

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2011年10月13日(13.10.2011)



PCT



(10) 国際公開番号
WO 2011/125317 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 249/08 (2006.01) C07D 403/06 (2006.01)
A01N 43/647 (2006.01) C07D 403/14 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01) C07D 405/14 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01) C07D 409/14 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01) C07D 413/14 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01) C07D 417/14 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2011/001964

(22) 国際出願日: 2011年3月31日(31.03.2011)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願 2010-085992 2010年4月2日(02.04.2010) JP
特願 2010-087011 2010年4月5日(05.04.2010) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): クミアイ化学工業株式会社(KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1100008 東京都台東区池之端1丁目4番26号 Tokyo (JP). イハラケミカル工業株式会社(IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1100008 東京都台東区池之端1丁目4番26号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

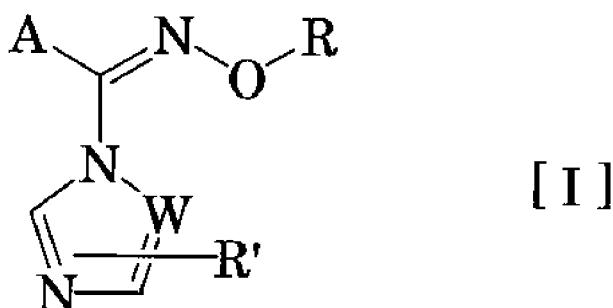
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 福本俊一郎(FUKUMOTO, Shunichirou) [JP/JP]; 〒4371213 静岡県磐田市塩新田408番地の1株式会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 鳥谷部啓二(TORIYABE, Keiji) [JP/JP]; 〒4371213 静岡県磐田市塩新田408番地の1株式会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 加藤克也(KATO, Katsuya) [JP/JP]; 〒4371213 静岡県磐田市塩新田408番地の1株式会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 堀俊彦(HORI, Toshihiko) [JP/JP]; 〒4371213 静岡県磐田市塩新田408番地の1株式会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 小松正明(KOMATSU, Masaaki) [JP/JP]; 〒1100008 東京都台東区池之端1丁目4番26号クミアイ化学工業株式会社内 Tokyo (JP). 伊藤知洋(ITO, Tomohiro) [JP/JP]; 〒1100008 東京都台東区池之端1丁目4番26号クミアイ化学工業株式会社内 Tokyo (JP). 中野勇樹(NAKANO, Yukio) [JP/JP]; 〒1100008 東京都台東区池之端1丁目4番26号クミアイ化学工業株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 小林雅人(KOBAYASHI, Masato); 〒1620821 東京都新宿区津久戸町4-1ASKビル4-A Tokyo (JP).

[続葉有]

(54) Title: TRIAZOLE DERIVATIVE AND PEST CONTROL AGENT

(54) 発明の名称: トリアゾール誘導体及び有害生物防除剤



[I]

(57) Abstract: Disclosed is a triazole derivative or a salt thereof having excellent pest control activity, and also disclosed is a pest control agent containing the same as an active ingredient. Specifically disclosed is a triazole derivative represented by general formula [I] or an agriculturally acceptable salt thereof. In general formula [I], A represents 1,2,3-triazole or 1,2,4-triazole and may be substituted with one substituent X or the same or different two substituents X's, each of which independently represents a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₈ alkyl group, or the like; R represents a hydrogen atom, a C₁-C₈ alkyl group, a C₂-C₆ alkenyl group, a C₂-C₆ alkynyl group, a C₃-C₆ cycloalkyl group, or the like; W represents a nitrogen atom or a methine group, and when W is a nitrogen atom, the nitrogen atom may be oxidized to N-oxide. Also specifically disclosed is a pest control agent containing the derivative or a salt thereof as an active ingredient.

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2011/125317 A1



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

MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 国際調査報告（条約第21条(3)）

【課題】 本発明は、優れた有害生物防除活性を有するトリアゾール誘導体又はその塩及びそれを有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤を提供する。 **【解決手段】** 本発明は、一般式 [I] [式中、Aは、1, 2, 3-トリアゾール或いは1, 2, 4-トリアゾールの何れかを表すと共に1～2個の同一又は相異なる置換基Xで置換されていてもよく、Xはそれぞれ独立して、ハロゲン原子、シアノ基、C₁～C₈アルキル基等を表し、Rは、水素原子、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シクロアルキル基等を表し、Wは、窒素原子、メチル基を表し、窒素原子のときは酸化されてN-オキシドになつてもよい。]で表されるトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩及び該誘導体又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

明細書

発明の名称：トリアゾール誘導体及び有害生物防除剤

技術分野

[0001] 本発明は、新規なトリアゾール誘導体又はその塩及び該誘導体又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤に関するものである。

背景技術

[0002] 従来、本発明のトリアゾール誘導体に類似のアゾール誘導体に関する文献として、例えば以下の特許文献1が知られている。

[0003] しかしながら、当該特許文献には、ベンゼンカルボヒドロキシモイルアゾール誘導体が開示されているが、本発明に係るトリアゾール誘導体は開示されていない。

先行技術文献

特許文献

[0004] 特許文献1：特開平1-308260号公報

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0005] 有用作物に対して使用される殺虫剤や殺ダニ剤等の有害生物防除剤は、土壤又は茎葉に施用して、低薬量で十分な殺虫効果を示すものであることが望まれている。又、化学物質の安全性、環境に対する影響への要求が高まってきており、より安全な有害生物防除剤の開発が望まれている。又、近年、殺虫剤や殺ダニ剤等の有害生物防除剤を長年にわたって使用したことにより、これらの薬剤に対する抵抗性を獲得した有害生物が出現しており、そのため、有害生物を完全に防除することが困難になっている。更に、毒性の高い有害生物防除剤の使用については、安全性等の面で問題となっている。

[0006] 本発明の課題は、このような事情の中、従来の有害生物防除剤が有していた前記の如き問題点を解決し、安全性、防除効果等に優れた有害生物防除剤を提供することにある。

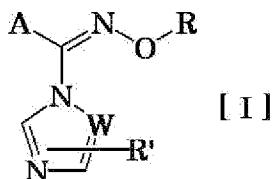
課題を解決するための手段

[0007] 本発明者らは、前記した好ましい特性を有する有害生物防除剤を開発するために、種々のトリアゾール誘導体を合成し、その生理活性について検討を重ねた。その結果、下記の一般式 [I] で示されるトリアゾール誘導体が、有害生物並びに抵抗性を獲得した有害生物に効果を示し、特にトビイロウンカ、ヒメトビウンカ、ツマグロヨコバイ、ワタアブラムシ等に代表されるカメムシ目害虫に非常に高い効果を示すことを見出し、本発明を完成したものである。

[0008] 即ち、本発明は、下記の通りの新規なトリアゾール誘導体又はその塩及び該誘導体又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤を提供するものである。

[0009] (1) 一般式 [I]

[化1]



[0010] [式中、

Aは、1, 2, 3-トリアゾール或いは1, 2, 4-トリアゾールの何れかを表すと共に、1～2個の同一又は相異なる置換基Xで置換されていてもよく、該1, 2, 3-トリアゾール又は該1, 2, 4-トリアゾールの窒素原子は酸化されてN-オキシドになってもよく、

Xは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、シアノ基、C₁～C₈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C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、C₁～C₆アルキルチオC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルコキシC₁～C₆ア

ルキル基、C₃～C₆シクロアルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシイミノC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆トリアルキルシリルC₁～C₆アルキル基、シアノC₁～C₆アルキル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₁～C₆アルキル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₂～C₆アルケニル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₂～C₆アルキニル基、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基（該基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてよい。）、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基で置換されたC₁～C₆アルキル基（該複素環基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてよい。）、又は、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基で置換されたC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基（該複素環基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてよい。）を表し、前記複素環基に窒素原子が含まれる場合は酸化されてN-オキシドになってもよく、

Rは、水素原子、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、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、シアノC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルチオC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基又はC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基を表し、

R'は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシル基、メルカプト基、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、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、ホルミル基、ヒドロキシイミノC₁～C₄アルキル基又は酸素原子（但し、R'が窒素原子に置換する場合）を表し、

Wは、窒素原子又はメチン基を表す。】

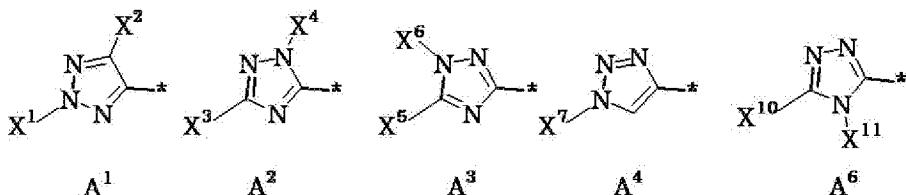
で表されることを特徴とするトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩。

[0011] 「置換基群α」

ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、C₁～C₆ハロアルコキシ基、メチレンジオキシ基、ニトロ基、C₁～C₆アルコキカルボニル基、カルバモイル基及びシアノ基

[0012] (2) 前記一般式 [I]において、Aが式、

[化2]



[0013] A¹、A²、A³、A⁴又はA⁶で示される複素環基であり、

X¹、X³、X⁴、X⁵、X⁶、X⁷、X¹⁰又はX¹¹はそれぞれ独立して、水素原子、C₁～C₈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C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、C₁～C₆アルキルチオC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基、C₃～C₆シクロアルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシイミノC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆トリアルキルシリルC₁～C₆アル

キル基、シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニル $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニル $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される 1 から 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 1 から 10 の複素環基（該基は 1 ~ 5 個のハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される 1 から 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 1 から 10 の複素環基で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該複素環基は 1 ~ 5 個のハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）、又は、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される 1 から 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 1 から 10 の複素環基で置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該複素環基は 1 ~ 5 個のハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）を表し、

X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基を表す、(1) に記載のトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩。

[0014] (3) 前記一般式 [I] において、A が式、

A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 又は A^6 で示される複素環基であり、

X^1 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^{10} 又は X^{11} がそれぞれ独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_8$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 C_1

～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシイミノC₁～C₆アルキル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₁～C₆アルキル基、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基（該基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）又は同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基で置換されたC₁～C₆アルキル基（該複素環基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）であり、

X²が、水素原子、ハロゲン原子又はC₁～C₆アルキル基である、

(2)に記載のトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩。

[0015] (4) (1)～(3)のいずれかに記載のトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

発明の効果

[0016] 本発明のトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩を有効成分として含有する有害生物防除剤は、農園芸分野における広範囲の有害生物に対して優れた防除効果を示し、又、抵抗性を帯びた有害生物をも防除することができ、特にトビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ、ワタアブラムシ、タバココナジラミ等に代表されるカメムシ目害虫に卓効を示す。

発明を実施するための最良の形態

[0017] 本明細書に記載された記号及び用語について説明する。

[0018] 本発明において有害生物防除剤とは、農園芸分野、家畜及びペット等の動

物、家庭、或いは防疫用の殺虫剤、殺ダニ剤、殺センチュウ剤等を意味する。

[0019] ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を示す。

[0020] $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が1～6の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*s e c*-ブチル、イソブチル、*t e r t*-ブチル、*n*-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、イソペンチル、1-エチルプロピル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、ネオペンチル、*n*-ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-イソヘキシル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル又は1-エチル-1-メチルプロピル等の基を挙げができる。

[0021] $C_1 \sim C_8$ アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が1～8の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えば前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル基における例示に加え、*n*-ヘプチル、1-メチルヘキシル、5-メチルヘキシル、4, 4-ジメチルペンチル、*n*-オクチル、1-メチルヘプチル、6-メチルヘプチル又は5, 5-ジメチルヘキシル等の基を挙げができる。

[0022] $C_2 \sim C_6$ アルケニル基とは、特に限定しない限り、炭素数が2～6の直鎖又は分岐鎖状のアルケニル基を示し、例えばビニル、1-プロペニル、イソプロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1, 3-ブタジエニル、1-ペンテニル、1-エチル-2-プロペニル、2-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、3-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、4-ペン

テニル、1-メチル-3-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-1-プロペニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 3-ペンタジエニル、1-ビニル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、1-プロピル-2-プロペニル、2-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、1-エチル-2-ブテニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-4-ペンテニル、1-エチル-3-ブテニル、1-(イソブチル)ビニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-2-プロペニル、1-(イソプロピル)-2-プロペニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-3-ブテニル、1, 1-ジメチル-2-トリメチル-2-プロペニル、1, 5-ヘキサジエニル、1-ビニル-3-ブテニル又は2, 4-ヘキサジエニル等の基を挙げができる。

[0023] $C_2 \sim C_6$ アルキニル基とは、特に限定しない限り、炭素数が2～6の直鎖又は分岐鎖状のアルキニル基を示し、例えばエチニル、1-プロピニル、2-ブロピニル、1-ブチニル、1-メチル-2-ブロピニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-ペンチニル、1-エチル-2-ブロピニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-ヘキシニル、1-(n-プロピル)-2-ブロピニル、2-ヘキシニル、1-エチル-2-ブチニル、3-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、5-ヘキシニル、1-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-ブロピニル、1-(イソプロピル)-2-ブロピニル、1, 1-ジメチ

ルー 2-ブチニル又は 2, 2-ジメチル-3-ブチニル等の基を挙げることができる。

- [0024] $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が 3 ~ 6 のシクロアルキル基を示し、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル等の基を挙げることができる。
- [0025] $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、シクロアルキル部分及びアルキル部分が上記の意味である、($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル) - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) 基を示し、例えばシクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル又はシクロヘキシルメチル等の基を挙げることができる。
- [0026] $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が上記の意味である ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - O - 基を示し、例えばメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、t - e - r - t - ブトキシベンチルオキシ、イソベンチルオキシ、ヘキシルオキシ又はイソヘキシルオキシ等の基を挙げることができる。
- [0027] $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基とは、特に限定しない限り、ハロゲン原子 1 ~ 1 1 個、より好ましくは 1 ~ 5 個のハロゲン原子によって置換された炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えば 2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル又は 2, 2, 2-トリクロロエチル等の基を挙げることができる。
- [0028] $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子 1 ~ 1 1 個、好ましくは 1 ~ 5 個で置換されている炭素数が 2 ~ 6 の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えば 3-クロロ-2-ブロペニル、2-クロロ-2-ブロペニル、3, 3-ジクロロ-2-ブロペニル又は 4, 4-ジフルオロ-3-ブテニル等の基を挙げることができる。
- [0029] $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子 1 ~ 4 個で置換されている炭素数が 2 ~ 6 の直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を示し、例えば、3-クロロ-2-ブロピニル、3-ブロモ

－2－プロピニル、3－ヨード－2－プロピニル、3－クロロ－1－プロピニル、5－クロロ－4－ペンチニル等の基を挙げることができる。

[0030] $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基とは、特に限定しない限り、ハロアルキル部分が前記の意味を有する、同一又は相異なるハロゲン原子1～13個、好ましくは1～5個で置換されている炭素数が1～6の直鎖又は分岐鎖のアルキル－O－基を示し、例えばクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は2, 2, 2－トリフルオロエトキシ等の基を挙げることができる。

[0031] $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルキルチオ基を示し、例えばメチルチオ又はエチルチオ等の基を挙げることができる。

[0032] $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルキルチオのアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルキルチオ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばメチルチオメチル又はエチルチオメチル等の基を挙げができる。

[0033] $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルキルスルフィニル基を示し、例えばメチルスルフィニル又はエチルスルフィニル等の基を挙げができる。

[0034] $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルキルスルホニル基を示し、例えばメチルスルホニル又はエチルスルホニル等の基を挙げができる。

[0035] $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルキルスルフィニルのアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルキルスルフィニル基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばメチルスルフィニルメチル又はエチルスルフィニルメチル等の基を挙げができる。

- [0036] $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルキルスルホニルのアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルキルスルホニル基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばメチルスルホニルメチル又はエチルスルホニルメチル等の基を挙げることができる。
- [0037] $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルコキシ部分が前記の意味を有する炭素数が1～6のアルコキシにより置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばメトキシメチル、エトキシメチル、イソプロポキシメチル、ペンチルオキシメチル、メトキシエチル又はブトキシエチル等の基を挙げることができる。
- [0038] $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルコキシ部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-(2-メトキシエトキシ)エチル又は2-(2-エトキシエトキシ)エチル等の基を挙げることができる。
- [0039] $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、シクロアルキル部分及びアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が3～6の($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)-O-基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばシクロプロピルオキシエチル、シクロブチルオキシエチル又はシクロプロピルオキシプロピル等の基を挙げができる。
- [0040] $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、ハロアルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のハロアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばクロロメトキシメチル、ジフルオロメトキシメチル、クロロジフルオロメトキシメチル、トリフルオロメトキシメチル又は2, 2, 2-トリフルオロエトキシメチル等の基を挙げができる。

- [0041] $C_1 \sim C_6$ アルコキシイミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルコキシ部分及びアルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の(アルコキシ)-N=により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-メトキシイミノエチル、3-メトキシイミノプロピル又は1-メトキシイミノエチル等の基を挙げることができる。
- [0042] ヒドロキシイミノ $C_1 \sim C_4$ アルキル基とは、特に限定しない限り、HO-N=により置換された炭素数が1～4のアルキル基を示し、例えばヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル等の基を挙げることができる。
- [0043] $C_1 \sim C_6$ トリアルキルシリル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有する、(トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)-S-i-基)により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばトリメチルシリルメチル基、2-トリメチルシリルエチル基、3-トリメチルシリルプロピル基又は4-トリメチルシリルブチル基等を挙げることができる。
- [0044] フェニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有するフェニルにより置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばベンジル、1-フェニルエチル又は2-フェニルエチル等を挙げることができる。
- [0045] フェニル $C_2 \sim C_6$ アルケニル基とは、特に限定しない限り、アルケニル部分が前記の意味を有するフェニルにより置換された炭素数が2～6のアルケニル基を示し、例えば1-フェニルビニル、2-フェニルビニル、3-フェニル-2-プロペニル、3-フェニル-1-プロペニル、1-フェニルメチルビニル又は5-フェニル-4-ペンテニル等を挙げることができる。
- [0046] フェニル $C_2 \sim C_6$ アルキニル基とは、特に限定しない限り、アルキニル部分が前記の意味を有するフェニルにより置換された炭素数が2～6のアルキニル基を示し、例えば3-フェニル-2-プロピニル、3-フェニル-1-プロピニル、5-フェニル-4-ペンチニル等を挙げることができる。
- [0047] シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有するにシアノ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基

を示し、例えばシアノメチル基又は1-シアノブチル基等を挙げることができる。

[0048] $C_1 \sim C_6$ アルコキカルボニル基とは、特に限定しない限り、カルボニル部分が前記の意味を有するアルコキシ基により置換されたカルボニル基を示し、例えばメトキカルボニル基又はイソプロポキシカルボニル基等を挙げることができる。

[0049] 同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基とは、特に限定しない限り、例えばピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、1, 3, 5-トリアジン、1, 2, 4-トリアジン、ピロール、ピラゾール、イミダゾール、1, 3, 4-トリアゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、テトラゾール、フラン、オキサゾール、イソオキサゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、1, 3, 4-オキサジアゾール、チオフェン、チアゾール、イソチアゾール、1, 3, 4-チアジアゾール、1, 2, 4-チアジアゾール、1, 2, 3-チアジアゾール、キノリン、インドール、ベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾイソオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾイソチアゾール、オキシラン、オキソラン又はイソキサゾリン等を挙げることができる。

