カルボン酸 エチルエステル (761 mg, 51%) を得た。

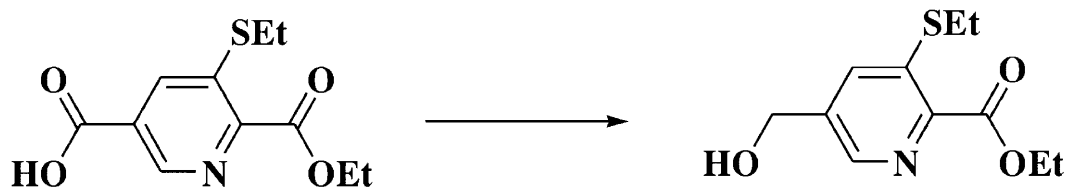
物性：¹H NMR (CDCl₃): 8.61 (s, 1H)、7.95 (s, 1H)、4.45 (dd, 2H)、2.91 (dd, 2H)、1.43 (t, 3H)、1.39 (t, 3H)

【0244】

中間体 (2 b2) の製造例 1 .

3 エチルチオ 5 ヒドロキシメチルピリジン 2 カルボン酸 エチルエステルの製造方法

【化26】



上記中間体(2)の製造例4に記載の製造方法に従って製造した10gの5-エチルチオ-6-エトキシカルボニルピリジン-3-カルボン酸のTHF溶液(100mL)にCDI(カルボニルジイミダゾール)(10g)を加え、室温で2時間攪拌した。NaBH₄(5.5g)100mL水溶液に上記のTHF溶液を0でゆっくり加えた後、室温で1時間攪拌した。反応終了後、4M塩酸溶液を加え、pH2にした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、3-エチルチオ-5-ヒドロキシメチルピリジン-2-カルボン酸エチルエステル(6.4g, 62%)を得た。

10

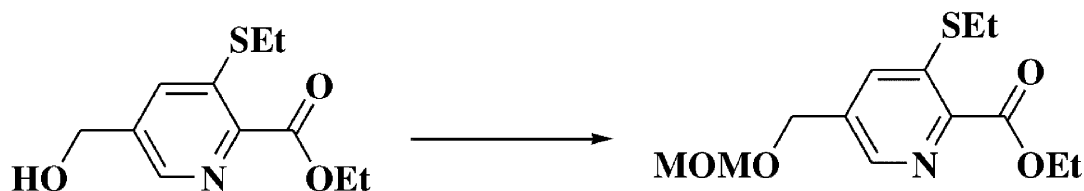
【0245】

中間体(2-b2)の製造例2.

3-エチルチオ-5-メトキシメトキシピリジン-2-カルボン酸エチルエステルの製造方法

20

【化27】



6.4gの3-エチルチオ-5-ヒドロキシメチルピリジン-2-カルボン酸エチルエステルのCHCl₃溶液(50mL)にDIPEA(N,N-ジイソプロピルエチルアミン)(13.6mL)とメトキシメチルクロライド(MOMCl)(6.0mL)を加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮して3-エチルチオ-5-メトキシメトキシピリジン-2-カルボン酸エチルエステル(7.1g, 94%)を得た。

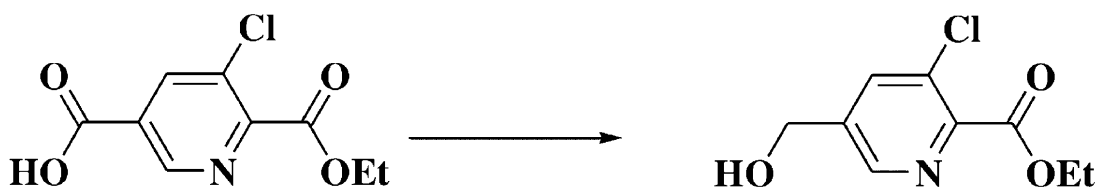
30

【0246】

中間体(2-e4)の製造例1.

3-クロロ-5-ヒドロキシメチルピリジン-2-カルボン酸エチルエステルの製造方法

【化28】



中間体(2)の製造例1の方法で製造した8.3gの5-クロロ-6-エトキシカルボニルピリジン-3-カルボン酸のCHCl₃溶液(150mL)にDMF(0.3mL)と塩化オキサリル(4.7mL)を順次加え室温で1時間攪拌した後、この反応混合物を減圧濃縮した。NaBH₄(5.5g)の水:CHCl₃=1:3(v/v)溶液

40

50

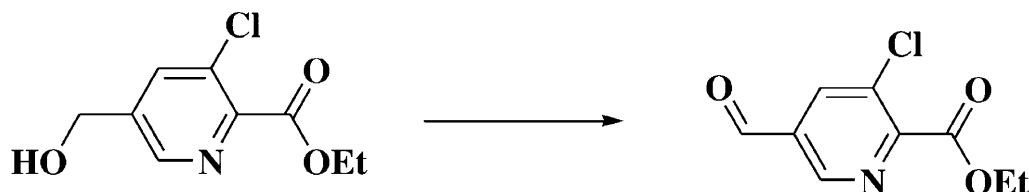
(150 mL) に先に得られた濃縮残渣の CHCl_3 溶液 (50 mL) を 0 でゆっくり加えた後、室温で1時間攪拌した。反応終了後、4 M 塩酸溶液を加え、液性を pH 2 にした後、 CHCl_3 で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、3-クロロ-5-ヒドロキシメチルピリジン-2-カルボン酸エチルエステル (4.9 g, 62%) を得た。

【0247】

中間体 (2e4) の製造例 2 .

3-クロロ-5-ホルミルピリジン-2-カルボン酸エチルエステルの製造方法

【化29】



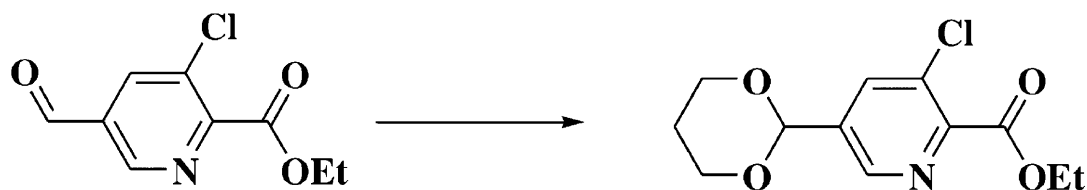
塩化オキサリルの CHCl_3 溶液 (50 mL) に -78 でジメチルスルホキシド (8.0 mL) をゆっくり滴下し、反応混合液を10分攪拌した。4.9 g の 3-クロロ-5-ヒドロキシメチルピリジン-2-カルボン酸エチルエステルの CHCl_3 溶液 (15 mL x 2) を -78 で加え15分攪拌した。Et₃N (22 mL) を -78 °C で加えた後、0 °C で20分攪拌した。反応終了後、飽和 NH_4Cl 水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、3-クロロ-5-ホルミルピリジン-2-カルボン酸エチルエステル (4.8 g, 99%) を得た。

【0248】

中間体 (2e4) の製造例 3 .

3-クロロ-5-(1,3-ジオキサソラン-2-イル)-2-ピリジンカルボン酸エチルエステルの製造方法

【化30】



4.8 g の 3-クロロ-5-ホルミルピリジン-2-カルボン酸エチルエステルのトルエン溶液 (50 mL) に 1,3-プロパンジオール (3.4 g) と CSA (10-カンファースルホン酸) (0.5 g) を加え、2時間加熱還流した。反応終了後、減圧濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、3-クロロ-5-(1,3-ジオキサソラン-2-イル)-2-ピリジンカルボン酸エチルエステル (4.9 g, 81%) を得た。

【0249】

中間体 (2e4) の製造例 4 .