[0050] 同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分に前記の意味を有する複素環が置換した炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば(テトラヒドロフラン-2-イル)メチル、(4, 5-ジヒドロイソキサゾール-5-イル)メチル、(イソキサゾール-5-イル)メチル又は(チオフェン-2-イル)メチル基等を挙げることができる。

[0051] 同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基で置換さ

れたC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基とは、特に限定しない限り、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環部分、アルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環が置換した炭素数が1～6のアルコキシ基が置換した炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば(テトラヒドロフラン-2-イル)メトキシメチル又は(テトラヒドロフラン-3-イル)メトキシメチル等の基を挙げることができる。

[0052] 農業上許容される塩とは、例えば、ナトリウム又はカリウム等のアルカリ金属の塩；カルシウム、マグネシウム又はバリウム等のアルカリ土類金属の塩；マンガン、銅、亜鉛又は鉄等の遷移金属の塩；アンモニウム塩(窒素原子は必要に応じて、1～4個の炭素数が1～4のアルキル基及び／又は1個のフェニル若しくはベンジル置換基で置換されてもよい)、好ましくはジイソプロピルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、トリメチルベンジルアンモニウム；塩酸、臭化水素酸、リン酸又は硫酸等の無機酸との塩；メタンスルホン酸等のC₁～C₄アルキルスルホン酸、ベンゼンスルホン酸若しくはトルエンスルホン酸等の芳香族スルホン酸、シュウ酸、マレイン酸、フマル酸、乳酸、酒石酸、アジピン酸又は安息香酸等の有機酸との塩を挙げることができる。

[0053] 一般式【I】を有する本発明のトリアゾール誘導体としては、上記の各種の置換基を組み合わせたものを挙げができるが、薬効の面から好ましいものは次の通りである。

[0054]

- ・ AがA¹であり、
X¹がm-フルオロフェニル基又はm-メチルフェニル基であり、
X²が水素原子であり、
Rがメチル又はエチル基であり、
R'が水素原子であり、
Wが窒素原子である化合物。

[0055] ・ AがA²であり、

X³がm-フルオロフェニル基又はp-フルオロフェニル基であり、

X⁴がメチル基であり、

Rがメチル又はエチル基であり、

R'が水素原子であり、

Wが窒素原子である化合物。

[0056] ・ AがA¹であり、

X¹がシクロプロピルメチル基、ネオペンチル基又は3, 3-ジメチルブチル基であり、

X²が水素原子であり、

Rがメチル、エチル又はイソプロピル基であり、

R'が水素原子であり、

Wが窒素原子である化合物。

[0057] 次に、一般式 [I] を有する本発明の誘導体の代表的な化合物例を表1～表139に記載する。しかしながら、本発明の誘導体に包含される化合物（以下、本発明化合物ともいう。）はこれらに限定されるものではない。又、表中の化合物番号は以後の記載において参照される。

[0058] 尚、本発明化合物には、置換基の種類によってはE-体及びZ-体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明はこれらE-体、Z-体又はE-体及びZ-体を任意の割合で含む混合物を包含する。又、本発明化合物は、1個又は2個以上の不斉炭素原子及び不斉硫黄原子の存在に起因する光学異性体が存在する場合があるが、本発明は全ての光学活性体、ラセミ体又はジアステレオマーを包含する。

[0059] 本明細書における表中の次の表記は、下記の通りそれぞれ該当する基を表す。

M e : メチル基

E t : エチル基

P r - n : n-プロピル基

P r - i	: イソプロピル基
P r - c	: シクロプロピル基
B u - n	: n-ブチル基
B u - s	: s e c - ブチル基
B u - i	: イソブチル基
B u - t	: t e r t - ブチル基
P e n - n	: n-ペンチル基
P e n - c	: シクロペンチル基
P e n - i	: イソペンチル基
P e n - n e o	: ネオペンチル基
P e n - 2	: 2-ペンチル基
P e n - 3	: 3-ペンチル基
H e x - n	: n-ヘキシル基
H e x - c	: シクロヘキシル基

[0060] 又、例えば以下の表記はそれぞれ該当する意味を表す。

5 - C F ₃	: 5位にトリフルオロメチル基が置換
3 - C I - 5 - C F ₃	: 3位に塩素原子、5位にトリフルオロメチル基が置換
2, 6 - (C I) ₂	: 2位及び6位に塩素原子が置換

[0061]

[表1]

化合物番号	X ¹	X ²	W	
I-1	Me	H	N	
I-2	Et	H	N	
I-3	Pr-n	H	N	
I-4	Pri	H	N	
I-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	H	N	
I-6	Bu-n	H	N	
I-7	Bu-i	H	N	
I-8	Bu-s	H	N	
I-9	But	H	N	
I-10	Pen-n	H	N	
I-11	Pen-i	H	N	
I-12	Pen-neo	H	N	
I-13	Pen-2	H	N	
I-14	Pen-3	H	N	
I-15	CH(Me)CH(Me) ₂	H	N	
I-16	Hex-n	H	N	
I-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	H	N	
I-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	N	
I-19	CH ₂ CH=CH ₂	H	N	
I-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	H	N	
I-21	CH ₂ CH=CMe ₂	H	N	
I-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	H	N	
I-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	H	N	
I-24	CH ₂ C≡CH	H	N	
I-25	CH ₂ C≡CMe	H	N	
I-26	Pr-c	H	N	
I-27	Bu-c	H	N	
I-28	Pen-c	H	N	
I-29	Hex-c	H	N	
I-30	CH ₂ Pr-c	H	N	
I-31	CH ₂ Bu-c	H	N	
I-32	CH ₂ Pen-c	H	N	
I-33	CH ₂ Hex-c	H	N	
I-34	CH ₂ CF ₃	H	N	
I-35	CH ₂ CH=CCl ₂	H	N	
I-36	CH ₂ CCl=CHCl	H	N	
I-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	H	N	
I-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N	
I-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N	

[0062]

[表2]

化合物番号	X ¹	X ²	W
I-40	CH ₂ CH=CF ₂	H	N
I-41	CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
I-42	CH ₂ CH ₂ OEt	H	N
I-43	CH ₂ CH(Me)OMe	H	N
I-44	CH ₂ CH(Me)OPri	H	N
I-45	CH ₂ CH ₂ OPr-i	H	N
I-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	H	N
I-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
I-48	CH ₂ CH ₂ OPr-i	H	N
I-49	CH ₂ CH ₂ OPr-c	H	N
I-50	CH ₂ CH ₂ OBu-c	H	N
I-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	H	N
I-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	H	N
I-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	H	N
I-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	N
I-55	CH ₂ SMe	H	N
I-56	CH ₂ SPr-n	H	N
I-57	CH ₂ CH ₃ SMe	H	N
I-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	H	N
I-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	H	N
I-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	H	N
I-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	H	N
I-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	N
I-63	CH ₂ CH(Me)SMe	H	N
I-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	H	N
I-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	H	N
I-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	H	N
I-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	H	N
I-68	Ph	H	N
I-69	Ph(2-Cl)	H	N
I-70	Ph(3-Cl)	H	N
I-71	Ph(4-Cl)	H	N
I-72	Ph(2-F)	H	N
I-73	Ph(3-F)	H	N
I-74	Ph(4-F)	H	N
I-75	Ph(2-Me)	H	N
I-76	Ph(3-Me)	H	N
I-77	Ph(4-Me)	H	N
I-78	Ph(2-OMe)	H	N
I-79	Ph(3-OMe)	H	N

[0063]

[表3]

化合物番号	X ¹	X ²	W
I-80	Ph(4-OMe)	H	N
I-81	Ph(2-OCF ₃)	H	N
I-82	Ph(3-OCF ₃)	H	N
I-83	Ph(4-OCHF ₂)	H	N
I-84	Ph(2-OCHF ₂)	H	N
I-85	Ph(3-OCHF ₂)	H	N
I-86	Ph(4-OCHF ₂)	H	N
I-87	Ph(2-CF ₃)	H	N
I-88	Ph(3-CF ₃)	H	N
I-89	Ph(4-CF ₃)	H	N
I-90	Ph(2-NO ₂)	H	N
I-91	Ph(3-NO ₂)	H	N
I-92	Ph(4-NO ₂)	H	N
I-93	Ph(2-CN)	H	N
I-94	Ph(3-CN)	H	N
I-95	Ph(4-CN)	H	N
I-96	Ph(3-Bu-t)	H	N
I-97	Ph(3,5-di-Me)	H	N
I-98	Ph(3,5-di-F)	H	N
I-99		H	N
I-100	CH ₂ Ph	H	N
I-101	CH ₂ CH ₂ Ph	H	N
I-102	CH ₂ CH=CHPh	H	N
I-103	CH ₂ C≡CPh	H	N
I-104	CH ₂ CH=NOMe	H	N
I-105	CH ₂ C(Me)=NOMe	H	N
I-106	CH ₂ C(Me)=NOEt	H	N
I-107	CH ₂ CH=NOPr-n	H	N
I-108	CH ₂ CH=NOPr-i	H	N
I-109	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	H	N
I-110	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	H	N
I-111		H	N
I-112		H	N

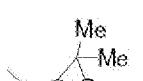
[0064]

[表4]

化合物番号	X ¹	X ²	W
I-113		H	N
I-114		H	N
I-115		H	N
I-116		H	N
I-117		H	N
I-118		H	N
I-119		H	N
I-120		H	N
I-121		H	N
I-122		H	N
I-123		H	N
I-124		H	N
I-125		H	N
I-126		H	N
I-127		H	N

[0065]

[表5]

化合物番号	X ¹	X ²	W
I-128		H	N
I-129		H	N
I-130		H	N
I-131		H	N
I-132		H	N
I-133		H	N
I-134		H	N
I-135		H	N
I-136		H	N
I-137		H	N
I-138		H	N
I-139		H	N
I-140		H	N

[0066]

[表6]

化合物番号	X ¹	X ²	W
I-141		H	N
I-142		H	N
I-143		H	N
I-144		H	N
I-145	Me	Me	N
I-146	Et	Me	N
I-147	Pr-n	Me	N
I-148	Pri	Me	N
I-149	Bu-n	Me	N
I-150	Bu-i	Me	N
I-151	Bu-s	Me	N
I-152	Bu-t	Me	N
I-153	Pen-n	Me	N
I-154	Pen-i	Me	N
I-155	Pen-neo	Me	N
I-156	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
I-157	Ph	Me	N
I-158	Ph(2-F)	Me	N
I-159	Ph(3-F)	Me	N
I-160	Ph(4-F)	Me	N
I-161	Ph(2-Me)	Me	N
I-162	Ph(3-Me)	Me	N
I-163	Ph(4-Me)	Me	N
I-164	Me	CN	N
I-165	Et	CN	N
I-166	Pr-n	CN	N
I-167	Pri	CN	N
I-168	Bu-n	CN	N

[0067]

[表7]

化合物番号	X ¹	X ²	W
I-169	Bu-i	CN	N
I-170	Bu-s	CN	N
I-171	Bu-t	CN	N
I-172	Pen-n	CN	N
I-173	Pen-i	CN	N
I-174	Pen-neo	CN	N
I-175	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	N
I-176	Ph	CN	N
I-177	Ph(2-F)	CN	N
I-178	Ph(3-F)	CN	N
I-179	Ph(4-F)	CN	N
I-180	Ph(2-Me)	CN	N
I-181	Ph(3-Me)	CN	N
I-182	Ph(4-Me)	CN	N
I-183	Me	H	CH
I-184	Et	H	CH
I-185	Pr-n	H	CH
I-186	Pri	H	CH
I-187	Bu-n	H	CH
I-188	Bu-i	H	CH
I-189	Bu-s	H	CH
I-190	Bu-t	H	CH
I-191	Pen-n	H	CH
I-192	Pen-i	H	CH
I-193	Pen-neo	H	CH
I-194	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	CH
I-195	Ph	H	CH
I-196	Ph(2-F)	H	CH
I-197	Ph(3-F)	H	CH
I-198	Ph(4-F)	H	CH
I-199	Ph(2-Me)	H	CH
I-200	Ph(3-Me)	H	CH
I-201	Ph(4-Me)	H	CH
I-202	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	N
I-203		H	N
I-204		H	N

[0068]

[表8]

化合物番号	X ¹	X ²	W	
			N	W
II-1	Me		H	N
II-2	Et		H	N
II-3	Pr-n		H	N
II-4	Pr-i		H	N
II-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me		H	N
II-6	Bu-n		H	N
II-7	Bu-i		H	N
II-8	Bu-s		H	N
II-9	But		H	N
II-10	Pen-n		H	N
II-11	Pen-i		H	N
II-12	Pen-neo		H	N
II-13	Pen-2		H	N
II-14	Pen-3		H	N
II-15	CH(Me)CH(Me) ₂		H	N
II-16	Hex-n		H	N
II-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂		H	N
II-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃		H	N
II-19	CH ₂ CH=CH ₂		H	N
II-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂		H	N
II-21	CH ₂ CH=CMe ₂		H	N
II-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂		H	N
II-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂		H	N
II-24	CH ₂ C≡CH		H	N
II-25	CH ₂ C≡CMe		H	N
II-26	Pr-c		H	N
II-27	Bu-c		H	N
II-28	Pen-c		H	N
II-29	Hex-c		H	N
II-30	CH ₂ Pr-c		H	N
II-31	CH ₂ Bu-c		H	N
II-32	CH ₂ Pen-c		H	N
II-33	CH ₂ Hex-c		H	N
II-34	CH ₂ CF ₃		H	N

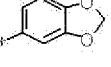
[0069]

[表9]

化合物番号	X ¹	X ²	W
II-35	CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
II-36	CH ₂ CCl=CHCl	H	N
II-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
II-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
II-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
II-40	CH ₂ CH=CF ₂	H	N
II-41	CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
II-42	CH ₂ CH ₂ OEt	H	N
II-43	CH ₂ CH(Me)OMe	H	N
II-44	CH ₂ CH(Me)OPri	H	N
II-45	CH ₂ CH ₂ OPri	H	N
II-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	H	N
II-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
II-48	CH ₂ CH ₂ OPri	H	N
II-49	CH ₂ CH ₂ OPr-c	H	N
II-50	CH ₂ CH ₂ OBu-c	H	N
II-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	H	N
II-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	H	N
II-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	H	N
II-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	N
II-55	CH ₂ SMe	H	N
II-56	CH ₂ SPr-n	H	N
II-57	CH ₂ CH ₂ SMe	H	N
II-58	CH ₂ CH ₂ SOMe	H	N
II-59	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	N
II-60	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	H	N
II-61	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SOMe	H	N
II-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	N
II-63	CH ₂ CH(Me)SMe	H	N
II-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	H	N
II-65	CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	H	N
II-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	H	N
II-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	H	N
II-68	Ph	H	N
II-69	Ph(2-Cl)	H	N
II-70	Ph(3-Cl)	H	N
II-71	Ph(4-Cl)	H	N
II-72	Ph(2-F)	H	N
II-73	Ph(3-F)	H	N

[0070]

[表10]

化合物番号	X ¹	X ²	W
II-74	Ph(4-F)	H	N
II-75	Ph(2-Me)	H	N
II-76	Ph(3-Me)	H	N
II-77	Ph(4-Me)	H	N
II-78	Ph(2-OMe)	H	N
II-79	Ph(3-OMe)	H	N
II-80	Ph(4-OMe)	H	N
II-81	Ph(2-OCH ₃)	H	N
II-82	Ph(3-OCH ₃)	H	N
II-83	Ph(4-OCH ₃)	H	N
II-84	Ph(2-OCHF ₂)	H	N
II-85	Ph(3-OCHF ₂)	H	N
II-86	Ph(4-OCHF ₂)	H	N
II-87	Ph(2-CF ₃)	H	N
II-88	Ph(3-CF ₃)	H	N
II-89	Ph(4-CF ₃)	H	N
II-90	Ph(2-NO ₂)	H	N
II-91	Ph(3-NO ₂)	H	N
II-92	Ph(4-NO ₂)	H	N
II-93	Ph(2-CN)	H	N
II-94	Ph(3-CN)	H	N
II-95	Ph(4-CN)	H	N
II-96	Ph(3-Bu-t)	H	N
II-97	Ph(3,5-di-Me)	H	N
II-98	Ph(3,5-di-F)	H	N
II-99		H	N
II-100	CH ₂ Ph	H	N
II-101	CH ₂ CH ₂ Ph	H	N
II-102	CH ₂ CH=CHPh	H	N
II-103	CH ₂ C≡CPh	H	N
II-104	CH ₂ CH=NOMe	H	N
II-105	CH ₂ C(Me)=NOMe	H	N
II-106	CH ₂ C(Me)=NOEt	H	N
II-107	CH ₂ CH=NOPr-n	H	N
II-108	CH ₂ CH=NOPr-i	H	N
II-109	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	H	N
II-110	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	H	N

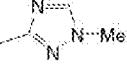
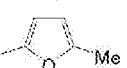
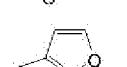
[0071]

[表11]

化合物番号	X ¹	X ²	W
II-111		H	N
II-112		H	N
II-113		H	N
II-114		H	N
II-115		H	N
II-116		H	N
II-117		H	N
II-118		H	N
II-119		H	N
II-120		H	N
II-121		H	N
II-122		H	N
II-123		H	N
II-124		H	N
II-125		H	N

[0072]

[表12]

化合物番号	X ¹	X ²	W
II-126		H	N
II-127		H	N
II-128		H	N
II-129		H	N
II-130		H	N
II-131		H	N
II-132		H	N
II-133		H	N
II-134		H	N
II-135		H	N
II-136		H	N
II-137		H	N
II-138		H	N
II-139		H	N
II-140		H	N

[0073]

[表13]

化合物番号	X ¹	X ²	W
II-141		H	N
II-142		H	N
II-143		H	N
II-144		H	N
II-145	Me	Me	N
II-146	Et	Me	N
II-147	Pr-n	Me	N
II-148	Pr-i	Me	N
II-149	Bu-n	Me	N
II-150	Bu-i	Me	N
II-151	Bu-s	Me	N
II-152	But	Me	N
II-153	Pen-n	Me	N
II-154	Pen-i	Me	N
II-155	Pen-neo	Me	N
II-156	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
II-157	Ph	Me	N
II-158	Ph(2-F)	Me	N
II-159	Ph(3-F)	Me	N
II-160	Ph(4-F)	Me	N
II-161	Ph(2-Me)	Me	N
II-162	Ph(3-Me)	Me	N
II-163	Ph(4-Me)	Me	N
II-164	Me	CN	N
II-165	Et	CN	N
II-166	Pr-n	CN	N
II-167	Pr-i	CN	N
II-168	Bu-n	CN	N
II-169	Bu-i	CN	N
II-170	Bu-s	CN	N
II-171	But	CN	N
II-172	Pen-n	CN	N
II-173	Pen-i	CN	N
II-174	Pen-neo	CN	N

[0074]

[表14]

化合物番号	X ¹	X ²	W
II-175	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	N
II-176	Ph	CN	N
II-177	Ph(2-F)	CN	N
II-178	Ph(3-F)	CN	N
II-179	Ph(4-F)	CN	N
II-180	Ph(2-Me)	CN	N
II-181	Ph(3-Me)	CN	N
II-182	Ph(4-Me)	CN	N
II-183	Me	H	CH
II-184	Et	H	CH
II-185	Pr-n	H	CH
II-186	Pr-i	H	CH
II-187	Bu-n	H	CH
II-188	Bu-i	H	CH
II-189	Bu-s	H	CH
II-190	Bu-t	H	CH
II-191	Pen-n	H	CH
II-192	Pen-i	H	CH
II-193	Pen-neo	H	CH
II-194	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	CH
II-195	Ph	H	CH
II-196	Ph(2-F)	H	CH
II-197	Ph(3-F)	H	CH
II-198	Ph(4-F)	H	CH
II-199	Ph(2-Me)	H	CH
II-200	Ph(3-Me)	H	CH
II-201	Ph(4-Me)	H	CH
II-202	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	N
II-203	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	CH
II-204		H	N

[0075]

[表15]

化合物番号	X ¹	X ²	W		
				Y ¹	Y ²
III-1	Me		N	H	
III-2	Et		N	H	
III-3	Pr-n		N	H	
III-4	Pr-i		N	H	
III-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me		N	H	
III-6	Bu-n		N	H	
III-7	Bu-i		N	H	
III-8	Bu-s		N	H	
III-9	But		N	H	
III-10	Pen-n		N	H	
III-11	Pen-i		N	H	
III-12	Pen-neo		N	H	
III-13	Pen-2		N	H	
III-14	Pen-3		N	H	
III-15	CH(Me)CH(Me) ₂		N	H	
III-16	Hex-n		N	H	
III-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂		N	H	
III-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃		N	H	
III-19	CH ₂ CH=CH ₂		N	H	
III-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂		N	H	
III-21	CH ₂ CH=CMe ₂		N	H	
III-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂		N	H	
III-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂		N	H	
III-24	CH ₂ C≡CH		N	H	
III-25	CH ₂ C≡CMe		N	H	
III-26	Pr-c		N	H	
III-27	Bu-c		N	H	
III-28	Pen-c		N	H	
III-29	Hex-c		N	H	
III-30	CH ₂ Pr-c		N	H	
III-31	CH ₂ Bu-c		N	H	
III-32	CH ₂ Pen-c		N	H	
III-33	CH ₂ Hex-c		N	H	
III-34	CH ₂ CF ₃		N	H	

[0076]

[表16]

化合物番号	X ¹	X ²	W
III-35	CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
III-36	CH ₂ CCl=CHCl	H	N
III-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
III-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
III-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
III-40	CH ₂ CH=CF ₂	H	N
III-41	CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
III-42	CH ₂ CH ₂ OEt	H	N
III-43	CH ₂ CH(Me)OMe	H	N
III-44	CH ₂ CH(Me)OPri	H	N
III-45	CH ₂ CH ₂ OPri	H	N
III-46	CH ₂ CH ₂ OBu <i>i</i>	H	N
III-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
III-48	CH ₂ CH ₂ OPr <i>i</i>	H	N
III-49	CH ₂ CH ₂ OPr <i>c</i>	H	N
III-50	CH ₂ CH ₂ OBu <i>c</i>	H	N
III-51	CH ₂ CH ₂ OPen <i>c</i>	H	N
III-52	CH ₂ CH ₂ OHex <i>c</i>	H	N
III-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	H	N
III-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	N
III-55	CH ₂ SMe	H	N
III-56	CH ₂ SPr <i>n</i>	H	N
III-57	CH ₂ CH ₃ SMe	H	N
III-58	CH ₂ CH ₃ SOME	H	N
III-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	H	N
III-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	H	N
III-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOME	H	N
III-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	N
III-63	CH ₂ CH(Me)SMe	H	N
III-64	CH ₂ CH(Me)SOME	H	N
III-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	H	N
III-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	H	N
III-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	H	N
III-68	Ph	H	N
III-69	Ph(2-Cl)	H	N
III-70	Ph(3-Cl)	H	N
III-71	Ph(4-Cl)	H	N
III-72	Ph(2-F)	H	N
III-73	Ph(3-F)	H	N
III-74	Ph(4-F)	H	N

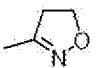
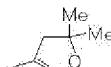
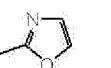
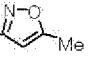
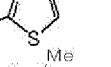
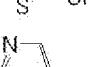
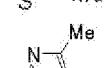
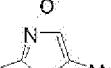
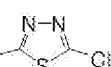
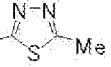
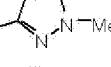
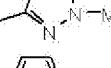
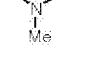
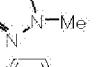
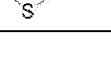
[0077]

[表17]

化合物番号	X ¹	X ²	W
III-75	Ph(2-Me)	H	N
III-76	Ph(3-Me)	H	N
III-77	Ph(4-Me)	H	N
III-78	Ph(2-OMe)	H	N
III-79	Ph(3-OMe)	H	N
III-80	Ph(4-OMe)	H	N
III-81	Ph(2-OCF ₃)	H	N
III-82	Ph(3-OCF ₃)	H	N
III-83	Ph(4-OCF ₃)	H	N
III-84	Ph(2-OCHF ₂)	H	N
III-85	Ph(3-OCHF ₂)	H	N
III-86	Ph(4-OCHF ₂)	H	N
III-87	Ph(2-CF ₃)	H	N
III-88	Ph(3-CF ₃)	H	N
III-89	Ph(4-CF ₃)	H	N
III-90	Ph(2-NO ₂)	H	N
III-91	Ph(3-NO ₂)	H	N
III-92	Ph(4-NO ₂)	H	N
III-93	Ph(2-CN)	H	N
III-94	Ph(3-CN)	H	N
III-95	Ph(4-CN)	H	N
III-96	Ph(3-Bu-t)	H	N
III-97	Ph(3,5-di-Me)	H	N
III-98	Ph(3,5-di-F)	H	N
III-99		H	N
III-100	CH ₂ Ph	H	N
III-101	CH ₂ CH ₂ Ph	H	N
III-102	CH ₂ CH=CHPh	H	N
III-103	CH ₂ C≡CPh	H	N
III-104	CH ₂ CH=NOMe	H	N
III-105	CH ₂ C(Me)=NOMe		N
III-106	CH ₂ C(Me)=NOEt	H	N
III-107	CH ₂ CH=NOPr-n	H	N
III-108	CH ₂ CH=NOPr-i	H	N
III-109	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	H	N
III-110	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	H	N

[0078]

[表18]

化合物番号	X ¹	X ²	W
III-111		H	N
III-112		H	N
III-113		H	N
III-114		H	N
III-115		H	N
III-116		H	N
III-117		H	N
III-118		H	N
III-119		H	N
III-120		H	N
III-121		H	N
III-122		H	N
III-123		H	N
III-124		H	N
III-125		H	N
III-126		H	N
III-127		H	N

[0079]

[表19]

化合物番号	X ¹	X ²	W
III-128		H	N
III-129		H	N
III-130		H	N
III-131		H	N
III-132		H	N
III-133		H	N
III-134		H	N
III-135		H	N
III-136		H	N
III-137		H	N
III-138		H	N
III-139		H	N
III-140		H	N
III-141		H	N
III-142		H	N
III-143		H	N
III-144		H	N

[0080]

[表20]

化合物番号	X ¹	X ²	W
III-145	Me	Me	N
III-146	Et	Me	N
III-147	Pr-n	Me	N
III-148	Pri	Me	N
III-149	Bu-n	Me	N
III-150	Bu-i	Me	N
III-151	Bu-s	Me	N
III-152	But	Me	N
III-153	Pen-n	Me	N
III-154	Pen-i	Me	N
III-155	Pen-neo	Me	N
III-156	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
III-157	Ph	Me	N
III-158	Ph(2-F)	Me	N
III-159	Ph(3-F)	Me	N
III-160	Ph(4-F)	Me	N
III-161	Ph(2-Me)	Me	N
III-162	Ph(3-Me)	Me	N
III-163	Ph(4-Me)	Me	N
III-164	Me	CN	N
III-165	Et	CN	N
III-166	Pr-n	CN	N
III-167	Pri	CN	N
III-168	Bu-n	CN	N
III-169	Bu-i	CN	N
III-170	Bu-s	CN	N
III-171	But	CN	N
III-172	Pen-n	CN	N
III-173	Pen-i	CN	N
III-174	Pen-neo	CN	N
III-175	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	N
III-176	Ph	CN	N
III-177	Ph(2-F)	CN	N
III-178	Ph(3-F)	CN	N
III-179	Ph(4-F)	CN	N
III-180	Ph(2-Me)	CN	N
III-181	Ph(3-Me)	CN	N
III-182	Ph(4-Me)	CN	N
III-183	Me	H	CH
III-184	Et	H	CH

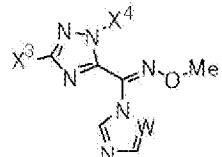
[0081]

[表21]

化合物番号	X ¹	X ²	W
III-185	Pr-n	H	CH
III-186	Pri	H	CH
III-187	Bu-n	H	CH
III-188	Bui	H	CH
III-189	Bu-s	H	CH
III-190	But	H	CH
III-191	Pen-n	H	CH
III-192	Pen-i	H	CH
III-193	Pen-neo	H	CH
III-194	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	CH
III-195	CH ₂ Fr-c	H	N
III-196	Ph	H	CH
III-197	Ph(2-F)	H	CH
III-198	Ph(3-F)	H	CH
III-199	Ph(4-F)	H	CH
III-200	Ph(2-Me)	H	CH
III-201	Ph(3-Me)	H	CH
III-202	Ph(4-Me)	H	CH
III-203	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	N
III-204	CH ₂ CH ₂ OBut	H	N
III-205	CH ₂ CH ₃ SPri-i	H	N
III-206	CH ₂ CH ₃ SOPri-i	H	N
III-207	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Pri	H	N
III-208	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	N

[0082]

[表22]



化合物番号	X ³	X ⁴	W
IV-1	Me	Me	N
IV-2	Et	Me	N
IV-3	Pr-n	Me	N
IV-4	Pr-i	Me	N
IV-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	Me	N
IV-6	Bu-n	Me	N
IV-7	Bu-i	Me	N
IV-8	Bu-s	Me	N
IV-9	Bu-t	Me	N
IV-10	Pen-n	Me	N
IV-11	Pen-i	Me	N
IV-12	Pen-neo	Me	N
IV-13	Pen-2	Me	N
IV-14	Pen-3	Me	N
IV-15	CH(Me)CH(Me) ₂	Me	N
IV-16	Hex-n	Me	N
IV-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	N
IV-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
IV-19	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
IV-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	N
IV-21	CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
IV-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	Me	N
IV-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
IV-24	CH ₂ C≡CH	Me	N
IV-25	CH ₂ C≡CMe	Me	N
IV-26	Pr-c	Me	N
IV-27	Bu-c	Me	N
IV-28	Pen-c	Me	N
IV-29	Hex-c	Me	N
IV-30	CH ₂ Pr-c	Me	N
IV-31	CH ₂ Bu-c	Me	N
IV-32	CH ₂ Pen-c	Me	N
IV-33	CH ₂ Hex-c	Me	N
IV-34	CH ₂ CF ₃	Me	N

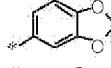
[0083]

[表23]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
IV-35	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
IV-36	CH ₂ CCl=CHCl	Me	N
IV-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
IV-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
IV-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
IV-40	CH ₂ CH=CF ₂	Me	N
IV-41	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
IV-42	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	N
IV-43	CH ₂ CH(Me)OMe	Me	N
IV-44	CH ₂ CH(Me)OPr-i	Me	N
IV-45	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	N
IV-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	Me	N
IV-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
IV-48	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	N
IV-49	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	N
IV-50	CH ₂ CH ₂ OBu-c	Me	N
IV-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	N
IV-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	N
IV-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
IV-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	N
IV-55	CH ₂ SMe	Me	N
IV-56	CH ₂ SPr-n	Me	N
IV-57	CH ₂ CH ₃ SMe	Me	N
IV-58	CH ₂ CH ₃ SOME	Me	N
IV-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	Me	N
IV-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	Me	N
IV-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOME	Me	N
IV-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	N
IV-63	CH ₂ CH(Me)SMe	Me	N
IV-64	CH ₂ CH(Me)SOME	Me	N
IV-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	Me	N
IV-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	Me	N
IV-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	Me	N
IV-68	Ph	Me	N
IV-69	Ph(2-Cl)	Me	N
IV-70	Ph(3-Cl)	Me	N
IV-71	Ph(4-Cl)	Me	N
IV-72	Ph(2-F)	Me	N
IV-73	Ph(3-F)	Me	N
IV-74	Ph(4-F)	Me	N

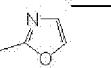
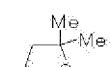
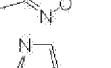
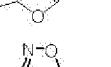
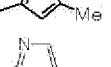
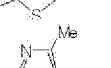
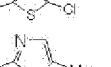
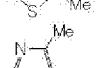
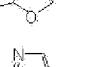
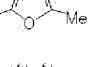
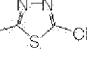
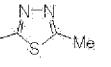
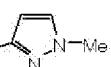
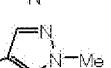
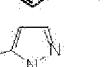
[0084]

[表24]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
IV-75	Ph(2-Me)	Me	N
IV-76	Ph(3-Me)	Me	N
IV-77	Ph(4-Me)	Me	N
IV-78	Ph(2-OMe)	Me	N
IV-79	Ph(3-OMe)	Me	N
IV-80	Ph(4-OMe)	Me	N
IV-81	Ph(2-OCF ₃)	Me	N
IV-82	Ph(3-OCF ₃)	Me	N
IV-83	Ph(4-OCF ₃)	Me	N
IV-84	Ph(2-OCHF ₂)	Me	N
IV-85	Ph(3-OCHF ₂)	Me	N
IV-86	Ph(4-OCHF ₂)	Me	N
IV-87	Ph(2-CF ₃)	Me	N
IV-88	Ph(3-CF ₃)	Me	N
IV-89	Ph(4-CF ₃)	Me	N
IV-90	Ph(2-NO ₂)	Me	N
IV-91	Ph(3-NO ₂)	Me	N
IV-92	Ph(4-NO ₂)	Me	N
IV-93	Ph(2-CN)	Me	N
IV-94	Ph(3-CN)	Me	N
IV-95	Ph(4-CN)	Me	N
IV-96	Ph(3-Bu-t)	Me	N
IV-97	Ph(3,5-di-Me)	Me	N
IV-98	Ph(3,5-di-F)	Me	N
IV-99	Ph(2-Cl-6-F)	Me	N
IV-100		Me	N
IV-101	CH ₂ Ph	Me	N
IV-102	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	N
IV-103	CH ₂ CH=CHPh	Me	N
IV-104	CH ₂ C≡CPh	Me	N
IV-105	CH ₂ CH=NOMe	Me	N
IV-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	N
IV-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	N
IV-108	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	N
IV-109	CH ₂ CH=NOPr-i	Me	N
IV-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	Me	N
IV-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	Me	N

[0085]

[表25]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
IV-112		Me	N
IV-113		Me	N
IV-114		Me	N
IV-115		Me	N
IV-116		Me	N
IV-117		Me	N
IV-118		Me	N
IV-119		Me	N
IV-120		Me	N
IV-121		Me	N
IV-122		Me	N
IV-123		Me	N
IV-124		Me	N
IV-125		Me	N
IV-126		Me	N
IV-127		Me	N

[0086]

[表26]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
IV-128		Me	N
IV-129		Me	N
IV-130		Me	N
IV-131		Me	N
IV-132		Me	N
IV-133		Me	N
IV-134		Me	N
IV-135		Me	N
IV-136		Me	N
IV-137		Me	N
IV-138		Me	N
IV-139		Me	N
IV-140		Me	N
IV-141		Me	N
IV-142		Me	N
IV-143		Me	N
IV-144		Me	N
IV-145		Me	N

[0087]

[表27]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
IV-146	Me	Et	N
IV-147	Et	Et	N
IV-148	Pr-n	Et	N
IV-149	Pr-i	Et	N
IV-150	Bu-n	Et	N
IV-151	Bu-i	Et	N
IV-152	Bu-s	Et	N
IV-153	But	Et	N
IV-154	Pen-n	Et	N
IV-155	Pen-i	Et	N
IV-156	Pen-neo	Et	N
IV-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	N
IV-158	Ph	Et	N
IV-159	Ph(2-F)	Et	N
IV-160	Ph(3-F)	Et	N
IV-161	Ph(4-F)	Et	N
IV-162	Ph(2-Me)	Et	N
IV-163	Ph(3-Me)	Et	N
IV-164	Ph(4-Me)	Et	N
IV-165	Me	H	N
IV-166	Et	H	N
IV-167	Pr-n	H	N
IV-168	Pr-i	H	N
IV-169	Bu-n	H	N
IV-170	Bu-i	H	N
IV-171	Bu-s	H	N
IV-172	But	H	N
IV-173	Pen-n	H	N
IV-174	Pen-i	H	N
IV-175	Pen-neo	H	N
IV-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	N
IV-177	Ph	H	N
IV-178	Ph(2-F)	H	N
IV-179	Ph(3-F)	H	N
IV-180	Ph(4-F)	H	N
IV-181	Ph(2-Me)	H	N
IV-182	Ph(3-Me)	H	N
IV-183	Ph(4-Me)	H	N

[0088]

[表28]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
IV-184	Me	Me	CH
IV-185	Et	Me	CH
IV-186	Pr-n	Me	CH
IV-187	Pr-i	Me	CH
IV-188	Bu-n	Me	CH
IV-189	Bu-i	Me	CH
IV-190	Bu-s	Me	CH
IV-191	But	Me	CH
IV-192	Pen-n	Me	CH
IV-193	Pen-i	Me	CH
IV-194	Pen-neo	Me	CH
IV-195	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
IV-196	Ph	Me	CH
IV-197	Ph(2-F)	Me	CH
IV-198	Ph(3-F)	Me	CH
IV-199	Ph(4-F)	Me	CH
IV-200	Ph(2-Me)	Me	CH
IV-201	Ph(3-Me)	Me	CH
IV-202	Ph(4-Me)	Me	CH
IV-203	Ph(4-F)	CH ₂ CN	N
IV-204	Ph(4-F)	Et	N
IV-205	Ph(4-F)	CH ₂ C≡CH	N
IV-206	CH ₂ Ph	H	N
IV-207	CH ₂ CH ₂ Ph	H	N
IV-208	CH ₂ Pr-c	H	N
IV-209		Me	N
IV-210		Me	N
IV-211		Me	N
IV-212		Me	N
IV-213		H	N

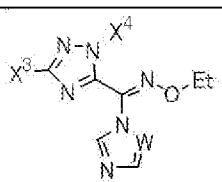
[0089]

[表29]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
IV-214		H	N
IV-215		Me	N
IV-216		Me	N
IV-217		H	N
IV-218		H	N
IV-219		H	N
IV-220		H	N
IV-221		Me	N
IV-222		Me	N
IV-223		Me	N
IV-224		Me	N
IV-225		Me	N
IV-226		Me	N
IV-227		Me	N
IV-228		Me	N
IV-229		Me	N
IV-230		Me	N
IV-231		Me	N
IV-232		Me	N

[0090]

[表30]