3-エチルチオ-5-(1,3-ジオキサソラン-2-イル)-2-ピリジンカルボン酸エチルエステルの製造方法

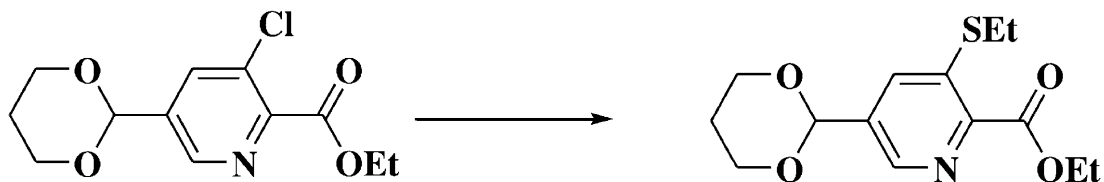
10

20

30

40

【化31】



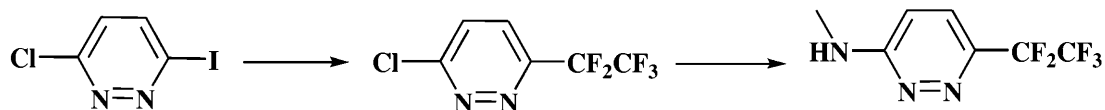
4.9 gの3クロロ5-(1,3ジオキサニル)2ピリジンカルボン酸エチルエステル(THF溶液(40 mL)に0℃でNaH(1.5 g)とEtSH(1.7 mL)を加えた後、50℃で2時間攪拌した。反応終了後、飽和NH₄Cl水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、3-エチルチオ5-(1,3ジオキサニル)2ピリジンカルボン酸エチルエステル(2.6 g, 49%)を得た。

【0250】

中間体(3)の製造例1。

3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジンの製造方法

【化32】



アルゴン下、文献記載の方法に従って合成した3-クロロ6-ヨードピリダジン(7.2 g)、ヨウ化銅(2.86 g)、1,10-フェナントロリン(2.7 g)、及び第日本化学会94回春季年会要旨集(講演番号2B1-17, 1229頁)に記載の方法により調整したビスフルオロアルキル亜鉛試薬のNMP(N-メチル-2-ピロリドン)溶液(ca. 0.33 M, 80 mL)を加え、90℃で40分攪拌した後、室温まで冷却した。別の容器に用意したTHF(30 mL)、メチルアミン(1.0 Mの30 mLメタノール溶液)の混合溶液に氷冷下、上述した反応溶液をゆっくりと滴下した。室温まで昇温し、1時間攪拌した。水及び酢酸エチルを加え、5分攪拌した後、混合溶液をセライトでろ過した。ろ液を酢酸エチルで3回抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジン(6.36 g)を得た。

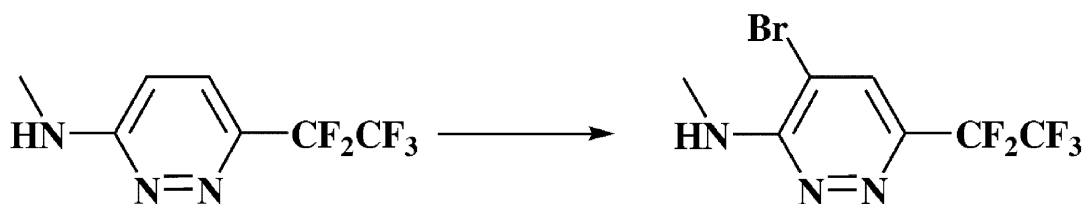
物性：融点：141-143℃

【0251】

中間体(3)の製造例2。

4-ブロモ-3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジンの製造方法

【化33】



3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジン(6.05 g)を酢酸(50 mL)に溶解し、1,3-ジプロモ-5,5-ジメチルヒダントイン(8.4 g)を加え、95℃で3時間加熱攪拌した。反応溶液を濃縮し、水を加えた。炭酸カリウムで中和後、酢酸エチルで3回抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラ

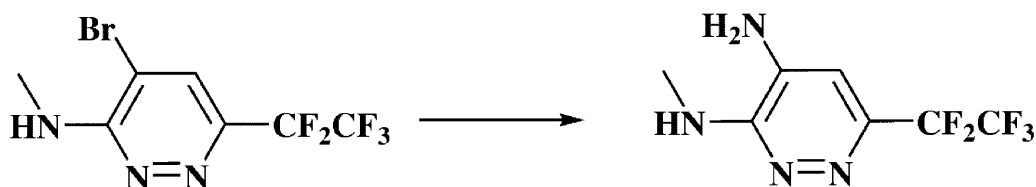
フィーに付し、目的の4-ブロモ-3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジン(6.16g, 76%)を得た。

物性：融点：41-43

【0252】

中間体(3)の製造例3.

4-アミノ-3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジンの製造方法
【化34】



10

オートクレーブ中に4-ブロモ-3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジン(6.16g)、酸化銅(I)(1.44g)、NMP(30ml)、28%アンモニア水(30ml)を順次加え、アルゴンを吹き入れた後に密閉した。80℃で3時間加熱攪拌し、室温まで冷却した。水及び酢酸エチルを加え、5分攪拌した後、混合溶液をセライトでろ過した。ろ液を酢酸エチルで3回抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の4-アミノ-3-メチルアミノ-6-ペンタフル

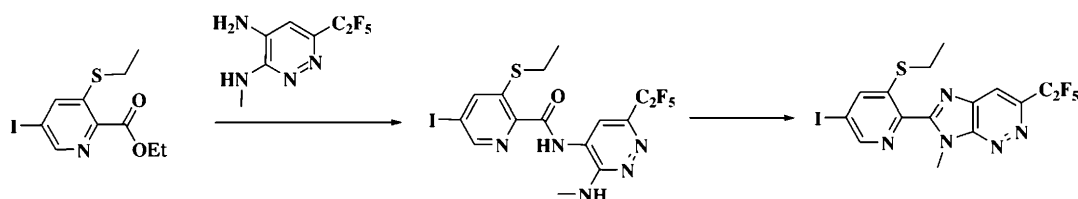
20

オロエチルピリダジン(3.39g, 69%)を得た。

物性：¹H NMR(CDCl₃): 6.75(s, 1H)、5.18(s, 1H)、4.59(s, 2H)、2.85(s, 3H)

【0253】

参考例1.2 (3-エチルチオ-5-ヨードピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジンの製造方法
【化35】



30

4-アミノ-3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジン(17.9g)のテトラヒドロフラン溶液(240mL)に、氷冷下、水素化ナトリウム(3.1g)を加え、気泡が出なくなるまで攪拌した。次に3-エチルチオ-5-ヨード-2-ピリジンカルボン酸エチル(25g)のテトラヒドロフラン溶液(120mL)を氷冷下で加えた後、室温に戻して2時間攪拌した。0.5M塩酸水溶液を加えpHを3に整えた後に酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、3-エチルチオ-5-ヨード-N-(3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジン-4-イル)-2-ピリジンカルボン酸アミドを得た。これを精製せずに次の反応に用いた。