 X³-N=N-C(=O)-N(OEt)-C(=O)-N=N-X⁴
 W-W

化合物番号	X ³	X ⁴	W
V-1	Me	Me	N
V-2	Et	Me	N
V-3	Pr-n	Me	N
V-4	Pr-i	Me	N
V-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	Me	N
V-6	Bu-n	Me	N
V-7	Bu-i	Me	N
V-8	Bu-s	Me	N
V-9	But	Me	N
V-10	Pen-n	Me	N
V-11	Pen-i	Me	N
V-12	Pen-neo	Me	N
V-13	Pen-2	Me	N
V-14	Pen-3	Me	N
V-15	CH(Me)CH(Me) ₂	Me	N
V-16	Hex-n	Me	N
V-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	N
V-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
V-19	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
V-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	N
V-21	CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
V-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	Me	N
V-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
V-24	CH ₂ C≡CH	Me	N
V-25	CH ₂ C≡CMe	Me	N
V-26	Pr-c	Me	N
V-27	Bu-c	Me	N
V-28	Pen-c	Me	N
V-29	Hex-c	Me	N
V-30	CH ₂ Pr-c	Me	N
V-31	CH ₂ Bu-c	Me	N
V-32	CH ₂ Pen-c	Me	N
V-33	CH ₂ Hex-c	Me	N
V-34	CH ₂ CF ₃	Me	N

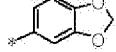
[0091]

[表31]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
V-35	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
V-36	CH ₂ CCl=CHCl	Me	N
V-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
V-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
V-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
V-40	CH ₂ CH=CF ₂	Me	N
V-41	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
V-42	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	N
V-43	CH ₂ CH(Me)OMe	Me	N
V-44	CH ₂ CH(Me)OPri	Me	N
V-45	CH ₂ CH ₂ OPri	Me	N
V-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	Me	N
V-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
V-48	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	N
V-49	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	N
V-50	CH ₂ CH ₂ OBu-c	Me	N
V-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	N
V-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	N
V-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
V-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	N
V-55	CH ₂ SMe	Me	N
V-56	CH ₂ SPr-n	Me	N
V-57	CH ₂ CH ₃ SMe	Me	N
V-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	Me	N
V-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	Me	N
V-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	Me	N
V-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	Me	N
V-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	N
V-63	CH ₂ CH(Me)SMe	Me	N
V-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	Me	N
V-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	Me	N
V-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	Me	N
V-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	Me	N
V-68	Ph	Me	N
V-69	Ph(2-Cl)	Me	N
V-70	Ph(3-Cl)	Me	N
V-71	Ph(4-Cl)	Me	N
V-72	Ph(2-F)	Me	N
V-73	Ph(3-F)	Me	N
V-74	Ph(4-F)	Me	N

[0092]

[表32]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
V-75	Ph(2-Me)	Me	N
V-76	Ph(3-Me)	Me	N
V-77	Ph(4-Me)	Me	N
V-78	Ph(2-OMe)	Me	N
V-79	Ph(3-OMe)	Me	N
V-80	Ph(4-OMe)	Me	N
V-81	Ph(2-OCF ₃)	Me	N
V-82	Ph(3-OCF ₃)	Me	N
V-83	Ph(4-OCF ₃)	Me	N
V-84	Ph(2-OCHF ₂)	Me	N
V-85	Ph(3-OCHF ₂)	Me	N
V-86	Ph(4-OCHF ₂)	Me	N
V-87	Ph(2-CF ₃)	Me	N
V-88	Ph(3-CF ₃)	Me	N
V-89	Ph(4-CF ₃)	Me	N
V-90	Ph(2-NO ₂)	Me	N
V-91	Ph(3-NO ₂)	Me	N
V-92	Ph(4-NO ₂)	Me	N
V-93	Ph(2-CN)	Me	N
V-94	Ph(3-CN)	Me	N
V-95	Ph(4-CN)	Me	N
V-96	Ph(3-Bu-t)	Me	N
V-97	Ph(3,5-di-Me)	Me	N
V-98	Ph(3,5-di-F)	Me	N
V-99	Ph(2-Cl-6-F)	Me	N
V-100		Me	N
V-101	CH ₂ Ph	Me	N
V-102	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	N
V-103	CH ₂ CH=CHPh	Me	N
V-104	CH ₂ C≡CPh	Me	N
V-105	CH ₂ CH=NOMe	Me	N
V-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	N
V-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	N
V-108	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	N
V-109	CH ₂ CH=NOPr-i	Me	N
V-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	Me	N
V-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	Me	N

[0093]

[表33]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
V-112		Me	N
V-113		Me	N
V-114		Me	N
V-115		Me	N
V-116		Me	N
V-117		Me	N
V-118		Me	N
V-119		Me	N
V-120		Me	N
V-121		Me	N
V-122		Me	N
V-123		Me	N
V-124		Me	N
V-125		Me	N
V-126		Me	N
V-127		Me	N

[0094]

[表34]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
V-128		Me	N
V-129		Me	N
V-130		Me	N
V-131		Me	N
V-132		Me	N
V-133		Me	N
V-134		Me	N
V-135		Me	N
V-136		Me	N
V-137		Me	N
V-138		Me	N
V-139		Me	N
V-140		Me	N
V-141		Me	N
V-142		Me	N
V-143		Me	N
V-144		Me	N
V-145		Me	N

[0095]

[表35]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
V-146	Me	Et	N
V-147	Et	Et	N
V-148	Pr-n	Et	N
V-149	Pr-i	Et	N
V-150	Bu-n	Et	N
V-151	Bu-i	Et	N
V-152	Bu-s	Et	N
V-153	But	Et	N
V-154	Pen-n	Et	N
V-155	Pen-i	Et	N
V-156	Pen-neo	Et	N
V-157	CH ₂ CH ₂ C(Me)3	Et	N
V-158	Ph	Et	N
V-159	Ph(2-F)	Et	N
V-160	Ph(3-F)	Et	N
V-161	Ph(4-F)	Et	N
V-162	Ph(2-Me)	Et	N
V-163	Ph(3-Me)	Et	N
V-164	Ph(4-Me)	Et	N
V-165	Me	H	N
V-166	Et	H	N
V-167	Pr-n	H	N
V-168	Pr-i	H	N
V-169	Bu-n	H	N
V-170	Bu-i	H	N
V-171	Bu-s	H	N
V-172	But	H	N
V-173	Pen-n	H	N
V-174	Pen-i	H	N
V-175	Pen-neo	H	N
V-176	CH ₂ CH ₂ C(Me)3	H	N
V-177	Ph	H	N
V-178	Ph(2-F)	H	N
V-179	Ph(3-F)	H	N
V-180	Ph(4-F)	H	N
V-181	Ph(2-Me)	H	N
V-182	Ph(3-Me)	H	N
V-183	Ph(4-Me)	H	N

[0096]

[表36]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
V-184	Me	Me	CH
V-185	Et	Me	CH
V-186	Pr-n	Me	CH
V-187	Pr-i	Me	CH
V-188	Bu-n	Me	CH
V-189	Bu-i	Me	CH
V-190	Bu-s	Me	CH
V-191	Bu-t	Me	CH
V-192	Pen-n	Me	CH
V-193	Pen-i	Me	CH
V-194	Pen-neo	Me	CH
V-195	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
V-196	Ph	Me	CH
V-197	Ph(2-F)	Me	CH
V-198	Ph(3-F)	Me	CH
V-199	Ph(4-F)	Me	CH
V-200	Ph(2-Me)	Me	CH
V-201	Ph(3-Me)	Me	CH
V-202	Ph(4-Me)	Me	CH
V-203		Me	N
V-204		Me	N
V-205		Me	N
V-206		H	N
V-207		Me	N

[0097]

[表37]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
VI-1	Me	Me	N
VI-2	Et	Me	N
VI-3	Pr-n	Me	N
VI-4	Pr-i	Me	N
VI-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	Me	N
VI-6	Bu-n	Me	N
VI-7	Bu-i	Me	N
VI-8	Bu-s	Me	N
VI-9	Bu-t	Me	N
VI-10	Pen-n	Me	N
VI-11	Pen-i	Me	N
VI-12	Pen-neo	Me	N
VI-13	Pen-2	Me	N
VI-14	Pen-3	Me	N
VI-15	CH(Me)CH(Me) ₂	Me	N
VI-16	Hex-n	Me	N
VI-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	N
VI-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
VI-19	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
VI-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	N
VI-21	CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
VI-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	Me	N
VI-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
VI-24	CH ₂ C≡CH	Me	N
VI-25	CH ₂ C≡CMe	Me	N
VI-26	Pr-c	Me	N
VI-27	Bu-c	Me	N
VI-28	Pen-c	Me	N
VI-29	Hex-c	Me	N
VI-30	CH ₂ Pr-c	Me	N
VI-31	CH ₂ Bu-c	Me	N
VI-32	CH ₂ Pen-c	Me	N
VI-33	CH ₂ Hex-c	Me	N
VI-34	CH ₂ CF ₃	Me	N

[0098]

[表38]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
VI-35	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
VI-36	CH ₂ CCl=CHCl	Me	N
VI-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
VI-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
VI-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
VI-40	CH ₂ CH=CF ₂	Me	N
VI-41	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
VI-42	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	N
VI-43	CH ₂ CH(Me)OMe	Me	N
VI-44	CH ₂ CH(Me)OPri	Me	N
VI-45	CH ₂ CH ₂ OPri	Me	N
VI-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	Me	N
VI-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
VI-48	CH ₂ CH ₂ OPri	Me	N
VI-49	CH ₂ CH ₂ OPrc	Me	N
VI-50	CH ₂ CH ₂ OBuc	Me	N
VI-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	N
VI-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	N
VI-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
VI-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	N
VI-55	CH ₂ SMe	Me	N
VI-56	CH ₂ SPr-n	Me	N
VI-57	CH ₂ CH ₃ SMe	Me	N
VI-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	Me	N
VI-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	Me	N
VI-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	Me	N
VI-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	Me	N
VI-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	N
VI-63	CH ₂ CH(Me)SMe	Me	N
VI-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	Me	N
VI-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	Me	N
VI-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	Me	N
VI-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	Me	N
VI-68	Ph	Me	N
VI-69	Ph(2-Cl)	Me	N
VI-70	Ph(3-Cl)	Me	N
VI-71	Ph(4-Cl)	Me	N
VI-72	Ph(2-F)	Me	N
VI-73	Ph(3-F)	Me	N
VI-74	Ph(4-F)	Me	N
VI-75	Ph(2-Me)	Me	N
VI-76	Ph(3-Me)	Me	N
VI-77	Ph(4-Me)	Me	N

[0099]

[表39]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
VI-78	Ph(2-OMe)	Me	N
VI-79	Ph(3-OMe)	Me	N
VI-80	Ph(4-OMe)	Me	N
VI-81	Ph(2-OCF ₃)	Me	N
VI-82	Ph(3-OCF ₃)	Me	N
VI-83	Ph(4-OCF ₃)	Me	N
VI-84	Ph(2-OCHF ₂)	Me	N
VI-85	Ph(3-OCHF ₂)	Me	N
VI-86	Ph(4-OCHF ₂)	Me	N
VI-87	Ph(2-CF ₃)	Me	N
VI-88	Ph(3-CF ₃)	Me	N
VI-89	Ph(4-CF ₃)	Me	N
VI-90	Ph(2-NO ₂)	Me	N
VI-91	Ph(3-NO ₂)	Me	N
VI-92	Ph(4-NO ₂)	Me	N
VI-93	Ph(2-CN)	Me	N
VI-94	Ph(3-CN)	Me	N
VI-95	Ph(4-CN)	Me	N
VI-96	Ph(3-Bu-t)	Me	N
VI-97	Ph(3,5-di-Me)	Me	N
VI-98	Ph(3,5-di-F)	Me	N
VI-99	Ph(2-Cl-6-F)	Me	N
VI-100		Me	N
VI-101	CH ₂ Ph	Me	N
VI-102	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	N
VI-103	CH ₂ CH=CHPh	Me	N
VI-104	CH ₂ C≡CPh	Me	N
VI-105	CH ₂ CH=NOMe	Me	N
VI-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	N
VI-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	N
VI-108	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	N
VI-109	CH ₂ CH=NOPr-i	Me	N
VI-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	Me	N
VI-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	Me	N

[0100]

[表40]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
VI-112		Me	N
VI-113		Me	N
VI-114		Me	N
VI-115		Me	N
VI-116		Me	N
VI-117		Me	N
VI-118		Me	N
VI-119		Me	N
VI-120		Me	N
VI-121		Me	N
VI-122		Me	N
VI-123		Me	N
VI-124		Me	N
VI-125		Me	N
VI-126		Me	N
VI-127		Me	N

[0101]

[表41]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
VI-128		Me	N
VI-129		Me	N
VI-130		Me	N
VI-131		Me	N
VI-132		Me	N
VI-133		Me	N
VI-134		Me	N
VI-135		Me	N
VI-136		Me	N
VI-137		Me	N
VI-138		Me	N
VI-139		Me	N
VI-140		Me	N
VI-141		Me	N
VI-142		Me	N
VI-143		Me	N
VI-144		Me	N
VI-145		Me	N

[0102]

[表42]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
VI-146	Me	Et	N
VI-147	Et	Et	N
VI-148	Pr-n	Et	N
VI-149	Pr-i	Et	N
VI-150	Bu-n	Et	N
VI-151	Bu-i	Et	N
VI-152	Bu-s	Et	N
VI-153	Bu-t	Et	N
VI-154	Pen-n	Et	N
VI-155	Pen-i	Et	N
VI-156	Pen-neo	Et	N
VI-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	N
VI-158	Ph	Et	N
VI-159	Ph(2-F)	Et	N
VI-160	Ph(3-F)	Et	N
VI-161	Ph(4-F)	Et	N
VI-162	Ph(2-Me)	Et	N
VI-163	Ph(3-Me)	Et	N
VI-164	Ph(4-Me)	Et	N
VI-165	Me	H	N
VI-166	Et	H	N
VI-167	Pr-n	H	N
VI-168	Pr-i	H	N
VI-169	Bu-n	H	N
VI-170	Bu-i	H	N
VI-171	Bu-s	H	N
VI-172	Bu-t	H	N
VI-173	Pen-n	H	N
VI-174	Pen-i	H	N
VI-175	Pen-neo	H	N

[0103]

[表43]

化合物番号	X ³	X ⁴	W
VI-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	N
VI-177	Ph	H	N
VI-178	Ph(2-F)	H	N
VI-179	Ph(3-F)	H	N
VI-180	Ph(4-F)	H	N
VI-181	Ph(2-Me)	H	N
VI-182	Ph(3-Me)	H	N
VI-183	Ph(4-Me)	H	N
VI-184	Me	Me	CH
VI-185	Et	Me	CH
VI-186	Pr-n	Me	CH
VI-187	Pr-i	Me	CH
VI-188	Bu-n	Me	CH
VI-189	Bu-i	Me	CH
VI-190	Bu-s	Me	CH
VI-191	But	Me	CH
VI-192	Pen-n	Me	CH
VI-193	Pen-i	Me	CH
VI-194	Pen-neo	Me	CH
VI-195	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
VI-196	Ph	Me	CH
VI-197	Ph(2-F)	Me	CH
VI-198	Ph(3-F)	Me	CH
VI-199	Ph(4-F)	Me	CH
VI-200	Ph(2-Me)	Me	CH
VI-201	Ph(3-Me)	Me	CH
VI-202	Ph(4-Me)	Me	CH

[0104]

[表44]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VII-1	Me	Me	N
VII-2	Et	Me	N
VII-3	Pr-n	Me	N
VII-4	Pr-i	Me	N
VII-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	Me	N
VII-6	Bu-n	Me	N
VII-7	Bu-i	Me	N
VII-8	Bu-s	Me	N
VII-9	Bu-t	Me	N
VII-10	Pen-n	Me	N
VII-11	Pen-i	Me	N
VII-12	Pen-neo	Me	N
VII-13	Pen-2	Me	N
VII-14	Pen-3	Me	N
VII-15	CH(Me)CH(Me) ₂	Me	N
VII-16	Hex-n	Me	N
VII-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	N
VII-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
VII-19	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
VII-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	N
VII-21	CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
VII-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	Me	N
VII-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
VII-24	CH ₂ C≡CH	Me	N
VII-25	CH ₂ C≡CMe	Me	N
VII-26	Pr-c	Me	N
VII-27	Bu-c	Me	N
VII-28	Pen-c	Me	N
VII-29	Hex-c	Me	N
VII-30	CH ₂ Pr-c	Me	N
VII-31	CH ₂ Bu-c	Me	N
VII-32	CH ₂ Pen-c	Me	N
VII-33	CH ₂ Hex-c	Me	N

[0105]

[表45]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VII-34	CH ₂ CF ₃	Me	N
VII-35	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
VII-36	CH ₂ CCl=CHCl	Me	N
VII-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
VII-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
VII-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
VII-40	CH ₂ CH=CF ₂	Me	N
VII-41	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
VII-42	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	N
VII-43	CH ₂ CH(Me)OMe	Me	N
VII-44	CH ₂ CH(Me)OPri	Me	N
VII-45	CH ₂ CH ₂ OPri	Me	N
VII-46	CH ₂ CH ₂ OBu <i>i</i>	Me	N
VII-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
VII-48	CH ₂ CH ₂ OPri	Me	N
VII-49	CH ₂ CH ₂ OPrc	Me	N
VII-50	CH ₂ CH ₂ OBu <i>c</i>	Me	N
VII-51	CH ₂ CH ₂ OPen <i>c</i>	Me	N
VII-52	CH ₂ CH ₂ OHex <i>c</i>	Me	N
VII-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
VII-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	N
VII-55	CH ₂ SMe	Me	N
VII-56	CH ₂ SPr <i>n</i>	Me	N
VII-57	CH ₂ CH ₃ SMe	Me	N
VII-58	CH ₂ CH ₃ SOME	Me	N
VII-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	Me	N
VII-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	Me	N
VII-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOME	Me	N
VII-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	N
VII-63	CH ₂ CH(Me)SMe	Me	N
VII-64	CH ₂ CH(Me)SOME	Me	N
VII-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	Me	N
VII-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	Me	N
VII-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	Me	N
VII-68	Ph	Me	N
VII-69	Ph(2-Cl)	Me	N
VII-70	Ph(3-Cl)	Me	N
VII-71	Ph(4-Cl)	Me	N
VII-72	Ph(2-F)	Me	N
VII-73	Ph(3-F)	Me	N
VII-74	Ph(4-F)	Me	N

[0106]

[表46]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VII-75	Ph(2-Me)	Me	N
VII-76	Ph(3-Me)	Me	N
VII-77	Ph(4-Me)	Me	N
VII-78	Ph(2-OMe)	Me	N
VII-79	Ph(3-OMe)	Me	N
VII-80	Ph(4-OMe)	Me	N
VII-81	Ph(2-OCF ₃)	Me	N
VII-82	Ph(3-OCF ₃)	Me	N
VII-83	Ph(4-OCF ₃)	Me	N
VII-84	Ph(2-OCHF ₂)	Me	N
VII-85	Ph(3-OCHF ₂)	Me	N
VII-86	Ph(4-OCHF ₂)	Me	N
VII-87	Ph(2-CF ₃)	Me	N
VII-88	Ph(3-CF ₃)	Me	N
VII-89	Ph(4-CF ₃)	Me	N
VII-90	Ph(2-NO ₂)	Me	N
VII-91	Ph(3-NO ₂)	Me	N
VII-92	Ph(4-NO ₂)	Me	N
VII-93	Ph(2-CN)	Me	N
VII-94	Ph(3-CN)	Me	N
VII-95	Ph(4-CN)	Me	N
VII-96	Ph(3-Bu-t)	Me	N
VII-97	Ph(3,5-di-Me)	Me	N
VII-98	Ph(3,5-di-F)	Me	N
VII-99	Ph(2-Cl-6-F)	Me	N
VII-100		Me	N
VII-101	CH ₂ Ph	Me	N
VII-102	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	N
VII-103	CH ₂ CH=CHPh	Me	N
VII-104	CH ₂ C≡CPh	Me	N
VII-105	CH ₂ CH=NOMe	Me	N
VII-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	N
VII-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	N
VII-108	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	N
VII-109	CH ₂ CH=NOPr-i	Me	N
VII-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	Me	N
VII-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	Me	N