40

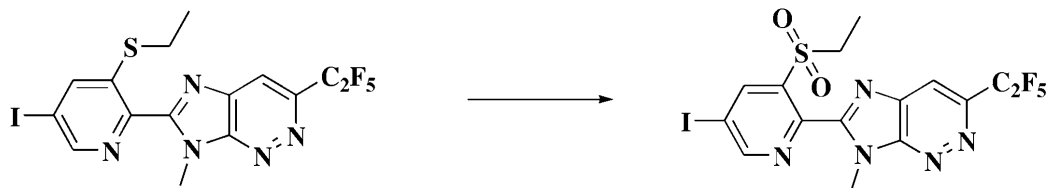
3-エチルチオ-5-ヨド-N-(3-メチルアミノ-6-ペンタフルオロエチルピリダジン-4-イル)-2-ピリジンカルボン酸アミドのトルエン溶液(300mL)に酢酸(40mL)を加え過熱還流下6時間反応した。室温に戻した後、減圧濃縮し、残渣に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮した。得られた残渣に少量のメチル tert-ブチルエーテルとヘキサンを加え、生じた固体を濾過し、27gの2-(3-エチルチオ-5-ヨードピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジンを得た。

収率：71% 融点：127-128

50

【0254】

参考例 2.2 (3 エチルスルホニル 5 ヨードピリジン 2 イル) 3 メチル 6 ペンタフルオロエチル 3H イミダゾ[4,5-C]ピリダジンの製造方法
【化36】

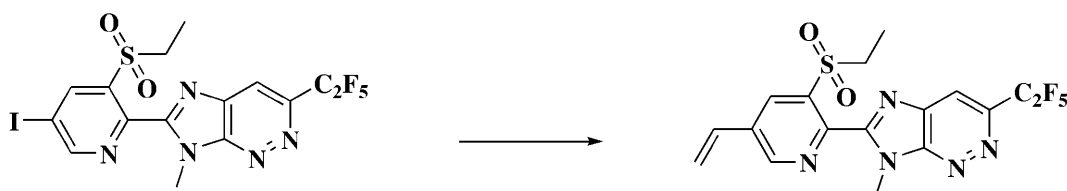


前工程で得られたイミダゾピリダジン体 (395 mg, 0.766 mmol) を酢酸エチル (10 mL) に溶解し、メタクロロ化安息香酸 (450 mg, 2.2 当量) を加え、室温で2時間攪拌した。反応溶液にFAMSO (メチル(メチルスルフィニル)メチルスルフィド) 数滴及びトリエチルアミン (1 mL) を加え、濃縮したのちにカラムクロマトグラフィーに付し、目的のスルホン体 (406 mg, 97%) を得た。

物性：融点 188 189

【0255】

参考例 3.2 [3 エチルスルホニル 5 ビニルピリジン 2 イル] 3 メチル 6 ペンタフルオロエチル 3H イミダゾ[4,5-C]ピリダジンの製造方法
【化37】

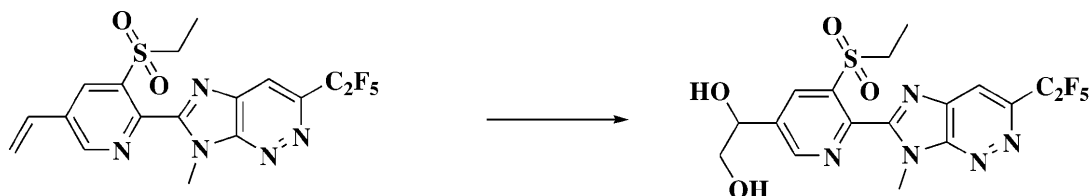


2 (3 エチルスルホニル 5 ヨードピリジン 2 イル) 3 メチル 6 ペンタフルオロエチル 3H イミダゾ[4,5-C]ピリダジン (0.40 g, 0.73 mmol) の DME : H₂O = 4 : 1 (v/v) 溶液 (4 mL) にビニルトリフルオロボレート カリウム塩 (0.15 g, 1.1 mmol) とジフェニルホスフィノフェロセンジクロロパラジウム・ジクロロメタン錯体 (0.060 g, 0.073 mmol) と炭酸セシウム (0.71 g, 2.2 当量) を加え 80 で1時間攪拌した。反応終了後シリカゲルを加え、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2 (3 エチルスルホニル 5 ビニルピリジン 2 イル) 3 メチル 6 ペンタフルオロエチル 3H イミダゾ[4,5-C]ピリダジンを得た。

物性：融点 188 190

【0256】

参考例 4.2 [3 エチルスルホニル 5 (1,2-ジヒドロキシエチル)ピリジン 2 イル] 3 メチル 6 ペンタフルオロエチル-3H イミダゾ[4,5-C]ピリダジンの製造方法
【化38】



2 (3 エチルスルホニル 5 ビニルピリジン 2 イル) 3 メチル 6 ペンタフルオロエチル 3H イミダゾ[4,5-C]ピリダジンの THF : 水 = 2 : 1 (v/v) 溶液 (4 mL) に N-メチルモルホリンオキシド (0.51 g, 2.20 mmol, 50% 水溶液) と四酸化オスミウム (1.8 mL, 0.22 mmol, 0.039

10

20

30

40

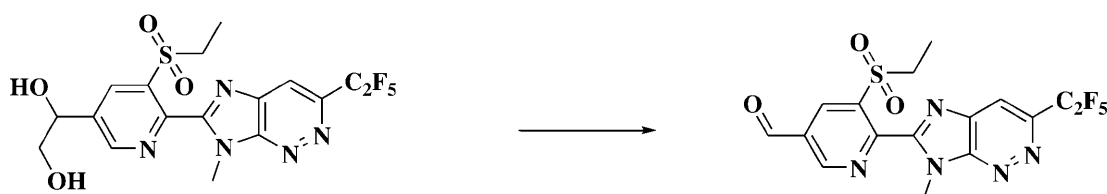
50

Mt-ブタノール溶液)を加え、室温で終夜撹拌した。飽和炭酸ナトリウム水溶液を加えた後、AcOEtで三回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、MgSO₄で乾燥、濾過し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-[3-エチルスルホニル-5-(1,2-ジヒドロキシエチル)ピリジン-2-イル]-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジン(0.31g, 0.64mmol, 88%)を得た。

物性：¹H NMR(CDCl₃): 9.04(d, 1H), 8.58(d, 1H), 8.22(s, 1H), 5.12(brt, 1H), 4.06(s, 3H), 4.00(m, 1H), 3.75(q, 2H), 3.82(m, 1H), 1.36(t, 3H)

【0257】

参考例5.2 (3-エチルスルホニル-5-ホルミルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジンの製造方法【化39】



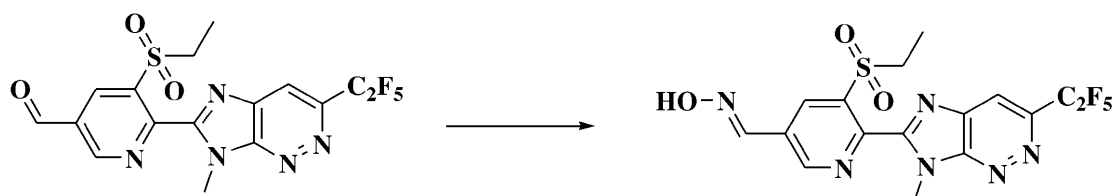
2-[3-エチルスルホニル-5-(1,2-ジヒドロキシエチル)ピリジン-2-イル]-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジン(0.29g, 0.60mmol)のTHF:水=2:1(v/v)溶液(6mL)に過ヨウ素酸ナトリウム(0.26g, 1.2mmol)を加え室温で2時間撹拌した。反応終了後、AcOEtで三回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥、濾過し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、2-(3-エチルスルホニル-5-ホルミルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジン(0.25g, 0.56mmol, 92%)を得た。

物性：融点238-239

【0258】

製造実施例1.2 (3-エチルスルホニル-5-ヒドロキシイミノピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジン(化合物番号: 1-189)の製造方法

【化40】



2-(3-エチルスルホニル-5-ホルミルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジン(0.030g, 0.067mmol)のエタノール溶液(1mL)にヒドロキシシルアミン塩酸塩(0.0070g, 0.10mmol)と酢酸ナトリウム(0.0080g, 0.10mmol)を加え2時間加熱還流した。反応溶液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルホニル-5-ヒドロキシイミノピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジン(0.028g, 0.061mmol, 92%)を得た。

物性：融点240-242

【0259】

10

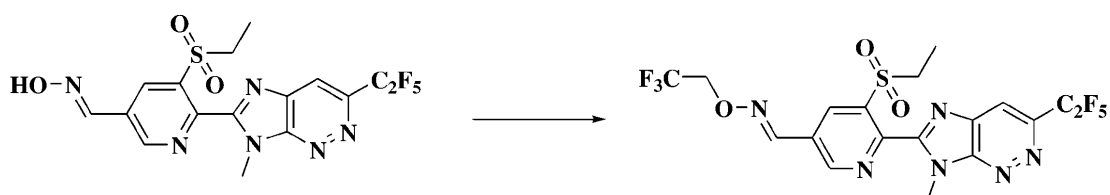
20

30

40

50

製造実施例 2.2 (3 エチルスルホニル 5 (2, 2, 2 トリフルオロエトキシイミノ)ピリジン 2 イル) 3 メチル 6 ペンタフルオロエチル 3 H イミダゾ[4, 5 C]ピリダジン(化合物番号: 1-246)の製造方法
【化41】

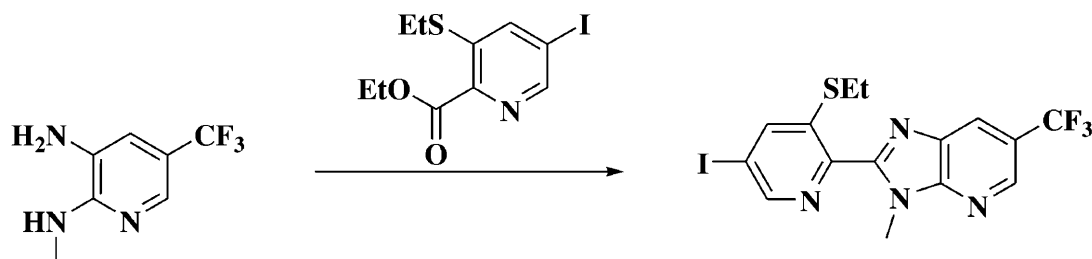


2 (3 エチルスルホニル 5 ヒドロキシイミノピリジン 2 イル) 3 メチル 6 ペンタフルオロエチル 3 H イミダゾ[4, 5 C]ピリダジン(0.075 g)のN, N ジメチルホルムアミド溶液(1 mL)に0 で炭酸セシウム(0.11 g)とトリフルオロメタンスルホン酸2, 2, 2 トリフルオロエチルエステル(75 mg)を加え、室温で2時間撹拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して2 (3 エチルスルホニル 5 (2, 2, 2 トリフルオロエトキシイミノ)ピリジン 2 イル) 3 メチル 6 ペンタフルオロエチル 3 H イミダゾ[4, 5 C]ピリダジン(0.055 g, 63%)を得た。
物性: 融点 207 208

【0260】

参考例 6.

2 (3 エチルチオ 5 ヨードピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 b]ピリジンの製造方法
【化42】



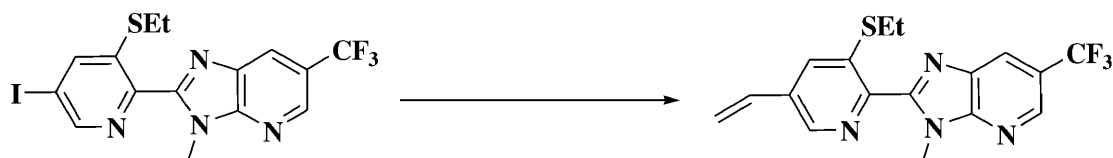
0.71 gの3 アミノ 2 メチルアミノ 5 トリフルオロメチルピリジンのテトラヒドロフラン溶液(15 mL)に、氷冷下、水素化ナトリウム(0.18 g)を加え、ここに3 エチルチオ 5 ヨード 2 ピリジincarボン酸エチル(1.25 g)のTHF溶液(5 mL)を加えた後、室温に戻して2時間撹拌した。反応終了後、1 M塩酸溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を留去した。得られた残渣にNMP(20 mL)とTsOH·H₂O(1.9 g)を加え、150 で3時間撹拌した。反応終了後、飽和NaHCO₃水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、溶媒を留去しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2 (3 エチルチオ 5 ヨードピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 b]ピリジン(1.52 g, 89%)を得た。

【0261】

参考例 7.

2 (3 エチルチオ 5 ビニルピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 b]ピリジンの製造方法

【化43】



前記製法で製造した1.52 gの2-(3-エチルチオ-5-ヨードピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンのDME : H₂O = 4 : 1 (v/v) 溶液(20 mL)にポタシウムビニルトリフルオロボレート(potassium vinyltrifluoroborate、0.44 g)とPdCl₂(dppf)・acetone(0.13 g)とCs₂CO₃(2.1 g)を加え2時間加熱還流した。反応終了後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(3-エチルチオ-5-ビニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(0.85 g、71%)を得た。なお、dppfは1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンを表す。

10

【0262】

参考例8.

2-(3-エチルスルホニル-5-ホルミルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンの製造方法

20

【化44】



前記製法で製造した0.85 gの2-(3-エチルチオ-5-ビニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンのTHF : pH7 buffer水溶液 = 2 : 1 (v/v) 溶液(20 mL)にNMO(N-メチルモルホリン N-オキsid) (1.64 g, 50% in H₂O)とOsO₄(6.0 mL, 0.039 M in t-BuOH)を加え、室温で終夜撹拌した。その後NaIO₄(1.5 g)を加え室温で2時間撹拌した。反応終了後飽和Na₂S₂O₃溶液を加えた後、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(3-エチルスルホニル-5-ホルミルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(0.54 g, 86%)を得た。

30

【0263】

製造実施例3. 2-(3-エチルスルホニル-5-(ヒドロキシイミノ)ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(化合物番号: 2-3)の製造方法

40

【化45】



0.54 gの2-(3-エチルスルホニル-5-ホルミルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンのエタノール溶液(10 mL)に塩酸ヒドロキシルアミン(0.14 g)と酢酸ナトリウム(0.1

50

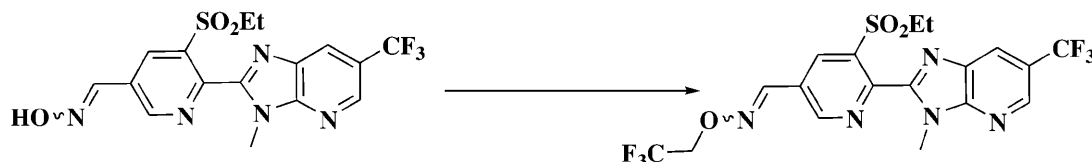
7 g) を加え、4 時間加熱還流した。反応終了後、減圧濃縮しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2 (3 エチルスルホニル 5 (ヒドロキシイミノ)ピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 b]ピリジン (0.50 g, 89%) を得た。

【0264】

製造実施例 4 .