[0107]

[表47]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VII-112		Me	N
VII-113		Me	N
VII-114		Me	N
VII-115		Me	N
VII-116		Me	N
VII-117		Me	N
VII-118		Me	N
VII-119		Me	N
VII-120		Me	N
VII-121		Me	N
VII-122		Me	N
VII-123		Me	N
VII-124		Me	N
VII-125		Me	N
VII-126		Me	N

[0108]

[表48]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VII-127		Me	N
VII-128		Me	N
VII-129		Me	N
VII-130		Me	N
VII-131		Me	N
VII-132		Me	N
VII-133		Me	N
VII-134		Me	N
VII-135		Me	N
VII-136		Me	N
VII-137		Me	N
VII-138		Me	N
VII-139		Me	N
VII-140		Me	N
VII-141		Me	N
VII-142		Me	N
VII-143		Me	N
VII-144		Me	N
VII-145		Me	N

[0109]

[表49]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VII-146	Me	Et	N
VII-147	Et	Et	N
VII-148	Pr-n	Et	N
VII-149	Pr-i	Et	N
VII-150	Burn	Et	N
VII-151	Bu-i	Et	N
VII-152	Bu-s	Et	N
VII-153	Bu-t	Et	N
VII-154	Pen-n	Et	N
VII-155	Pen-i	Et	N
VII-156	Pen-neo	Et	N
VII-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	N
VII-158	Ph	Et	N
VII-159	Ph(2-F)	Et	N
VII-160	Ph(3-F)	Et	N
VII-161	Ph(4-F)	Et	N
VII-162	Ph(2-Me)	Et	N
VII-163	Ph(3-Me)	Et	N
VII-164	Ph(4-Me)	Et	N
VII-165	Me	Me	CH
VII-166	Et	Me	CH
VII-167	Pr-n	Me	CH
VII-168	Pr-i	Me	CH
VII-169	Burn	Me	CH
VII-170	Bu-i	Me	CH
VII-171	Bu-s	Me	CH
VII-172	Bu-t	Me	CH
VII-173	Pen-n	Me	CH
VII-174	Pen-i	Me	CH
VII-175	Pen-neo	Me	CH
VII-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
VII-177	Ph	Me	CH
VII-178	Ph(2-F)	Me	CH
VII-179	Ph(3-F)	Me	CH
VII-180	Ph(4-F)	Me	CH
VII-181	Ph(2-Me)	Me	CH
VII-182	Ph(3-Me)	Me	CH
VII-183	Ph(4-Me)	Me	CH
VII-184	Ph(4-F)	Et	N
VII-185	Ph(4-F)	CH ₂ C≡CH	N

[0110]

[表50]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VII-186		Me	N
VII-187		Me	N
VII-188		Me	N
VII-189		Me	N
VII-190		Me	N
VII-191		Me	N
VII-192		Me	N
VII-193		Me	N
VII-194		Me	N

[0111]

[表51]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VIII-1	Me	Me	N
VIII-2	Et	Me	N
VIII-3	Pr-n	Me	N
VIII-4	Pri	Me	N
VIII-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	Me	N
VIII-6	Bu-n	Me	N
VIII-7	Bu-i	Me	N
VIII-8	Bu-s	Me	N
VIII-9	But	Me	N
VIII-10	Pen-n	Me	N
VIII-11	Pen-i	Me	N
VIII-12	Pen-neo	Me	N
VIII-13	Pen-2	Me	N
VIII-14	Pen-3	Me	N
VIII-15	CH(Me)CH(Me) ₂	Me	N
VIII-16	Hex-n	Me	N
VIII-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	N
VIII-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
VIII-19	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
VIII-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	N
VIII-21	CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
VIII-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	Me	N
VIII-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
VIII-24	CH ₂ C≡CH	Me	N
VIII-25	CH ₂ C≡CMe	Me	N
VIII-26	Pre	Me	N
VIII-27	Bu-c	Me	N
VIII-28	Pen-c	Me	N
VIII-29	Hex-c	Me	N
VIII-30	CH ₂ Pre	Me	N
VIII-31	CH ₂ Buc	Me	N
VIII-32	CH ₂ Pen-c	Me	N
VIII-33	CH ₂ Hex-c	Me	N
VIII-34	CH ₂ CF ₃	Me	N

[0112]

[表52]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VIII-35	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
VIII-36	CH ₂ CCl=CHCl	Me	N
VIII-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
VIII-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
VIII-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
VIII-40	CH ₂ CH=CF ₂	Me	N
VIII-41	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
VIII-42	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	N
VIII-43	CH ₂ CH(Me)OMe	Me	N
VIII-44	CH ₂ CH(Me)OPri	Me	N
VIII-45	CH ₂ CH ₂ OPri	Me	N
VIII-46	CH ₂ CH ₂ OBu <i>i</i>	Me	N
VIII-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
VIII-48	CH ₂ CH ₂ OPr <i>i</i>	Me	N
VIII-49	CH ₂ CH ₂ OPr <i>c</i>	Me	N
VIII-50	CH ₂ CH ₂ OBu <i>c</i>	Me	N
VIII-51	CH ₂ CH ₂ OPen <i>c</i>	Me	N
VIII-52	CH ₂ CH ₂ OHex <i>c</i>	Me	N
VIII-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
VIII-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	N
VIII-55	CH ₂ SMe	Me	N
VIII-56	CH ₂ SPr <i>n</i>	Me	N
VIII-57	CH ₂ CH ₃ SMe	Me	N
VIII-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	Me	N
VIII-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	Me	N
VIII-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	Me	N
VIII-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	Me	N
VIII-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	N
VIII-63	CH ₂ CH(Me)SMe	Me	N
VIII-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	Me	N
VIII-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	Me	N
VIII-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	Me	N
VIII-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	Me	N

[0113]

[表53]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VIII-68	Ph	Me	N
VIII-69	Ph(2-Cl)	Me	N
VIII-70	Ph(3-Cl)	Me	N
VIII-71	Ph(4-Cl)	Me	N
VIII-72	Ph(2-F)	Me	N
VIII-73	Ph(3-F)	Me	N
VIII-74	Ph(4-F)	Me	N
VIII-75	Ph(2-Me)	Me	N
VIII-76	Ph(3-Me)	Me	N
VIII-77	Ph(4-Me)	Me	N
VIII-78	Ph(2-OMe)	Me	N
VIII-79	Ph(3-OMe)	Me	N
VIII-80	Ph(4-OMe)	Me	N
VIII-81	Ph(2-OCF ₃)	Me	N
VIII-82	Ph(3-OCF ₃)	Me	N
VIII-83	Ph(4-OCF ₃)	Me	N
VIII-84	Ph(2-OCHF ₂)	Me	N
VIII-85	Ph(3-OCHF ₂)	Me	N
VIII-86	Ph(4-OCHF ₂)	Me	N
VIII-87	Ph(2-CF ₃)	Me	N
VIII-88	Ph(3-CF ₃)	Me	N
VIII-89	Ph(4-CF ₃)	Me	N
VIII-90	Ph(2-NO ₂)	Me	N
VIII-91	Ph(3-NO ₂)	Me	N
VIII-92	Ph(4-NO ₂)	Me	N
VIII-93	Ph(2-CN)	Me	N
VIII-94	Ph(3-CN)	Me	N
VIII-95	Ph(4-CN)	Me	N
VIII-96	Ph(3-Bu-t)	Me	N
VIII-97	Ph(3,5-di-Me)	Me	N
VIII-98	Ph(3,5-di-F)	Me	N
VIII-99	Ph(2-Cl-6-F)	Me	N

[0114]

[表54]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VIII-100		Me	N
VIII-101	CH ₂ Ph	Me	N
VIII-102	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	N
VIII-103	CH ₂ CH=CHPh	Me	N
VIII-104	CH ₂ C≡CPh	Me	N
VIII-105	CH ₂ CH=NOMe	Me	N
VIII-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	N
VIII-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	N
VIII-108	CH ₂ CH=NOPr-i	Me	N
VIII-109	CH ₂ CH=NOPr-i	Me	N
VIII-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	Me	N
VIII-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	Me	N
VIII-112		Me	N
VIII-113		Me	N
VIII-114		Me	N
VIII-115		Me	N
VIII-116		Me	N
VIII-117		Me	N
VIII-118		Me	N
VIII-119		Me	N
VIII-120		Me	N
VIII-121		Me	N
VIII-122		Me	N

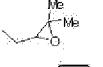
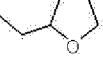
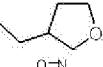
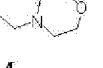
[0115]

[表55]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VIII-123		Me	N
VIII-124		Me	N
VIII-125		Me	N
VIII-126		Me	N
VIII-127		Me	N
VIII-128		Me	N
VIII-129		Me	N
VIII-130		Me	N
VIII-131		Me	N
VIII-132		Me	N
VIII-133		Me	N
VIII-134		Me	N
VIII-135		Me	N
VIII-136		Me	N
VIII-137		Me	N
VIII-138		Me	N
VIII-139		Me	N
VIII-140		Me	N

[0116]

[表56]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VIII-141		Me	N
VIII-142		Me	N
VIII-143		Me	N
VIII-144		Me	N
VIII-145		Me	N
VIII-146	Me	Et	N
VIII-147	Et	Et	N
VIII-148	Pr-n	Et	N
VIII-149	Pr-i	Et	N
VIII-150	Bu-n	Et	N
VIII-151	Bu-i	Et	N
VIII-152	Bu-s	Et	N
VIII-153	Bu-t	Et	N
VIII-154	Pen-n	Et	N
VIII-155	Pen-i	Et	N
VIII-156	Pen-neo	Et	N
VIII-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	N
VIII-158	Ph	Et	N
VIII-159	Ph(2-F)	Et	N
VIII-160	Ph(3-F)	Et	N
VIII-161	Ph(4-F)	Et	N
VIII-162	Ph(2-Me)	Et	N
VIII-163	Ph(3-Me)	Et	N
VIII-164	Ph(4-Me)	Et	N

[0117]

[表57]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
VIII-165	Me	Me	CH
VIII-166	Et	Me	CH
VIII-167	Pr-n	Me	CH
VIII-168	Pri	Me	CH
VIII-169	Bu-n	Me	CH
VIII-170	Bu-i	Me	CH
VIII-171	Bu-s	Me	CH
VIII-172	But	Me	CH
VIII-173	Pen-n	Me	CH
VIII-174	Pen-i	Me	CH
VIII-175	Pen-neo	Me	CH
VIII-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
VIII-177	Ph	Me	CH
VIII-178	Ph(2-F)	Me	CH
VIII-179	Ph(3-F)	Me	CH
VIII-180	Ph(4-F)	Me	CH
VIII-181	Ph(2-Me)	Me	CH
VIII-182	Ph(3-Me)	Me	CH
VIII-183	Ph(4-Me)	Me	CH
VIII-184		Me	N
VIII-185		Me	N
VIII-186		Me	N

[0118]

[表58]

化合物番号	X ⁵	X ⁶		W
IX-1	Me		Me	N
IX-2	Et		Me	N
IX-3	Pr-n		Me	N
IX-4	Pr-i		Me	N
IX-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me		Me	N
IX-6	Bu-n		Me	N
IX-7	Bu-i		Me	N
IX-8	Bu-s		Me	N
IX-9	Bu-t		Me	N
IX-10	Pen-n		Me	N
IX-11	Pen-i		Me	N
IX-12	Pen-neo		Me	N
IX-13	Pen-2		Me	N
IX-14	Pen-3		Me	N
IX-15	CH(Me)CH(Me) ₂		Me	N
IX-16	Hex-n		Me	N
IX-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂		Me	N
IX-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃		Me	N
IX-19	CH ₂ CH=CH ₂		Me	N
IX-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂		Me	N
IX-21	CH ₂ CH=CMe ₂		Me	N
IX-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂		Me	N
IX-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂		Me	N
IX-24	CH ₂ C≡CH		Me	N
IX-25	CH ₂ C≡CMe		Me	N
IX-26	Pr-c		Me	N
IX-27	Bu-c		Me	N
IX-28	Pen-c		Me	N
IX-29	Hex-c		Me	N
IX-30	CH ₂ Pr-c		Me	N
IX-31	CH ₂ Bu-c		Me	N
IX-32	CH ₂ Pen-c		Me	N
IX-33	CH ₂ Hex-c		Me	N
IX-34	CH ₂ CF ₃		Me	N

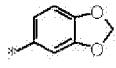
[0119]

[表59]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
IX-35	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
IX-36	CH ₂ CCl=CHCl	Me	N
IX-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
IX-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
IX-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
IX-40	CH ₂ CH=CF ₂	Me	N
IX-41	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
IX-42	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	N
IX-43	CH ₂ CH(Me)OMe	Me	N
IX-44	CH ₂ CH(Me)OPr-i	Me	N
IX-45	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	N
IX-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	Me	N
IX-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
IX-48	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	N
IX-49	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	N
IX-50	CH ₂ CH ₂ OBu-c	Me	N
IX-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	N
IX-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	N
IX-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
IX-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	N
IX-55	CH ₂ SMe	Me	N
IX-56	CH ₂ SPr-n	Me	N
IX-57	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	N
IX-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	Me	N
IX-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	Me	N
IX-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	Me	N
IX-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	Me	N
IX-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	N
IX-63	CH ₂ CH(Me)SMe	Me	N
IX-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	Me	N
IX-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	Me	N
IX-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	Me	N
IX-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	Me	N

[0120]

[表60]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
IX-68	Ph	Me	N
IX-69	Ph(2-Cl)	Me	N
IX-70	Ph(3-Cl)	Me	N
IX-71	Ph(4-Cl)	Me	N
IX-72	Ph(2-F)	Me	N
IX-73	Ph(3-F)	Me	N
IX-74	Ph(4-F)	Me	N
IX-75	Ph(2-Me)	Me	N
IX-76	Ph(3-Me)	Me	N
IX-77	Ph(4-Me)	Me	N
IX-78	Ph(2-OMe)	Me	N
IX-79	Ph(3-OMe)	Me	N
IX-80	Ph(4-OMe)	Me	N
IX-81	Ph(2-OCF ₃)	Me	N
IX-82	Ph(3-OCF ₃)	Me	N
IX-83	Ph(4-OCF ₃)	Me	N
IX-84	Ph(2-OCHF ₂)	Me	N
IX-85	Ph(3-OCHF ₂)	Me	N
IX-86	Ph(4-OCHF ₂)	Me	N
IX-87	Ph(2-CF ₃)	Me	N
IX-88	Ph(3-CF ₃)	Me	N
IX-89	Ph(4-CF ₃)	Me	N
IX-90	Ph(2-NO ₂)	Me	N
IX-91	Ph(3-NO ₂)	Me	N
IX-92	Ph(4-NO ₂)	Me	N
IX-93	Ph(2-CN)	Me	N
IX-94	Ph(3-CN)	Me	N
IX-95	Ph(4-CN)	Me	N
IX-96	Ph(3-Bu-t)	Me	N
IX-97	Ph(3,5-di-Me)	Me	N
IX-98	Ph(3,5-di-F)	Me	N
IX-99	Ph(2-Cl-6-F)	Me	N
IX-100		Me	N

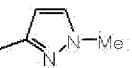
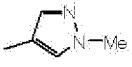
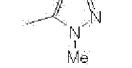
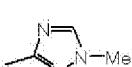
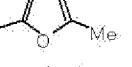
[0121]

[表61]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
IX-101	CH ₂ Ph	Me	N
IX-102	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	N
IX-103	CH ₂ CH=CHPh	Me	N
IX-104	CH ₂ C≡CPh	Me	N
IX-105	CH ₂ CH=NOMe	Me	N
IX-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	N
IX-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	N
IX-108	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	N
IX-109	CH ₂ CH=NOPri	Me	N
IX-110	CH ₂ C(Me)=NOPri	Me	N
IX-111	CH ₂ C(Me)=NOBut	Me	N
IX-112		Me	N
IX-113		Me	N
IX-114		Me	N
IX-115		Me	N
IX-116		Me	N
IX-117		Me	N
IX-118		Me	N
IX-119		Me	N
IX-120		Me	N
IX-121		Me	N
IX-122		Me	N
IX-123		Me	N

[0122]

[表62]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
IX-124		Me	N
IX-125		Me	N
IX-126		Me	N
IX-127		Me	N
IX-128		Me	N
IX-129		Me	N
IX-130		Me	N
IX-131		Me	N
IX-132		Me	N
IX-133		Me	N
IX-134		Me	N
IX-135		Me	N
IX-136		Me	N
IX-137		Me	N
IX-138		Me	N

[0123]

[表63]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
IX-139		Me	N
IX-140		Me	N
IX-141		Me	N
IX-142		Me	N
IX-143		Me	N
IX-144		Me	N
IX-145		Me	N
IX-146	Me	Et	N
IX-147	Et	Et	N
IX-148	Pr-n	Et	N
IX-149	Pr-i	Et	N
IX-150	Bu-n	Et	N
IX-151	Bu-i	Et	N
IX-152	Bu-s	Et	N
IX-153	But	Et	N
IX-154	Pen-n	Et	N
IX-155	Pen-i	Et	N
IX-156	Pen-neo	Et	N
IX-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	N
IX-158	Ph	Et	N
IX-159	Ph(2-F)	Et	N
IX-160	Ph(3-F)	Et	N
IX-161	Ph(4-F)	Et	N
IX-162	Ph(2-Me)	Et	N
IX-163	Ph(3-Me)	Et	N
IX-164	Ph(4-Me)	Et	N

[0124]

[表64]

化合物番号	X ⁵	X ⁶	W
IX-165	Me	Me	CH
IX-166	Et	Me	CH
IX-167	Pr-n	Me	CH
IX-168	Pr-i	Me	CH
IX-169	Bu-n	Me	CH
IX-170	Bu-i	Me	CH
IX-171	Bu-s	Me	CH
IX-172	Bu-t	Me	CH
IX-173	Pen-n	Me	CH
IX-174	Pen-i	Me	CH
IX-175	Pen-neo	Me	CH
IX-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
IX-177	Ph	Me	CH
IX-178	Ph(2-F)	Me	CH
IX-179	Ph(3-F)	Me	CH
IX-180	Ph(4-F)	Me	CH
IX-181	Ph(2-Me)	Me	CH
IX-182	Ph(3-Me)	Me	CH
IX-183	Ph(4-Me)	Me	CH

[0125]

[表65]

化合物番号	X ⁷	W
X-1	Me	N
X-2	Et	N
X-3	Pr-n	N
X-4	Pri	N
X-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	N
X-6	Bu-n	N
X-7	Bu-i	N
X-8	Bu-s	N
X-9	Bu-t	N
X-10	Pen-n	N
X-11	Pen-i	N
X-12	Pen-neo	N
X-13	Pen-2	N
X-14	Pen-3	N
X-15	CH(Me)CH(Me) ₂	N
X-16	Hex-n	N
X-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	N
X-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	N
X-19	CH ₂ CH=CH ₂	N
X-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	N
X-21	CH ₂ CH=CMe ₂	N
X-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	N
X-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	N
X-24	CH ₂ C≡CH	N
X-25	CH ₂ C≡CMe	N
X-26	Pr-c	N
X-27	Bu-c	N
X-28	Pen-c	N
X-29	Hex-c	N
X-30	CH ₂ Pr-c	N
X-31	CH ₂ Bu-c	N
X-32	CH ₂ Pen-c	N
X-33	CH ₂ Hex-c	N
X-34	CH ₂ CF ₃	N