2 (3 エチルスルホニル 5 (2, 2, 2 トリフルオロエトキシイミノ)ピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 b]ピリジン (化合物番号: 2-33) の製造方法

【化46】

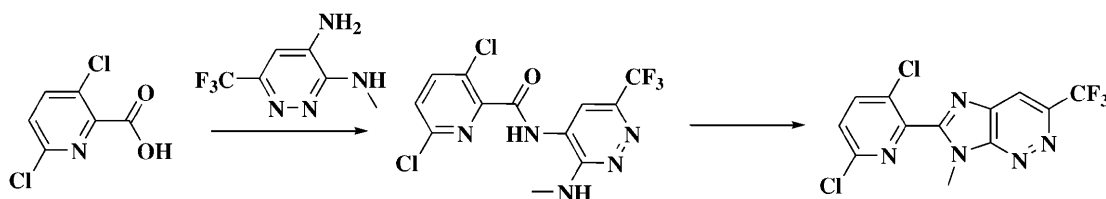


0.05 g の 2 (3 エチルスルホニル 5 (ヒドロキシイミノ)ピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 b]ピリジン DMF 溶液 (1 mL) に Cs_2CO_3 (0.06 g) とトリフルオロメタンスルホン酸 2, 2, 2-トリフルオロエチル (0.06 mg) を加え、室温で1時間撹拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して 2 (3 エチルスルホニル 5 (2, 2, 2 トリフルオロエトキシイミノ)ピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 b]ピリジン (0.042 g, 71%) を得た。

【0265】

参考例 9 . 2 (3, 6 ジクロロピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 C]ピリダジンの製造方法

【化47】



1 g の 3, 6 ジクロロ 2 ピリジンカルボン酸のトルエン溶液 (5 mL) に 0 で DMF (0.02 mL) と SOCl_2 (1.0 mL) を加えた後、2 時間加熱還流した。反応終了後、減圧濃縮した。当該残渣の THF 溶液 (5 mL) を 0 で 1.0 g の 4 アミノ 3 メチルアミノ 6 トリフルオロメチルピリジン 5 mL の THF 溶液に加えた後、室温で2時間撹拌した後、減圧濃縮した。残渣に酢酸 (10 mL) を加え 2 時間加熱撹拌した。反応終了後減圧濃縮しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2 (3, 6 ジクロロピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 C]ピリダジンの (3.2 g, 62%, 2 工程) を得た。

【0266】

参考例 10 . 2 (3 エチルチオ 6 クロロピリジン 2 イル) 3 メチル 6 トリフルオロメチル 3 H イミダゾ[4, 5 C]ピリダジンの製造方法

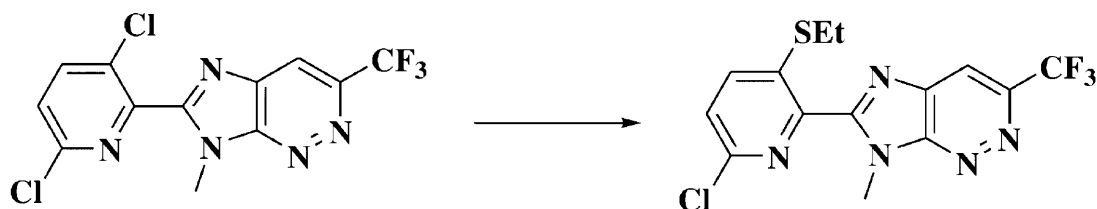
10

20

30

40

【化48】



1.1 gの2-(3,6ジクロロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジンのTHF溶液(20 mL)に0でNaH(0.2 g)とEtSH(0.24 mL)を加えた後、室温で1時間撹拌した。反応終了後、飽和NH₄Cl水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(3-エチルチオ-6-クロロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジン(0.82 g、68%)を得た。

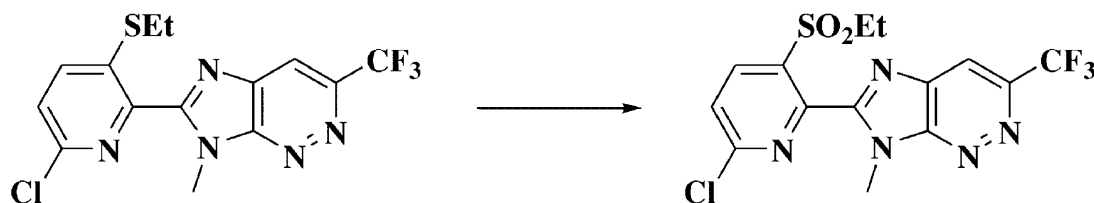
10

【0267】

参考例1.1.2-(3-エチルスルホニル-6-クロロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジンの製造方法

【化49】

20



0.82 gの2-(3-エチルチオ-6-クロロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジンの酢酸エチル溶液(20 mL)に室温でm-クロロ過安息香酸(1.13 g)を加え、2時間撹拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(3-エチルスルホニル-6-クロロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジン(0.89 g、定量的)を得た。

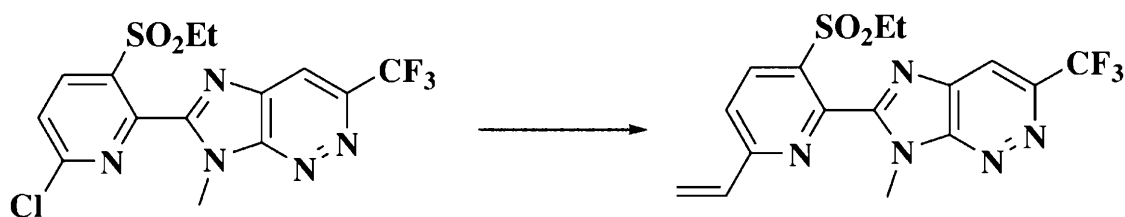
30

【0268】

参考例1.2.2-(3-エチルスルホニル-6-ビニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジンの製造方法

【化50】

40



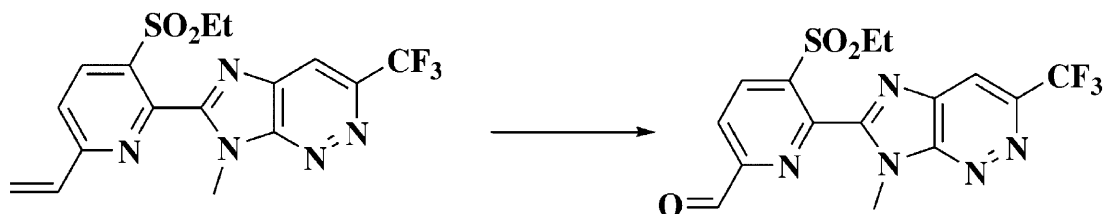
0.92 gの2-(3-エチルスルホニル-6-クロロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-C]ピリダジンのDME:H₂O=4:1溶液(10 mL)にpotassium vinyltrifluoroborate(0.45 g)とPdCl₂(dppf)·acetone(0.