[0126]

[表66]

化合物番号	X ⁷	W
X-35	CH ₂ CH=CCl ₂	N
X-36	CH ₂ CCl=CHCl	N
X-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	N
X-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	N
X-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	N
X-40	CH ₂ CH=CF ₂	N
X-41	CH ₂ CH ₂ OMe	N
X-42	CH ₂ CH ₂ OEt	N
X-43	CH ₂ CH(Me)OMe	N
X-44	CH ₂ CH(Me)OPri	N
X-45	CH ₂ CH ₂ OPri	N
X-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	N
X-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	N
X-48	CH ₂ CH ₂ OPr-i	N
X-49	CH ₂ CH ₂ OPr-c	N
X-50	CH ₂ CH ₂ OBu-c	N
X-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	N
X-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	N
X-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	N
X-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	N
X-55	CH ₂ SMe	N
X-56	CH ₂ SPri-n	N
X-57	CH ₂ CH ₃ SMe	N
X-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	N
X-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	N
X-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	N
X-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	N
X-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	N
X-63	CH ₂ CH(Me)SMe	N
X-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	N
X-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	N
X-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	N
X-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	N

[0127]

[表67]

化合物番号	X ¹	W
X-68	Ph	N
X-69	Ph(2-Cl)	N
X-70	Ph(3-Cl)	N
X-71	Ph(4-Cl)	N
X-72	Ph(2-F)	N
X-73	Ph(3-F)	N
X-74	Ph(4-F)	N
X-75	Ph(2-Me)	N
X-76	Ph(3-Me)	N
X-77	Ph(4-Me)	N
X-78	Ph(2-OMe)	N
X-79	Ph(3-OMe)	N
X-80	Ph(4-OMe)	N
X-81	Ph(2-OCF ₃)	N
X-82	Ph(3-OCF ₃)	N
X-83	Ph(4-OCF ₃)	N
X-84	Ph(2-OCHF ₂)	N
X-85	Ph(3-OCHF ₂)	N
X-86	Ph(4-OCHF ₂)	N
X-87	Ph(2-CF ₃)	N
X-88	Ph(3-CF ₃)	N
X-89	Ph(4-CF ₃)	N
X-90	Ph(2-NO ₂)	N
X-91	Ph(3-NO ₂)	N
X-92	Ph(4-NO ₂)	N
X-93	Ph(2-CN)	N
X-94	Ph(3-CN)	N
X-95	Ph(4-CN)	N
X-96	Ph(3-Bu-t)	N
X-97	Ph(3,5-di-Me)	N
X-98	Ph(3,5-di-F)	N
X-99		N

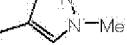
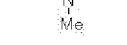
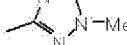
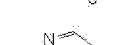
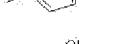
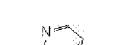
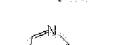
[0128]

[表68]

化合物番号	X ⁷	W
X-100	CH ₂ Ph	N
X-101	CH ₂ CH ₂ Ph	N
X-102	CH ₂ CH=CHPh	N
X-103	CH ₂ C≡CPh	N
X-104	CH ₂ CH=NOMe	N
X-105	CH ₂ C(Me)=NOMe	N
X-106	CH ₂ C(Me)=NOEt	N
X-107	CH ₂ CH=NOPr-n	N
X-108	CH ₂ CH=NOPr-i	N
X-109	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	N
X-110	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	N
X-111		N
X-112		N
X-113		N
X-114		N
X-115		N
X-116		N
X-117		N
X-118		N
X-119		N
X-120		N
X-121		N
X-122		N

[0129]

[表69]

化合物番号	X ⁷	W
X-123		N
X-124		N
X-125		N
X-126		N
X-127		N
X-128		N
X-129		N
X-130		N
X-131		N
X-132		N
X-133		N
X-134		N
X-135		N
X-136		N

[0130]

[表70]

化合物番号	X ⁷	W
X-137		N
X-138		N
X-139		N
X-140		N
X-141		N
X-142	Me	CH
X-143	Et	CH
X-144	Pr-n	CH
X-145	Pr-i	CH
X-146	Bu-n	CH
X-147	Bu-i	CH
X-148	Bu-s	CH
X-149	Bu-t	CH
X-150	Pen-n	CH
X-151	Pen-i	CH
X-152	Pen-neo	CH
X-153	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CH
X-154	Ph	CH
X-155	Ph(2-F)	CH
X-156	Ph(3-F)	CH
X-157	Ph(4-F)	CH
X-158	Ph(2-Me)	CH
X-159	Ph(3-Me)	CH
X-160	Ph(4-Me)	CH

[0131]

[表71]

化合物番号	X ⁷	W
XI-1	Me	N
XI-2	Et	N
XI-3	Pr-n	N
XI-4	Pri	N
XI-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	N
XI-6	Bu-n	N
XI-7	Bu-i	N
XI-8	Bu-s	N
XI-9	Bu-t	N
XI-10	Pen-n	N
XI-11	Pen-i	N
XI-12	Pen-neo	N
XI-13	Pen-2	N
XI-14	Pen-3	N
XI-15	CH(Me)CH(Me) ₂	N
XI-16	Hex-n	N
XI-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	N
XI-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	N
XI-19	CH ₂ CH=CH ₂	N
XI-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	N
XI-21	CH ₂ CH=CMe ₂	N
XI-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	N
XI-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	N
XI-24	CH ₂ C≡CH	N
XI-25	CH ₂ C≡CMe	N
XI-26	Pr-c	N
XI-27	Bu-c	N
XI-28	Pen-c	N
XI-29	Hex-c	N
XI-30	CH ₂ Pr-c	N
XI-31	CH ₂ Bu-c	N
XI-32	CH ₂ Pen-c	N
XI-33	CH ₂ Hex-c	N
XI-34	CH ₂ CF ₃	N

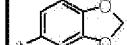
[0132]

[表72]

化合物番号	X ⁷	W
XI-35	CH ₂ CH=CCl ₂	N
XI-36	CH ₂ CCl=CHCl	N
XI-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	N
XI-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	N
XI-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	N
XI-40	CH ₂ CH=CF ₂	N
XI-41	CH ₂ CH ₂ OMe	N
XI-42	CH ₂ CH ₂ OEt	N
XI-43	CH ₂ CH(Me)OMe	N
XI-44	CH ₂ CH(Me)OPri	N
XI-45	CH ₂ CH ₂ OPri	N
XI-46	CH ₂ CH ₂ OBu <i>t</i>	N
XI-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	N
XI-48	CH ₂ CH ₂ OPr <i>i</i>	N
XI-49	CH ₂ CH ₂ OPr <i>c</i>	N
XI-50	CH ₂ CH ₂ OBu <i>c</i>	N
XI-51	CH ₂ CH ₂ OPen <i>c</i>	N
XI-52	CH ₂ CH ₂ OHex <i>c</i>	N
XI-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	N
XI-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	N
XI-55	CH ₂ SMe	N
XI-56	CH ₂ SPri	N
XI-57	CH ₂ CH ₃ SMe	N
XI-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	N
XI-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	N
XI-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	N
XI-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	N
XI-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	N
XI-63	CH ₂ CH(Me)SMe	N
XI-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	N
XI-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	N
XI-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	N
XI-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	N

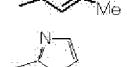
[0133]

[表73]

化合物番号	X ⁷	W
XI-68	Ph	N
XI-69	Ph(2-Cl)	N
XI-70	Ph(3-Cl)	N
XI-71	Ph(4-Cl)	N
XI-72	Ph(2-F)	N
XI-73	Ph(3-F)	N
XI-74	Ph(4-F)	N
XI-75	Ph(2-Me)	N
XI-76	Ph(3-Me)	N
XI-77	Ph(4-Me)	N
XI-78	Ph(2-OMe)	N
XI-79	Ph(3-OMe)	N
XI-80	Ph(4-OMe)	N
XI-81	Ph(2-OCF ₃)	N
XI-82	Ph(3-OCF ₃)	N
XI-83	Ph(4-OCF ₃)	N
XI-84	Ph(2-OCHF ₂)	N
XI-85	Ph(3-OCHF ₂)	N
XI-86	Ph(4-OCHF ₂)	N
XI-87	Ph(2-CF ₃)	N
XI-88	Ph(3-CF ₃)	N
XI-89	Ph(4-CF ₃)	N
XI-90	Ph(2-NO ₂)	N
XI-91	Ph(3-NO ₂)	N
XI-92	Ph(4-NO ₂)	N
XI-93	Ph(2-CN)	N
XI-94	Ph(3-CN)	N
XI-95	Ph(4-CN)	N
XI-96	Ph(3-Bu-t)	N
XI-97	Ph(3,5-di-Me)	N
XI-98	Ph(3,5-di-F)	N
XI-99		N

[0134]

[表74]

化合物番号	X ⁷	W
XI-100	CH ₂ Ph	N
XI-101	CH ₂ CH ₂ Ph	N
XI-102	CH ₂ CH=CHPh	N
XI-103	CH ₂ C≡CPh	N
XI-104	CH ₂ CH=NOMe	N
XI-105	CH ₂ C(Me)=NOMe	N
XI-106	CH ₂ C(Me)=NOEt	N
XI-107	CH ₂ CH=NOPr-n	N
XI-108	CH ₂ CH=NOPri	N
XI-109	CH ₂ C(Me)=NOPri	N
XI-110	CH ₂ C(Me)=NOBut	N
XI-111		N
XI-112		N
XI-113		N
XI-114		N
XI-115		N
XI-116		N
XI-117		N
XI-118		N
XI-119		N
XI-120		N
XI-121		N
XI-122		N

[0135]

[表75]

化合物番号	X ⁷	W
XI-123		N
XI-124		N
XI-125		N
XI-126		N
XI-127		N
XI-128		N
XI-129		N
XI-130		N
XI-131		N
XI-132		N
XI-133		N
XI-134		N
XI-135		N
XI-136		N

[0136]

[表76]

化合物番号	X ⁷	W
XI-137		N
XI-138		N
XI-139		N
XI-140		N
XI-141		N
XI-142	Me	CH
XI-143	Et	CH
XI-144	Pr-n	CH
XI-145	Pri	CH
XI-146	Bu-n	CH
XI-147	Bu-i	CH
XI-148	Bu-s	CH
XI-149	Bu-t	CH
XI-150	Pen-n	CH
XI-151	Pen-i	CH
XI-152	Pen-neo	CH
XI-153	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CH
XI-154	Ph	CH
XI-155	Ph(2-F)	CH
XI-156	Ph(3-F)	CH
XI-157	Ph(4-F)	CH
XI-158	Ph(2-Me)	CH
XI-159	Ph(3-Me)	CH
XI-160	Ph(4-Me)	CH

[0137]

[表77]

化合物番号	X ⁷	W
XII-1	Me	N
XII-2	Et	N
XII-3	Pr-n	N
XII-4	Pr-i	N
XII-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	N
XII-6	Bu-n	N
XII-7	Bu-i	N
XII-8	Bu-s	N
XII-9	Bu-t	N
XII-10	Pen-n	N
XII-11	Pen-i	N
XII-12	Pen-neo	N
XII-13	Pen-2	N
XII-14	Pen-3	N
XII-15	CH(Me)CH(Me) ₂	N
XII-16	Hex-n	N
XII-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	N
XII-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	N
XII-19	CH ₂ CH=CH ₂	N
XII-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	N
XII-21	CH ₂ CH=CMe ₂	N
XII-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	N
XII-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	N
XII-24	CH ₂ C≡CH	N
XII-25	CH ₂ C≡CMe	N
XII-26	Pr-c	N
XII-27	Bu-c	N
XII-28	Pen-c	N
XII-29	Hex-c	N
XII-30	CH ₂ Pr-c	N
XII-31	CH ₂ Bu-c	N
XII-32	CH ₂ Pen-c	N
XII-33	CH ₂ Hex-c	N
XII-34	CH ₂ CF ₃	N

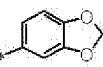
[0138]

[表78]

化合物番号	X ⁷	W
XII-35	CH ₂ CH=CCl ₂	N
XII-36	CH ₂ CCl=CHCl	N
XII-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	N
XII-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	N
XII-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	N
XII-40	CH ₂ CH=CF ₂	N
XII-41	CH ₂ CH ₂ OMe	N
XII-42	CH ₂ CH ₂ OEt	N
XII-43	CH ₂ CH(Me)OMe	N
XII-44	CH ₂ CH(Me)OPri	N
XII-45	CH ₂ CH ₂ OPri	N
XII-46	CH ₂ CH ₂ OBu <i>i</i>	N
XII-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	N
XII-48	CH ₂ CH ₂ OPri	N
XII-49	CH ₂ CH ₂ OPrc	N
XII-50	CH ₂ CH ₂ OBuc	N
XII-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	N
XII-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	N
XII-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	N
XII-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	N
XII-55	CH ₂ SMe	N
XII-56	CH ₂ SPri	N
XII-57	CH ₂ CH ₃ SMe	N
XII-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	N
XII-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	N
XII-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	N
XII-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	N
XII-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	N
XII-63	CH ₂ CH(Me)SMe	N
XII-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	N
XII-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	N
XII-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	N
XII-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	N

[0139]

[表79]

化合物番号	X ⁷	W
XII-68	Ph	N
XII-69	Ph(2-Cl)	N
XII-70	Ph(3-Cl)	N
XII-71	Ph(4-Cl)	N
XII-72	Ph(2-F)	N
XII-73	Ph(3-F)	N
XII-74	Ph(4-F)	N
XII-75	Ph(2-Me)	N
XII-76	Ph(3-Me)	N
XII-77	Ph(4-Me)	N
XII-78	Ph(2-OMe)	N
XII-79	Ph(3-OMe)	N
XII-80	Ph(4-OMe)	N
XII-81	Ph(2-OCF ₃)	N
XII-82	Ph(3-OCF ₃)	N
XII-83	Ph(4-OCF ₃)	N
XII-84	Ph(2-OCHF ₂)	N
XII-85	Ph(3-OCHF ₂)	N
XII-86	Ph(4-OCHF ₂)	N
XII-87	Ph(2-CF ₃)	N
XII-88	Ph(3-CF ₃)	N
XII-89	Ph(4-CF ₃)	N
XII-90	Ph(2-NO ₂)	N
XII-91	Ph(3-NO ₂)	N
XII-92	Ph(4-NO ₂)	N
XII-93	Ph(2-CN)	N
XII-94	Ph(3-CN)	N
XII-95	Ph(4-CN)	N
XII-96	Ph(3-Bu-t)	N
XII-97	Ph(3,5-di-Me)	N
XII-98	Ph(3,5-di-F)	N
XII-99		N

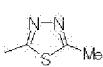
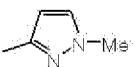
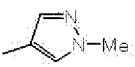
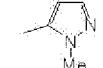
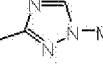
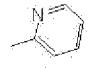
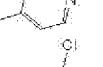
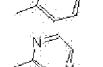
[0140]

[表80]

化合物番号	X ⁷	W
XII-100	CH ₂ Ph	N
XII-101	CH ₂ CH ₂ Ph	N
XII-102	CH ₂ CH=CHPh	N
XII-103	CH ₂ C≡CPh	N
XII-104	CH ₂ CH=NOMe	N
XII-105	CH ₂ C(Me)=NOMe	N
XII-106	CH ₂ C(Me)=NOEt	N
XII-107	CH ₂ CH=NOPr-n	N
XII-108	CH ₂ CH=NOPr-i	N
XII-109	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	N
XII-110	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	N
XII-111		N
XII-112		N
XII-113		N
XII-114		N
XII-115		N
XII-116		N
XII-117		N
XII-118		N
XII-119		N
XII-120		N
XII-121		N

[0141]

[表81]

化合物番号	X ⁷	W
XII-122		N
XII-123		N
XII-124		N
XII-125		N
XII-126		N
XII-127		N
XII-128		N
XII-129		N
XII-130		N
XII-131		N
XII-132		N
XII-133		N
XII-134		N

[0142]

[表82]

化合物番号	X ⁷	W
XII-135		N
XII-136		N
XII-137		N
XII-138		N
XII-139		N
XII-140		N
XII-141		N
XII-142	Me	CH
XII-143	Et	CH
XII-144	Pr-n	CH
XII-145	Pr-i	CH
XII-146	Bu-n	CH
XII-147	Bu-i	CH
XII-148	Bu-s	CH
XII-149	Bu-t	CH
XII-150	Pen-n	CH
XII-151	Pen-i	CH
XII-152	Pen-neo	CH
XII-153	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CH
XII-154	Ph	CH
XII-155	Ph(2-F)	CH
XII-156	Ph(3-F)	CH
XII-157	Ph(4-F)	CH
XII-158	Ph(2-Me)	CH
XII-159	Ph(3-Me)	CH
XII-160	Ph(4-Me)	CH

[0143]

[表83]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XIII-1	Me	H	N
XIII-2	Et	H	N
XIII-3	Pr-n	H	N
XIII-4	Pr-i	H	N
XIII-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	H	N
XIII-6	Bu-n	H	N
XIII-7	Bu-i	H	N
XIII-8	Bu-s	H	N
XIII-9	Bu-t	H	N
XIII-10	Pen-n	H	N
XIII-11	Pen-i	H	N
XIII-12	Pen-neo	H	N
XIII-13	Pen-2	H	N
XIII-14	Pen-3	H	N
XIII-15	CH(Me)CH(Me) ₂	H	N
XIII-16	Hex-n	H	N
XIII-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	H	N
XIII-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	N
XIII-19	CH ₂ CH=CH ₂	H	N
XIII-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	H	N
XIII-21	CH ₂ CH=CMe ₂	H	N
XIII-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	H	N
XIII-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	H	N
XIII-24	CH ₂ C≡CH	H	N
XIII-25	CH ₂ C≡CMe	H	N
XIII-26	Pr-c	H	N
XIII-27	Bu-c	H	N
XIII-28	Pen-c	H	N
XIII-29	Hex-c	H	N
XIII-30	CH ₂ Pr-c	H	N
XIII-31	CH ₂ Bu-c	H	N
XIII-32	CH ₂ Pen-c	H	N
XIII-33	CH ₂ Hex-c	H	N
XIII-34	CH ₂ CF ₃	H	N

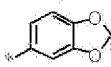
[0144]

[表84]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XIII-35	CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
XIII-36	CH ₂ CCl=CHCl	H	N
XIII-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
XIII-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
XIII-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
XIII-40	CH ₂ CH=CF ₂	H	N
XIII-41	CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
XIII-42	CH ₂ CH ₂ OEt	H	N
XIII-43	CH ₂ CH(Me)OMe	H	N
XIII-44	CH ₂ CH(Me)OPri	H	N
XIII-45	CH ₂ CH ₂ OPri	H	N
XIII-46	CH ₂ CH ₂ OBu <i>t</i>	H	N
XIII-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
XIII-48	CH ₂ CH ₂ OPr <i>t</i>	H	N
XIII-49	CH ₂ CH ₂ OPr <i>c</i>	H	N
XIII-50	CH ₂ CH ₂ OBu <i>c</i>	H	N
XIII-51	CH ₂ CH ₂ OPen <i>c</i>	H	N
XIII-52	CH ₂ CH ₂ OHex <i>c</i>	H	N
XIII-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	H	N
XIII-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	N
XIII-55	CH ₂ SMe	H	N
XIII-56	CH ₂ SPri <i>n</i>	H	N
XIII-57	CH ₂ CH ₂ SMe	H	N
XIII-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	H	N
XIII-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	H	N
XIII-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	H	N
XIII-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	H	N
XIII-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	N
XIII-63	CH ₂ CH(Me)SMe	H	N
XIII-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	H	N
XIII-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	H	N
XIII-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	H	N
XIII-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	H	N