50

17 g)と Cs_2CO_3 (1.5 g)を加え80 で1時間撹拌した。反応終了後、減圧濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(3-エチルスルホニル-6-ビニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジン(0.59 g、66%)を得た。

【0269】

参考例13.2 (3-エチルスルホニル-6-ホルミルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジンの製造方法【化51】



10

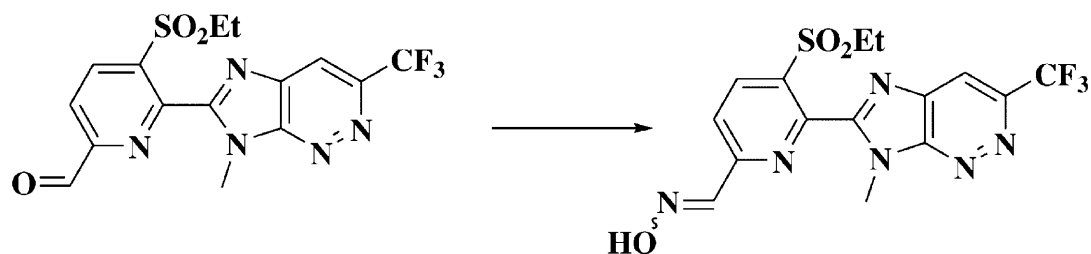
0.59 gの2-(3-エチルスルホニル-6-ビニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジンのTHF : pH7リン酸緩衝液2 : 1溶液(14 mL)にNMO (1.04 g, 50% in H_2O)と OsO_4 (3.0 mL, 0.039 M in t-BuOH)を加え、室温で終夜撹拌した。その後 NaIO_4 (0.38 g)を加え室温で2時間撹拌した。反応終了後飽和 $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ 溶液を加えた後、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(3-エチルスルホニル-6-ホルミルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジン(0.51 g、86%)を得た。

20

【0270】

製造実施例5.2 (3-エチルスルホニル-6-(ヒドロキシイミノ)ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジン(化合物番号: 3-1)の製造方法【化52】

30



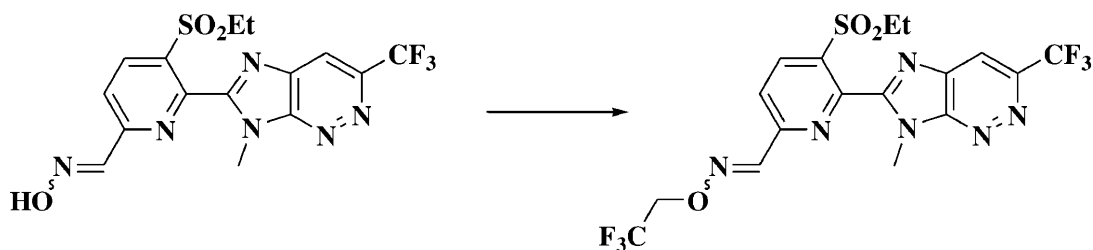
0.51 gの2-(3-エチルスルホニル-6-ホルミルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジンのエタノール溶液(5 mL)に塩酸ヒドロキシルアミン(0.13 g)と酢酸ナトリウム(0.26 g)を加え、2時間加熱還流した。反応終了後、減圧濃縮しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(3-エチルスルホニル-6-(ヒドロキシイミノ)ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジン(0.48 g、91%)を得た。

40

【0271】

製造実施例6.2 (3-エチルスルホニル-6-(2,2,2-トリフルオロエトキシイミノ)ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジン(化合物番号: 3-2)の製造方法

【化53】

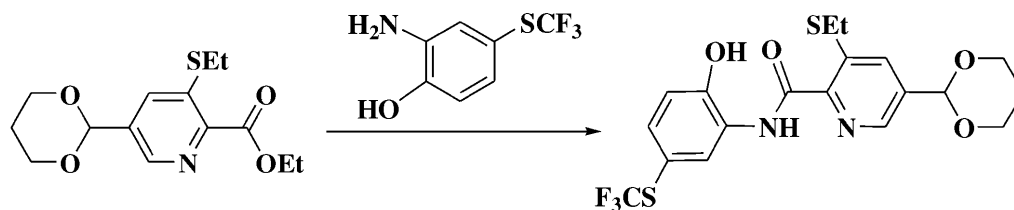


0.1 g の 2-(3-エチルスルホニル-6-(ヒドロキシミノ)ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジンの DMF 溶液 (1 mL) に Cs_2CO_3 (0.15 g) とトリフルオロメタンスルホン酸 2,2,2-トリフルオロエチル (0.11 mg) を加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して 2-(3-エチルスルホニル-6-(2,2,2-トリフルオロエトキシミノ)ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリダジン (0.062 g、68%) を得た。

【0272】

参考例 14.3 エチルチオ-5-(1,3-ジオキサソ-2-イル)-N-(2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルチオ)フェニル)-2-ピリジンカルボン酸アミドの製造方法

【化54】

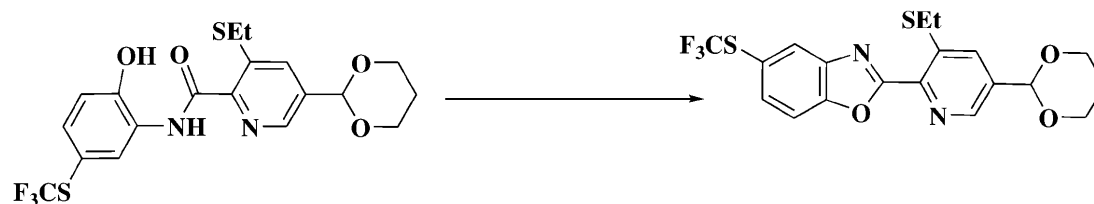


中間体 (2e4) の製造方法で製造した 0.60 g の 3-エチルチオ-5-(1,3-ジオキサソ-2-イル)-2-ピリジンカルボン酸エチルエステルの THF 溶液 (10 mL) に 0 で NaH (0.32 g) を加えた後、2-アミノ-4-(トリフルオロメチルチオ)フェノール (0.79 g) の THF 溶液 (3 mL) を加え、50 で 2 時間攪拌した。反応終了後、飽和 NH_4Cl 水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、3-エチルチオ-5-(1,3-ジオキサソ-2-イル)-N-(2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルチオ)フェニル)-2-ピリジンカルボン酸アミド (0.73 g、60%) を得た。

【0273】

参考例 15.2 (5-(1,3-ジオキサソ-2-イル)-3-エチルチオ-ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールの製造方法

【化55】



0.73 g の 3-エチルチオ-5-(1,3-ジオキサソ-2-イル)-N-(2-ヒドロキシ-5-(トリフルオロメチルチオ)フェニル)-2-ピリジンカルボン酸アミ

10

20

30

40

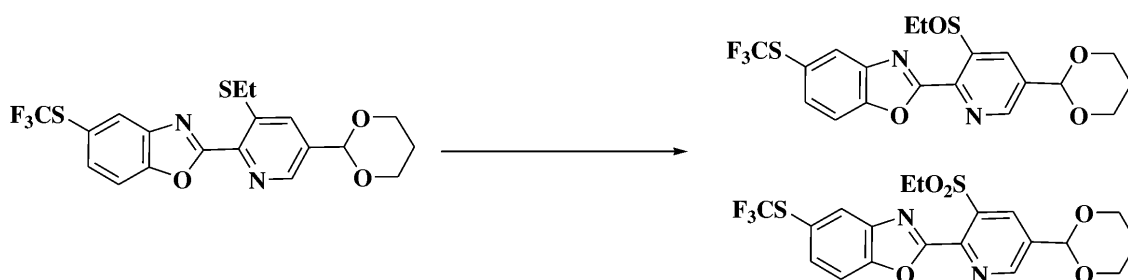
50

ドのTHF溶液(5 mL)に PPh_3 (1.04 g) とアゾジカルボン酸ビス(2-メトキシエチル) (0.93 g)を加えた後、60 °Cで1時間撹拌した。反応終了後、水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(5-(1,3-ジオキサン-2-イル)-3-エチルチオピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール(0.70 g、定量的)を得た。

【0274】

参考例16.2 (5-(1,3-ジオキサン-2-イル)-3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールの製造方法

【化56】



(0.68 g)の2-(5-(1,3-ジオキサン-2-イル)-3-エチルチオピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールの酢酸エチル溶液(15 mL)に室温でm-クロロ過安息香酸(0.74 g)を加え、2時間撹拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(5-(1,3-ジオキサン-2-イル)-3-エチルスルフィニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール(0.31 g, 40%)と2-(5-(1,3-ジオキサン-2-イル)-3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール(0.40 g, 56%)を得た。