[0145]

[表85]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XIII-68	Ph	H	N
XIII-69	Ph(2-Cl)	H	N
XIII-70	Ph(3-Cl)	H	N
XIII-71	Ph(4-Cl)	H	N
XIII-72	Ph(2-F)	H	N
XIII-73	Ph(3-F)	H	N
XIII-74	Ph(4-F)	H	N
XIII-75	Ph(2-Me)	H	N
XIII-76	Ph(3-Me)	H	N
XIII-77	Ph(4-Me)	H	N
XIII-78	Ph(2-OMe)	H	N
XIII-79	Ph(3-OMe)	H	N
XIII-80	Ph(4-OMe)	H	N
XIII-81	Ph(2-OCF ₃)	H	N
XIII-82	Ph(3-OCF ₃)	H	N
XIII-83	Ph(4-OCF ₃)	H	N
XIII-84	Ph(2-OCHF ₂)	H	N
XIII-85	Ph(3-OCHF ₂)	H	N
XIII-86	Ph(4-OCHF ₂)	H	N
XIII-87	Ph(2-CF ₃)	H	N
XIII-88	Ph(3-CF ₃)	H	N
XIII-89	Ph(4-CF ₃)	H	N
XIII-90	Ph(2-NO ₂)	H	N
XIII-91	Ph(3-NO ₂)	H	N
XIII-92	Ph(4-NO ₂)	H	N
XIII-93	Ph(2-CN)	H	N
XIII-94	Ph(3-CN)	H	N
XIII-95	Ph(4-CN)	H	N
XIII-96	Ph(3-Bu-t)	H	N
XIII-97	Ph(3,5-di-Me)	H	N
XIII-98	Ph(2,4-di-F)	H	N
XIII-99	Ph(2-Cl-6-F)	H	N
XIII-100		H	N

[0146]

[表86]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XIII-101	CH ₂ Ph	H	N
XIII-102	CH ₂ CH ₂ Ph	H	N
XIII-103	CH ₂ CH=CHPh	H	N
XIII-104	CH ₂ C≡CPh	H	N
XIII-105	CH ₂ CH=NOMe	H	N
XIII-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	H	N
XIII-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	H	N
XIII-108	CH ₂ CH=NOPr-n	H	N
XIII-109	CH ₂ CH=NOPr-i	H	N
XIII-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	H	N
XIII-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	H	N
XIII-112		H	N
XIII-113		H	N
XIII-114		H	N
XIII-115		H	N
XIII-116		H	N
XIII-117		H	N
XIII-118		H	N
XIII-119		H	N
XIII-120		H	N
XIII-121		H	N
XIII-122		H	N
XIII-123		H	N

[0147]

[表87]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XIII-124		H	N
XIII-125		H	N
XIII-126		H	N
XIII-127		H	N
XIII-128		H	N
XIII-129		H	N
XIII-130		H	N
XIII-131		H	N
XIII-132		H	N
XIII-133		H	N
XIII-134		H	N
XIII-135		H	N
XIII-136		H	N
XIII-137		H	N

[0148]

[表88]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XIII-138		H	N
XIII-139		H	N
XIII-140		H	N
XIII-141		H	N
XIII-142		H	N
XIII-143		H	N
XIII-144		H	N
XIII-145		H	N
XIII-148	Pr-n	Me	N
XIII-149	Pr-i	Me	N
XIII-150	Bu-n	Me	N
XIII-151	Bu-i	Me	N
XIII-152	Bu-s	Me	N
XIII-153	Bu-t	Me	N
XIII-154	Pen-n	Me	N
XIII-155	Pen-i	Me	N
XIII-156	Pen-neo	Me	N
XIII-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N

[0149]

[表89]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XIII-158	Ph	Me	N
XIII-159	Ph(2-F)	Me	N
XIII-160	Ph(3-F)	Me	N
XIII-161	Ph(4-F)	Me	N
XIII-162	Ph(2-Me)	Me	N
XIII-163	Ph(3-Me)	Me	N
XIII-164	Ph(4-Me)	Me	N
XIII-166	Et	Me	CH
XIII-167	Pr-n	Me	CH
XIII-168	Pr-i	Me	CH
XIII-169	Bu-n	Me	CH
XIII-170	Bu-i	Me	CH
XIII-171	Bu-s	Me	CH
XIII-172	Bu-t	Me	CH
XIII-173	Pen-n	Me	CH
XIII-174	Pen-i	Me	CH
XIII-175	Pen-neo	Me	CH
XIII-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
XIII-177	Ph	Me	CH
XIII-178	Ph(2-F)	Me	CH
XIII-179	Ph(3-F)	Me	CH
XIII-180	Ph(4-F)	Me	CH
XIII-181	Ph(2-Me)	Me	CH
XIII-182	Ph(3-Me)	Me	CH
XIII-183	Ph(4-Me)	Me	CH

[0150]

[表90]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XIV-1	Me	H	N
XIV-2	Et	H	N
XIV-3	Pr-n	H	N
XIV-4	Pr-i	H	N
XIV-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	H	N
XIV-6	Bu-n	H	N
XIV-7	Bu-i	H	N
XIV-8	Bu-s	H	N
XIV-9	Bu-t	H	N
XIV-10	Pen-n	H	N
XIV-11	Pen-i	H	N
XIV-12	Pen-neo	H	N
XIV-13	Pen-2	H	N
XIV-14	Pen-3	H	N
XIV-15	CH(Me)CH(Me) ₂	H	N
XIV-16	Hex-n	H	N
XIV-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	H	N
XIV-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	N
XIV-19	CH ₂ CH=CH ₂	H	N
XIV-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	H	N
XIV-21	CH ₂ CH=CMe ₂	H	N
XIV-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	H	N
XIV-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	H	N
XIV-24	CH ₂ C≡CH	H	N
XIV-25	CH ₂ C≡CMe	H	N
XIV-26	Pr-c	H	N
XIV-27	Bu-c	H	N
XIV-28	Pen-c	H	N
XIV-29	Hex-c	H	N
XIV-30	CH ₂ Pr-c	H	N
XIV-31	CH ₂ Bu-c	H	N
XIV-32	CH ₂ Pen-c	H	N
XIV-33	CH ₂ Hex-c	H	N
XIV-34	CH ₂ CF ₃	H	N

[0151]

[表91]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XIV-35	CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
XIV-36	CH ₂ CCl=CHCl	H	N
XIV-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
XIV-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
XIV-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
XIV-40	CH ₂ CH=CF ₂	H	N
XIV-41	CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
XIV-42	CH ₂ CH ₂ OEt	H	N
XIV-43	CH ₂ CH(Me)OMe	H	N
XIV-44	CH ₂ CH(Me)OPri	H	N
XIV-45	CH ₂ CH ₂ OPri	H	N
XIV-46	CH ₂ CH ₂ OBu <i>i</i>	H	N
XIV-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
XIV-48	CH ₂ CH ₂ OPr <i>i</i>	H	N
XIV-49	CH ₂ CH ₂ OPr <i>c</i>	H	N
XIV-50	CH ₂ CH ₂ OBu <i>c</i>	H	N
XIV-51	CH ₂ CH ₂ OPen <i>c</i>	H	N
XIV-52	CH ₂ CH ₂ OHex <i>c</i>	H	N
XIV-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	H	N
XIV-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	N
XIV-55	CH ₂ SMe	H	N
XIV-56	CH ₂ SPr <i>n</i>	H	N
XIV-57	CH ₂ CH ₃ SMe	H	N
XIV-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	H	N
XIV-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	H	N
XIV-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	H	N
XIV-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	H	N
XIV-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	N
XIV-63	CH ₂ CH(Me)SMe	H	N
XIV-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	H	N
XIV-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	H	N
XIV-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	H	N
XIV-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	H	N

[0152]

[表92]

化合物番号	X ⁶	X ⁶	W
XIV-68	Ph	H	N
XIV-69	Ph(2-Cl)	H	N
XIV-70	Ph(3-Cl)	H	N
XIV-71	Ph(4-Cl)	H	N
XIV-72	Ph(2-F)	H	N
XIV-73	Ph(3-F)	H	N
XIV-74	Ph(4-F)	H	N
XIV-75	Ph(2-Me)	H	N
XIV-76	Ph(3-Me)	H	N
XIV-77	Ph(4-Me)	H	N
XIV-78	Ph(2-OMe)	H	N
XIV-79	Ph(3-OMe)	H	N
XIV-80	Ph(4-OMe)	H	N
XIV-81	Ph(2-OCF ₃)	H	N
XIV-82	Ph(3-OCF ₃)	H	N
XIV-83	Ph(4-OCF ₃)	H	N
XIV-84	Ph(2-OCHF ₂)	H	N
XIV-85	Ph(3-OCHF ₂)	H	N
XIV-86	Ph(4-OCHF ₂)	H	N
XIV-87	Ph(2-CF ₃)	H	N
XIV-88	Ph(3-CF ₃)	H	N
XIV-89	Ph(4-CF ₃)	H	N
XIV-90	Ph(2-NO ₂)	H	N
XIV-91	Ph(3-NO ₂)	H	N
XIV-92	Ph(4-NO ₂)	H	N
XIV-93	Ph(2-CN)	H	N
XIV-94	Ph(3-CN)	H	N
XIV-95	Ph(4-CN)	H	N
XIV-96	Ph(3-Bu-t)	H	N
XIV-97	Ph(3,5-di-Me)	H	N
XIV-98	Ph(2,5-di-F)	H	N
XIV-99	Ph(2-Cl-6-F)	H	N
XIV-100		H	N

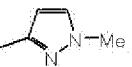
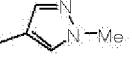
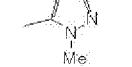
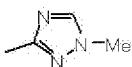
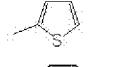
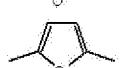
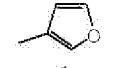
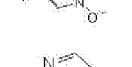
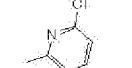
[0153]

[表93]

化合物番号	X ⁶	X ⁶	W
XIV-101	CH ₂ Ph	H	N
XIV-102	CH ₂ CH ₂ Ph	H	N
XIV-103	CH ₂ CH=CHPh	H	N
XIV-104	CH ₂ C≡CPh	H	N
XIV-105	CH ₂ CH=NOMe	H	N
XIV-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	H	N
XIV-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	H	N
XIV-108	CH ₂ CH=NOPr-i	H	N
XIV-109	CH ₂ CH=NOPr-i	H	N
XIV-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	H	N
XIV-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	H	N
XIV-112		H	N
XIV-113		H	N
XIV-114		H	N
XIV-115		H	N
XIV-116		H	N
XIV-117		H	N
XIV-118		H	N
XIV-119		H	N
XIV-120		H	N
XIV-121		H	N
XIV-122		H	N
XIV-123		H	N

[0154]

[表94]

化合物番号	X^6	X^6	W
XIV-124		H	N
XIV-125		H	N
XIV-126		H	N
XIV-127		H	N
XIV-128		H	N
XIV-129		H	N
XIV-130		H	N
XIV-131		H	N
XIV-132		H	N
XIV-133		H	N
XIV-134		H	N
XIV-135		H	N
XIV-136		H	N
XIV-137		H	N

[0155]

[表95]

化合物番号	X ⁶	X ⁶	W
XIV-138		H	N
XIV-139		H	N
XIV-140		H	N
XIV-141		H	N
XIV-142		H	N
XIV-143		H	N
XIV-144		H	N
XIV-145		H	N
XIV-148	Pr-n	Me	N
XIV-149	Pr-i	Me	N
XIV-150	Bu-n	Me	N
XIV-151	Bu-i	Me	N
XIV-152	Bu-s	Me	N
XIV-153	Bu-t	Me	N
XIV-154	Pen-n	Me	N
XIV-155	Pen-i	Me	N
XIV-156	Pen-neo	Me	N
XIV-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N

[0156]

[表96]

化合物番号	X ⁶	X ⁶	W
XIV-158	Ph	Me	N
XIV-159	Ph(2-F)	Me	N
XIV-160	Ph(3-F)	Me	N
XIV-161	Ph(4-F)	Me	N
XIV-162	Ph(2-Me)	Me	N
XIV-163	Ph(3-Me)	Me	N
XIV-164	Ph(4-Me)	Me	N
XIV-166	Et	Me	CH
XIV-167	Pr-n	Me	CH
XIV-168	Pr-i	Me	CH
XIV-169	Bu-n	Me	CH
XIV-170	Bu-i	Me	CH
XIV-171	Bu-s	Me	CH
XIV-172	Bu-t	Me	CH
XIV-173	Pen-n	Me	CH
XIV-174	Pen-i	Me	CH
XIV-175	Pen-neo	Me	CH
XIV-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
XIV-177	Ph	Me	CH
XIV-178	Ph(2-F)	Me	CH
XIV-179	Ph(3-F)	Me	CH
XIV-180	Ph(4-F)	Me	CH
XIV-181	Ph(2-Me)	Me	CH
XIV-182	Ph(3-Me)	Me	CH
XIV-183	Ph(4-Me)	Me	CH

[0157]

[表97]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XV-1	Me	H	N
XV-2	Et	H	N
XV-3	Pr-n	H	N
XV-4	Pri	H	N
XV-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	H	N
XV-6	Bu-n	H	N
XV-7	Bu-i	H	N
XV-8	Bu-s	H	N
XV-9	But	H	N
XV-10	Pen-n	H	N
XV-11	Pen-i	H	N
XV-12	Pen-neo	H	N
XV-13	Pen-2	H	N
XV-14	Pen-3	H	N
XV-15	CH(Me)CH(Me) ₂	H	N
XV-16	Hex-n	H	N
XV-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	H	N
XV-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	N
XV-19	CH ₂ CH=CH ₂	H	N
XV-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	H	N
XV-21	CH ₂ CH=CMe ₂	H	N
XV-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	H	N
XV-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	H	N
XV-24	CH ₂ C≡CH	H	N
XV-25	CH ₂ C≡CMe	H	N
XV-26	Pr-c	H	N
XV-27	Bu-c	H	N
XV-28	Pen-c	H	N
XV-29	Hex-c	H	N
XV-30	CH ₂ Pr-c	H	N
XV-31	CH ₂ Bu-c	H	N
XV-32	CH ₂ Pen-c	H	N
XV-33	CH ₂ Hex-c	H	N
XV-34	CH ₂ CF ₃	H	N

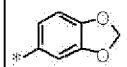
[0158]

[表98]

化合物番号	X ^b	X ^b	W
XV-35	CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
XV-36	CH ₂ CCl=CHCl	H	N
XV-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	H	N
XV-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
XV-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	H	N
XV-40	CH ₂ CH=CF ₂	H	N
XV-41	CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
XV-42	CH ₂ CH ₂ OEt	H	N
XV-43	CH ₂ CH(Me)OMe	H	N
XV-44	CH ₂ CH(Me)OPri	H	N
XV-45	CH ₂ CH ₂ OPri	H	N
XV-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	H	N
XV-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	N
XV-48	CH ₂ CH ₂ OPri	H	N
XV-49	CH ₂ CH ₂ OPr-e	H	N
XV-50	CH ₂ CH ₂ OBu-e	H	N
XV-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	H	N
XV-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	H	N
XV-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	H	N
XV-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	N
XV-55	CH ₂ SMe	H	N
XV-56	CH ₂ SPr-n	H	N
XV-57	CH ₂ CH ₃ SMe	H	N
XV-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	H	N
XV-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	H	N
XV-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	H	N
XV-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	H	N
XV-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	N
XV-63	CH ₂ CH(Me)SMe	H	N
XV-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	H	N
XV-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	H	N
XV-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	H	N
XV-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	H	N

[0159]

[表99]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XV-68	Ph	H	N
XV-69	Ph(2-Cl)	H	N
XV-70	Ph(3-Cl)	H	N
XV-71	Ph(4-Cl)	H	N
XV-72	Ph(2-F)	H	N
XV-73	Ph(3-F)	H	N
XV-74	Ph(4-F)	H	N
XV-75	Ph(2-Me)	H	N
XV-76	Ph(3-Me)	H	N
XV-77	Ph(4-Me)	H	N
XV-78	Ph(2-OMe)	H	N
XV-79	Ph(3-OMe)	H	N
XV-80	Ph(4-OMe)	H	N
XV-81	Ph(2-OCF ₃)	H	N
XV-82	Ph(3-OCF ₃)	H	N
XV-83	Ph(4-OCF ₃)	H	N
XV-84	Ph(2-OCHF ₂)	H	N
XV-85	Ph(3-OCHF ₂)	H	N
XV-86	Ph(4-OCHF ₂)	H	N
XV-87	Ph(2-CF ₃)	H	N
XV-88	Ph(3-CF ₃)	H	N
XV-89	Ph(4-CF ₃)	H	N
XV-90	Ph(2-NO ₂)	H	N
XV-91	Ph(3-NO ₂)	H	N
XV-92	Ph(4-NO ₂)	H	N
XV-93	Ph(2-CN)	H	N
XV-94	Ph(3-CN)	H	N
XV-95	Ph(4-CN)	H	N
XV-96	Ph(3-Bu-t)	H	N
XV-97	Ph(3,5-di-Me)	H	N
XV-98	Ph(2,5-di-F)	H	N
XV-99	Ph(2-Cl-6-F)	H	N
XV-100		H	N

[0160]

[表100]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XV-101	CH ₂ Ph	H	N
XV-102	CH ₂ CH ₂ Ph	H	N
XV-103	CH ₂ CH=CHPh	H	N
XV-104	CH ₂ C≡CPh	H	N
XV-105	CH ₂ CH=NOMe	H	N
XV-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	H	N
XV-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	H	N
XV-108	CH ₂ CH=NOPr-n	H	N
XV-109	CH ₂ CH=NOPr-i	H	N
XV-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	H	N
XV-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	H	N
XV-112		H	N
XV-113		H	N
XV-114		H	N
XV-115		H	N
XV-116		H	N
XV-117		H	N
XV-118		H	N
XV-119		H	N
XV-120		H	N
XV-121		H	N
XV-122		H	N
XV-123		H	N

[0161]

[表101]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XV-124		H	N
XV-125		H	N
XV-126		H	N
XV-127		H	N
XV-128		H	N
XV-129		H	N
XV-130		H	N
XV-131		H	N
XV-132		H	N
XV-133		H	N
XV-134		H	N
XV-135		H	N
XV-136		H	N
XV-137		H	N
XV-138		H	N

[0162]

[表102]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XV-139		H	N
XV-140		H	N
XV-141		H	N
XV-142		H	N
XV-143		H	N
XV-144		H	N
XV-145		H	N
XV-148	Pr-n	Me	N
XV-149	Pri	Me	N
XV-150	Bu-n	Me	N
XV-151	Bu-i	Me	N
XV-152	Bu-s	Me	N
XV-153	But	Me	N
XV-154	Pen-n	Me	N
XV-155	Pen-i	Me	N
XV-156	Pen-neo	Me	N

[0163]

[表103]