【0275】

製造実施例7.(E)-5-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンアルデヒドオキシム(化合物番号:4-1-1)の製造方法

【化57】



0.31 gの2-(5-(1,3-ジオキサン-2-イル)-3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールのTHF溶液(20 mL)に2M HCl溶液(10 mL)を加え、終夜撹拌した。反応混合物にAcOH(20 mL)を加え、80 °Cで1時間撹拌した後、塩酸ヒドロキシルアミン(0.15 g)を加えさらに1時間撹拌した。反応終了後、減圧濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、5-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンアルデヒドオキシム(0.22 g, 78%)を得た。

【0276】

製造実施例8.(E)-5-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチルチオ)ベ

10

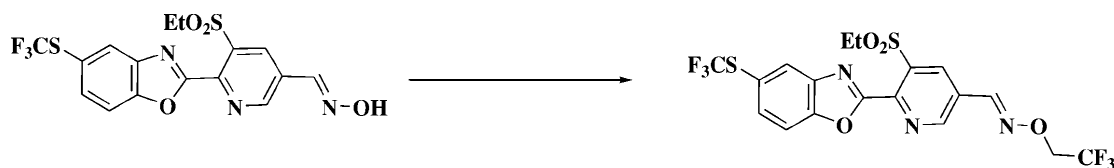
20

30

40

50

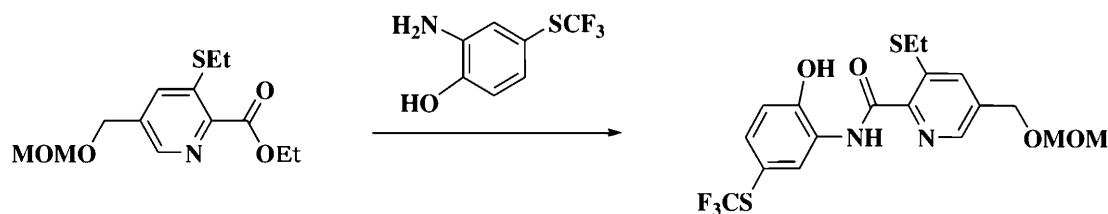
ンゾ [d] オキサゾール 2 イル) ニコチンアルデヒド O (2 , 2 , 2 トリフル
オロエチル) オキシム (化合物番号 : 4 1 2) の製造方法
【化 5 8】



0 . 1 g の (E) (5 エチルスルホニル) 6 (トリフルオロメチルチオ) ベ
ンゾ [d] オキサゾール 2 イル) ニコチンアルデヒドオキシム DMF 溶液 (1 mL)
に Cs_2CO_3 (0 . 15 g) とトリフルオロメタンスルホン酸 2 , 2 , 2 トリフル
オロエチル (0 . 11 mg) を加え、室温で1時間攪拌した。反応終了後、塩化アンモニ
ウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後
、減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して (E) (5 エチルス
ルホニル) 6 (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾール 2 イル) ニ
コチンアルデヒド O (2 , 2 , 2 トリフルオロエチル) オキシム (0 . 031 g ,
32%) を得た。

【 0 2 7 7 】

参考例 17 . 3 エチルチオ 5 (メトキシメトキシ) N (2 ヒドロキシ 5
(トリフルオロメチルチオ) フェニル) 2 ピリジンカルボン酸アミドの製造方法
【化 5 9】



中間体 (2 b 2) の製造方法で製造した 0 . 64 g の 3 エチルチオ 5 メトキ
シメチル 2 ピリジンカルボン酸エチルエステルの THF 溶液 (10 mL) に 0 で
 NaH (0 . 36 g) を加えた後、2 アミノ 4 (トリフルオロメチルチオ) フェ
ニル (0 . 4 g) の THF 溶液 (2 mL) を加え、50 で2時間攪拌した。反応終了
後、飽和 NH_4Cl 水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した
。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラ
フィーで精製して、3 エチルチオ 5 (メトキシメトキシ) N (2 ヒドロキシ
5 (トリフルオロメチルチオ) フェニル) 2 ピリジンカルボン酸アミド (0 . 73
g , 60%) を得た。

【 0 2 7 8 】

参考例 18 . 2 (3 エチルチオ 5 (メトキシメトキシ) ピリジン 2 イル)
5 (トリフルオロメチルチオ) ベンゾ [d] オキサゾールの製造方法
【化 6 0】



0 . 73 g の 3 エチルチオ 5 (メトキシメトキシ) N (2 ヒドロキシ
5 (トリフルオロメチルチオ) フェニル) 2 ピリジンカルボン酸アミドの THF 溶
液 (5 mL) に PPh_3 (1 . 04 g) とアゾジカルボン酸ビス (2 メトキシエチ
50

ル) (0.93 g) を加えた後、60 で1時間攪拌した。反応終了後、H₂Oを加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(3-エチルチオ-5-(メトキシメトキシ)ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール(0.70 g、定量的)を得た。

【0279】

参考例19.2 (5-メトキシメトキシ-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールの製造方法

【化61】



10

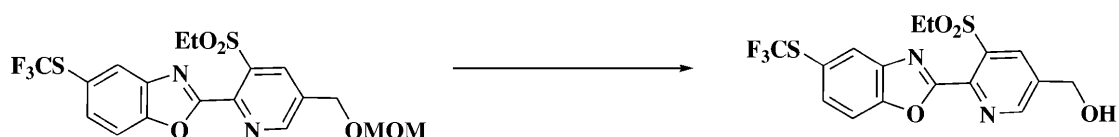
0.68 gの2-(3-エチルチオ-5-(メトキシメトキシメチル)ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールの酢酸エチル溶液(15 mL)に室温でm-クロロ過安息香酸(0.74 g)を加え、2時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧乾燥し、シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(5-メトキシメトキシ-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール(0.40 g, 60%)を得た。

20

【0280】

参考例20.2 (3-エチルスルホニル-5-(ヒドロキシメチル)ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールの製造方法

【化62】



30

0.55 gの2-(5-メトキシメトキシ-3-エチルスルホニル-ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールのメタノール溶液(7 mL)に濃塩酸(2 mL)を加え、室温で終夜攪拌した。反応終了後、減圧乾燥し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、2-(3-エチルスルホニル-5-(ヒドロキシメチル)ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール(0.34 g, 70%)を得た。

【0281】

参考例21. (5-エチルスルホニル)-6-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンアルデヒドの製造方法

【化63】



0.34 gの2-(3-エチルスルホニル-5-(ヒドロキシメチル)ピリジン-2-イル)-5-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾールCHCl₃溶液(

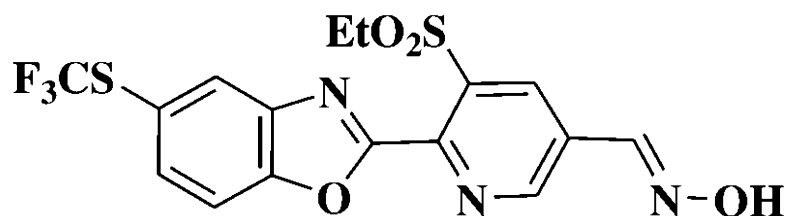
50

7 mL) に B A I B ([ビス(アセトキシ)-イオド]ベンゼン) (0.32 g) と T E M P O (2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-1-オキシド) (0.028 g) を加え、室温で終夜撹拌した。反応終了後、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮しシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、5-エチルスルホニル-6-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンアルデヒド (0.26 g, 75%) を得た。

【0282】

前記方法で製造した(5-エチルスルホニル)-6-(トリフルオロメチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)ニコチンアルデヒドを、上記製造実施例7,8に記載した製造方法に従って、発明化合物に誘導した。すなわち、下記式

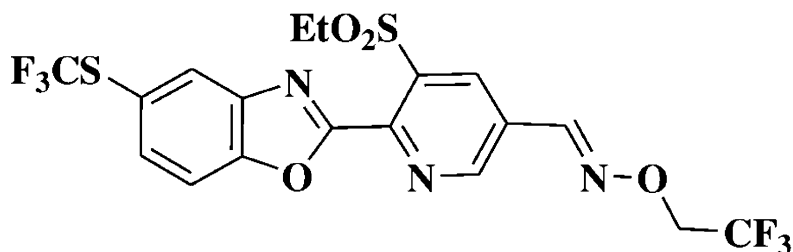
【化64】



20

(E異性体)で示される化合物を得、次いで、これを原料にして製造実施例8に記載の方法に従って、下記式

【化65】



30

(E異性体)で示される化合物を得た。

【0283】

以下に、製剤の実施例を示すが、これらに限定されるものではない。製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

【0284】

製剤例1.

本発明化合物	10部	
キシレン	70部	40
N-メチルピロリドン	10部	
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと		
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合(重量比1:1)	10部	
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。		

【0285】

製剤例2.

本発明化合物	3部	
クレー粉末	82部	
珪藻土粉末	15部	
以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。		50

【0286】

製剤例3.

本発明化合物	5部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90部
リグニンスルホン酸カルシウム	5部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

【0287】

製剤例4.

本発明化合物	20部
カオリンと合成高分散珪酸	75部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合(重量比1:1)	5部

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

10

【0288】

次に本発明の試験例を示すが、これらに限定されるものではない。

【0289】

試験例1.

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) に対する防除価試験

直径8cm、高さ8cmのプラスチックポットにハクサイを植えてモモアカアブラムシを繁殖させ、それぞれのポットの寄生虫数を調査した。本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類を水に分散させて500ppmの薬液に希釈し、該薬液をポット植えハクサイの茎葉に散布して風乾後、ポットを温室に保管し、薬剤散布後6日目にそれぞれのハクサイに寄生しているモモアカアブラムシの寄生虫数を調査し、下記の式より防除価を算出し、下記判定基準に従って判定した。

20

【0290】

【数1】

$$\text{防除価} = 100 - \left\{ \frac{(T \times C_a)}{(T_a \times C)} \right\} \times 100$$

【0291】

T_a : 処理区の散布前寄生虫数

T : 処理区の散布後寄生虫数

C_a : 無処理区の散布前寄生虫数

C : 無処理区の散布後寄生虫数

【0292】

判定基準

A . . . 防除価100%

B . . . 防除価99%~90%

C . . . 防除価89%~80%

D . . . 防除価79%~50%

40

【0293】

その結果、本発明化合物の1-3、1-60、1-72、1-189、1-192、1-195、1-198、1-201、1-204、1-207、1-210、1-213、1-216、1-219、1-222、1-225、1-228、1-231、1-234、1-237、1-240、1-243、1-246、1-258、1-306、1-352、1-353、1-354、2-3、2-6、2-9、2-12、2-15、2-33、2-39、2-45、2-235、2-236、2-237、2-238、2-239、2-240、2-241、3-1、3-2、3-3、3-4、3-5、3-11、3-12、3-13、4-1、4-2、4-3、4-11、4-12、4-13、4-14、4-15、4-29、4-30、4-31、4-32、4-33、4-34、5-

50

15、5-16、5-17、5-18、5-19、及び5-93は、Aの活性を示した。

【0294】

試験例2. ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*) に対する殺虫試験

本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物又はその塩類を水に分散させて500ppmの薬液に希釈し、該薬液にイネ実生(品種:日本晴)を30秒間浸漬し、風乾した後にガラス試験管に入れ、ヒメトビウンカ3令を各10頭ずつ接種した後に綿栓をし、接種8日後に生死虫数を調査し、補正死虫率を下記の式より算出し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。

【0295】

【数2】

10

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{(\text{無処理区生存率} - \text{処理区生存率})}{(\text{無処理区生存率})} \times 100$$

【0296】

その結果、本発明化合物の1-3、1-60、1-72、1-189、1-192、1-195、1-198、1-201、1-204、1-207、1-210、1-213、1-216、1-219、1-222、1-225、1-228、1-231、1-234、1-237、1-240、1-243、1-246、1-258、1-306、1-352、1-353、1-354、2-3、2-6、2-9、2-12、2-15、2-33、2-39、2-45、2-235、2-236、2-237、2-238、2-239、2-240、2-241、3-1、3-2、3-3、3-4、3-5、3-11、3-12、3-13、4-1、4-2、4-3、4-11、4-12、4-13、4-14、4-15、4-29、4-30、4-31、4-32、4-33、4-34、5-15、5-16、5-17、5-18、5-19、及び5-93は、Aの活性を示した。

20

【0297】

試験例3. コナガ (*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を本発明の一般式(1)で表されるオキシム基を有する縮合複素環化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。1区10頭3連制。

30

【0298】

【数3】

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$$

40

【0299】

その結果、本発明化合物の1-3、1-60、1-72、1-189、1-192、1-195、1-198、1-201、1-204、1-207、1-210、1-213、1-216、1-219、1-222、1-225、1-228、1-231、1-234、1-237、1-240、1-243、1-246、1-258、1-306、1-352、1-353、1-354、2-3、2-6、2-9、2-12、2-15、2-33、2-39、2-45、2-235、2-236、2-237、2-238、2-239、2-240、2-241、3-1、3-2、3-3、3-4、3-5、3-11、3-12、3-13、4-1、4-2、4-3、4-11、4-12、4-13、4-

50

14、4-15、4-29、4-30、4-31、4-32、4-33、4-34、5-15、5-16、5-17、5-18、5-19、及び5-93は、Aの活性を示した。

【産業上の利用可能性】

【0300】

本発明に係る化合物は、幅広い農園芸用害虫に対して優れた防除効果を有しており、有用である。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 6 1 K	31/4439 (2006.01)	A 6 1 K	31/4439
A 6 1 P	33/14 (2006.01)	A 6 1 P	33/14
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04
A 0 1 N	43/90 (2006.01)	A 0 1 N	43/90 1 0 5
A 0 1 N	47/02 (2006.01)	A 0 1 N	47/02
A 0 1 N	43/76 (2006.01)	A 0 1 N	43/90 1 0 4
A 0 1 P	7/02 (2006.01)	A 0 1 N	43/76 1 0 1
A 0 1 P	5/00 (2006.01)	A 0 1 P	7/02
A 0 1 P	9/00 (2006.01)	A 0 1 P	5/00
A 6 1 K	31/444 (2006.01)	A 0 1 P	9/00
		C 0 7 D	471/04 1 0 7 Z
		A 6 1 K	31/444

- (72)発明者 諏訪 明之
大阪府河内長野市小山田町3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内
- (72)発明者 藤江 隼平
大阪府河内長野市小山田町3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内

審査官 谷尾 忍

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

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D 4 1 3 / 0 4
A 0 1 N 4 3 / 7 6
A 0 1 N 4 3 / 9 0
A 0 1 N 4 7 / 0 2
A 6 1 K 3 1 / 4 3 7
A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9
A 6 1 K 3 1 / 4 4 4
A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 5
C 0 7 D 4 7 1 / 0 4
C 0 7 D 4 8 7 / 0 4
C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)