化合物番号	X ⁶	X ⁵	W
XV-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
XV-158	Ph	Me	N
XV-159	Ph(2-F)	Me	N
XV-160	Ph(3-F)	Me	N
XV-161	Ph(4-F)	Me	N
XV-162	Ph(2-Me)	Me	N
XV-163	Ph(3-Me)	Me	N
XV-164	Ph(4-Me)	Me	N
XV-166	Et	Me	CH
XV-167	Pr-n	Me	CH
XV-168	Pri	Me	CH
XV-169	Bu-n	Me	CH
XV-170	Bu-i	Me	CH
XV-171	Bu-s	Me	CH
XV-172	But	Me	CH
XV-173	Pen-n	Me	CH
XV-174	Pen-i	Me	CH
XV-175	Pen-neo	Me	CH
XV-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
XV-177	Ph	Me	CH
XV-178	Ph(2-F)	Me	CH
XV-179	Ph(3-F)	Me	CH
XV-180	Ph(4-F)	Me	CH
XV-181	Ph(2-Me)	Me	CH
XV-182	Ph(3-Me)	Me	CH
XV-183	Ph(4-Me)	Me	CH

[0164]

[表104]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVI-1	Me	Me	N
XVI-2	Et	Me	N
XVI-3	Pr-n	Me	N
XVI-4	Pr-i	Me	N
XVI-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	Me	N
XVI-6	Bu-n	Me	N
XVI-7	Bu-i	Me	N
XVI-8	Bu-s	Me	N
XVI-9	Bu-t	Me	N
XVI-10	Pen-n	Me	N
XVI-11	Pen-i	Me	N
XVI-12	Pen-neo	Me	N
XVI-13	Pen-2	Me	N
XVI-14	Pen-3	Me	N
XVI-15	CH(Me)CH(Me) ₂	Me	N
XVI-16	Hex-n	Me	N
XVI-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	N
XVI-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
XVI-19	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
XVI-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	N
XVI-21	CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
XVI-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	Me	N
XVI-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
XVI-24	CH ₂ C≡CH	Me	N
XVI-25	CH ₂ C≡CMe	Me	N
XVI-26	Pr-c	Me	N
XVI-27	Bu-c	Me	N
XVI-28	Pen-c	Me	N
XVI-29	Hex-c	Me	N
XVI-30	CH ₂ Pen-c	Me	N
XVI-31	CH ₂ Bu-c	Me	N
XVI-32	CH ₂ Pen-c	Me	N
XVI-33	CH ₂ Hex-c	Me	N
XVI-34	CH ₂ CF ₃	Me	N

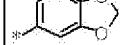
[0165]

[表105]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVI-35	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
XVI-36	CH ₂ CCl=CHCl	Me	N
XVI-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
XVI-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
XVI-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
XVI-40	CH ₂ CH=CF ₂	Me	N
XVI-41	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
XVI-42	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	N
XVI-43	CH ₂ CH(Me)OMe	Me	N
XVI-44	CH ₂ CH(Me)OPri	Me	N
XVI-45	CH ₂ CH ₂ OPri	Me	N
XVI-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	Me	N
XVI-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
XVI-48	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	N
XVI-49	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	N
XVI-50	CH ₂ CH ₂ OBu-c	Me	N
XVI-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	N
XVI-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	N
XVI-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
XVI-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	N
XVI-55	CH ₂ SMe	Me	N
XVI-56	CH ₂ SPri-n	Me	N
XVI-57	CH ₂ CH ₃ SMe	Me	N
XVI-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	Me	N
XVI-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	Me	N
XVI-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	Me	N
XVI-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	Me	N
XVI-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	N
XVI-63	CH ₂ CH(Me)SMe	Me	N
XVI-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	Me	N
XVI-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	Me	N
XVI-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	Me	N
XVI-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	Me	N

[0166]

[表106]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVI-68	Ph	Me	N
XVI-69	Ph(2-Cl)	Me	N
XVI-70	Ph(3-Cl)	Me	N
XVI-71	Ph(4-Cl)	Me	N
XVI-72	Ph(2-F)	Me	N
XVI-73	Ph(3-F)	Me	N
XVI-74	Ph(4-F)	Me	N
XVI-75	Ph(2-Me)	Me	N
XVI-76	Ph(3-Me)	Me	N
XVI-77	Ph(4-Me)	Me	N
XVI-78	Ph(2-OMe)	Me	N
XVI-79	Ph(3-OMe)	Me	N
XVI-80	Ph(4-OMe)	Me	N
XVI-81	Ph(2-OCF ₃)	Me	N
XVI-82	Ph(3-OCF ₃)	Me	N
XVI-83	Ph(4-OCF ₃)	Me	N
XVI-84	Ph(2-OCHF ₂)	Me	N
XVI-85	Ph(3-OCHF ₂)	Me	N
XVI-86	Ph(4-OCHF ₂)	Me	N
XVI-87	Ph(2-CF ₃)	Me	N
XVI-88	Ph(3-CF ₃)	Me	N
XVI-89	Ph(4-CF ₃)	Me	N
XVI-90	Ph(2-NO ₂)	Me	N
XVI-91	Ph(3-NO ₂)	Me	N
XVI-92	Ph(4-NO ₂)	Me	N
XVI-93	Ph(2-CN)	Me	N
XVI-94	Ph(3-CN)	Me	N
XVI-95	Ph(4-CN)	Me	N
XVI-96	Ph(3-Bu-t)	Me	N
XVI-97	Ph(3,5-di-Me)	Me	N
XVI-98	Ph(3,5-di-F)	Me	N
XVI-99	Ph(2-Cl-6-F)	Me	N
XVI-100		Me	N

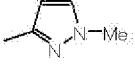
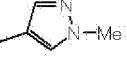
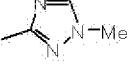
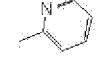
[0167]

[表107]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVI-101	CH ₂ Ph	Me	N
XVI-102	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	N
XVI-103	CH ₂ CH=CHPh	Me	N
XVI-104	CH ₂ C≡CPh	Me	N
XVI-105	CH ₂ CH=NOMe	Me	N
XVI-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	N
XVI-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	N
XVI-108	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	N
XVI-109	CH ₂ CH=NOPr-i	Me	N
XVI-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	Me	N
XVI-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	Me	N
XVI-112		Me	N
XVI-113		Me	N
XVI-114		Me	N
XVI-115		Me	N
XVI-116		Me	N
XVI-117		Me	N
XVI-118		Me	N
XVI-119		Me	N
XVI-120		Me	N
XVI-121		Me	N
XVI-122		Me	N
XVI-123		Me	N

[0168]

[表108]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVI-124		Me	N
XVI-125		Me	N
XVI-126		Me	N
XVI-127		Me	N
XVI-128		Me	N
XVI-129		Me	N
XVI-130		Me	N
XVI-131		Me	N
XVI-132		Me	N
XVI-133		Me	N
XVI-134		Me	N
XVI-135		Me	N
XVI-136		Me	N
XVI-137		Me	N

[0169]

[表109]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVI-138		Me	N
XVI-139		Me	N
XVI-140		Me	N
XVI-141		Me	N
XVI-142		Me	N
XVI-143		Me	N
XVI-144		Me	N
XVI-145		Me	N
XVI-146	Me	Et	N
XVI-147	Et	Et	N
XVI-148	Pr-n	Et	N
XVI-149	Pr-i	Et	N
XVI-150	Burn	Et	N
XVI-151	Buri	Et	N
XVI-152	Burs	Et	N
XVI-153	But	Et	N
XVI-154	Pen-n	Et	N
XVI-155	Pen-i	Et	N
XVI-156	Pen-neo	Et	N

[0170]

[表110]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVI-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	N
XVI-158	Ph	Et	N
XVI-159	Ph(2-F)	Et	N
XVI-160	Ph(3-F)	Et	N
XVI-161	Ph(4-F)	Et	N
XVI-162	Ph(2-Me)	Et	N
XVI-163	Ph(3-Me)	Et	N
XVI-164	Ph(4-Me)	Et	N
XVI-165	Me	Me	CH
XVI-166	Et	Me	CH
XVI-167	Pr-n	Me	CH
XVI-168	Pri	Me	CH
XVI-169	Bu-n	Me	CH
XVI-170	Bu-i	Me	CH
XVI-171	Bu-s	Me	CH
XVI-172	But	Me	CH
XVI-173	Pen-n	Me	CH
XVI-174	Pen-i	Me	CH
XVI-175	Pen-neo	Me	CH
XVI-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
XVI-177	Ph	Me	CH
XVI-178	Ph(2-F)	Me	CH
XVI-179	Ph(3-F)	Me	CH
XVI-180	Ph(4-F)	Me	CH
XVI-181	Ph(2-Me)	Me	CH
XVI-182	Ph(3-Me)	Me	CH
XVI-183	Ph(4-Me)	Me	CH

[0171]

[表111]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVII-1	Me	Me	N
XVII-2	Et	Me	N
XVII-3	Pr-n	Me	N
XVII-4	Pr-i	Me	N
XVII-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	Me	N
XVII-6	Bu-n	Me	N
XVII-7	Bu-i	Me	N
XVII-8	Bu-s	Me	N
XVII-9	Bu-t	Me	N
XVII-10	Pen-n	Me	N
XVII-11	Pen-i	Me	N
XVII-12	Pen-neo	Me	N
XVII-13	Pen-2	Me	N
XVII-14	Pen-3	Me	N
XVII-15	CH(Me)CH(Me) ₂	Me	N
XVII-16	Hex-n	Me	N
XVII-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	N
XVII-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
XVII-19	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
XVII-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	N
XVII-21	CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
XVII-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	Me	N
XVII-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
XVII-24	CH ₂ C≡CH	Me	N
XVII-25	CH ₂ C≡CMe	Me	N
XVII-26	Pr-e	Me	N
XVII-27	Bu-e	Me	N
XVII-28	Pen-e	Me	N
XVII-29	Hex-e	Me	N
XVII-30	CH ₂ Pr-e	Me	N
XVII-31	CH ₂ Bu-e	Me	N
XVII-32	CH ₂ Pen-e	Me	N
XVII-33	CH ₂ Hex-e	Me	N
XVII-34	CH ₂ CF ₃	Me	N

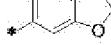
[0172]

[表112]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVII-35	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
XVII-36	CH ₂ CCl=CHCl	Me	N
XVII-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
XVII-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
XVII-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
XVII-40	CH ₂ CH=CF ₂	Me	N
XVII-41	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
XVII-42	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	N
XVII-43	CH ₂ CH(Me)OMe	Me	N
XVII-44	CH ₂ CH(Me)OPri	Me	N
XVII-45	CH ₂ CH ₂ OPri	Me	N
XVII-46	CH ₂ CH ₂ OBu <i>i</i>	Me	N
XVII-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
XVII-48	CH ₂ CH ₂ OPri	Me	N
XVII-49	CH ₂ CH ₂ OPrc	Me	N
XVII-50	CH ₂ CH ₂ OBu <i>c</i>	Me	N
XVII-51	CH ₂ CH ₂ OPen <i>c</i>	Me	N
XVII-52	CH ₂ CH ₂ OHex <i>c</i>	Me	N
XVII-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
XVII-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	N
XVII-55	CH ₂ SMe	Me	N
XVII-56	CH ₂ SPr <i>n</i>	Me	N
XVII-57	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	N
XVII-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	Me	N
XVII-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	Me	N
XVII-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	Me	N
XVII-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	Me	N
XVII-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	N
XVII-63	CH ₂ CH(Me)SMe	Me	N
XVII-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	Me	N
XVII-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	Me	N
XVII-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	Me	N
XVII-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	Me	N

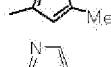
[0173]

[表113]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVII-68	Ph	Me	N
XVII-69	Ph(2-Cl)	Me	N
XVII-70	Ph(3-Cl)	Me	N
XVII-71	Ph(4-Cl)	Me	N
XVII-72	Ph(2-F)	Me	N
XVII-73	Ph(3-F)	Me	N
XVII-74	Ph(4-F)	Me	N
XVII-75	Ph(2-Me)	Me	N
XVII-76	Ph(3-Me)	Me	N
XVII-77	Ph(4-Me)	Me	N
XVII-78	Ph(2-OMe)	Me	N
XVII-79	Ph(3-OMe)	Me	N
XVII-80	Ph(4-OMe)	Me	N
XVII-81	Ph(2-OCF ₃)	Me	N
XVII-82	Ph(3-OCF ₃)	Me	N
XVII-83	Ph(4-OCF ₃)	Me	N
XVII-84	Ph(2-OCHF ₂)	Me	N
XVII-85	Ph(3-OCHF ₂)	Me	N
XVII-86	Ph(4-OCHF ₂)	Me	N
XVII-87	Ph(2-CF ₃)	Me	N
XVII-88	Ph(3-CF ₃)	Me	N
XVII-89	Ph(4-CF ₃)	Me	N
XVII-90	Ph(2-NO ₂)	Me	N
XVII-91	Ph(3-NO ₂)	Me	N
XVII-92	Ph(4-NO ₂)	Me	N
XVII-93	Ph(2-CN)	Me	N
XVII-94	Ph(3-CN)	Me	N
XVII-95	Ph(4-CN)	Me	N
XVII-96	Ph(3-Bu-t)	Me	N
XVII-97	Ph(3,5-di-Me)	Me	N
XVII-98	Ph(3,5-di-F)	Me	N
XVII-99	Ph(2-Cl-6-F)	Me	N
XVII-100		Me	N

[0174]

[表114]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVII-101	CH ₂ Ph	Me	N
XVII-102	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	N
XVII-103	CH ₂ CH=CHPh	Me	N
XVII-104	CH ₂ C≡CPh	Me	N
XVII-105	CH ₂ CH=NOMe	Me	N
XVII-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	N
XVII-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	N
XVII-108	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	N
XVII-109	CH ₂ CH=NOPr-i	Me	N
XVII-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	Me	N
XVII-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	Me	N
XVII-112		Me	N
XVII-113		Me	N
XVII-114		Me	N
XVII-115		Me	N
XVII-116		Me	N
XVII-117		Me	N
XVII-118		Me	N
XVII-119		Me	N
XVII-120		Me	N
XVII-121		Me	N
XVII-122		Me	N

[0175]

[表115]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVII-123		Me	N
XVII-124		Me	N
XVII-125		Me	N
XVII-126		Me	N
XVII-127		Me	N
XVII-128		Me	N
XVII-129		Me	N
XVII-130		Me	N
XVII-131		Me	N
XVII-132		Me	N
XVII-133		Me	N
XVII-134		Me	N

[0176]

[表116]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVII-135		Me	N
XVII-136		Me	N
XVII-137		Me	N
XVII-138		Me	N
XVII-139		Me	N
XVII-140		Me	N
XVII-141		Me	N
XVII-142		Me	N
XVII-143		Me	N
XVII-144		Me	N
XVII-145		Me	N
XVII-146	Me	Et	N
XVII-147	Et	Et	N
XVII-148	Pr-n	Et	N
XVII-149	Pr-i	Et	N

[0177]

[表117]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVII-150	Bu-n	Et	N
XVII-151	Bu-i	Et	N
XVII-152	Bu-s	Et	N
XVII-153	Bu-t	Et	N
XVII-154	Pen-n	Et	N
XVII-155	Pen-i	Et	N
XVII-156	Pen-neo	Et	N
XVII-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	N
XVII-158	Ph	Et	N
XVII-159	Ph(2-F)	Et	N
XVII-160	Ph(3-F)	Et	N
XVII-161	Ph(4-F)	Et	N
XVII-162	Ph(2-Me)	Et	N
XVII-163	Ph(3-Me)	Et	N
XVII-164	Ph(4-Me)	Et	N
XVII-165	Me	Me	CH
XVII-166	Et	Me	CH
XVII-167	Pr-n	Me	CH
XVII-168	Pr-i	Me	CH
XVII-169	Bu-n	Me	CH
XVII-170	Bu-i	Me	CH
XVII-171	Bu-s	Me	CH
XVII-172	Bu-t	Me	CH
XVII-173	Pen-n	Me	CH
XVII-174	Pen-i	Me	CH
XVII-175	Pen-neo	Me	CH
XVII-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
XVII-177	Ph	Me	CH
XVII-178	Ph(2-F)	Me	CH
XVII-179	Ph(3-F)	Me	CH
XVII-180	Ph(4-F)	Me	CH
XVII-181	Ph(2-Me)	Me	CH
XVII-182	Ph(3-Me)	Me	CH
XVII-183	Ph(4-Me)	Me	CH

[0178]

[表118]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVIII-1	Me	Me	N
XVIII-2	Et	Me	N
XVIII-3	Pr-n	Me	N
XVIII-4	Pr-i	Me	N
XVIII-5	CH ₂ CH(Me)CH ₂ Me	Me	N
XVIII-6	Bu-n	Me	N
XVIII-7	Bu-i	Me	N
XVIII-8	Bu-s	Me	N
XVIII-9	Bu-t	Me	N
XVIII-10	Pen-n	Me	N
XVIII-11	Pen-i	Me	N
XVIII-12	Pen-neo	Me	N
XVIII-13	Pen-2	Me	N
XVIII-14	Pen-3	Me	N
XVIII-15	CH(Me)CH(Me) ₂	Me	N
XVIII-16	Hex-n	Me	N
XVIII-17	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	N
XVIII-18	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
XVIII-19	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
XVIII-20	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	N
XVIII-21	CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
XVIII-22	CH ₂ C(Me)=CMe ₂	Me	N
XVIII-23	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	N
XVIII-24	CH ₂ C≡CH	Me	N
XVIII-25	CH ₂ C≡CMe	Me	N
XVIII-26	Pr-e	Me	N
XVIII-27	Bu-e	Me	N
XVIII-28	Pen-e	Me	N
XVIII-29	Hex-e	Me	N
XVIII-30	CH ₂ Pr-e	Me	N
XVIII-31	CH ₂ Bu-e	Me	N
XVIII-32	CH ₂ Pen-e	Me	N
XVIII-33	CH ₂ Hex-e	Me	N
XVIII-34	CH ₂ CF ₃	Me	N

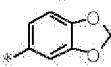
[0179]

[表119]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVIII-35	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
XVIII-36	CH ₂ CCl=CHCl	Me	N
XVIII-37	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	N
XVIII-38	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
XVIII-39	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	N
XVIII-40	CH ₂ CH=CF ₂	Me	N
XVIII-41	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
XVIII-42	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	N
XVIII-43	CH ₂ CH(Me)OMe	Me	N
XVIII-44	CH ₂ CH(Me)OPr-i	Me	N
XVIII-45	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	N
XVIII-46	CH ₂ CH ₂ OBu-i	Me	N
XVIII-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
XVIII-48	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	N
XVIII-49	CH ₂ CH ₂ OPr-e	Me	N
XVIII-50	CH ₂ CH ₂ OBu-e	Me	N
XVIII-51	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	N
XVIII-52	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	N
XVIII-53	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	N
XVIII-54	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	N
XVIII-55	CH ₂ SMe	Me	N
XVIII-56	CH ₂ SPr-n	Me	N
XVIII-57	CH ₂ CH ₃ SMe	Me	N
XVIII-58	CH ₂ CH ₃ SOMe	Me	N
XVIII-59	CH ₂ CH ₃ SO ₂ Me	Me	N
XVIII-60	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SMe	Me	N
XVIII-61	CH ₂ CH ₃ CH ₂ SOMe	Me	N
XVIII-62	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	N
XVIII-63	CH ₂ CH(Me)SMe	Me	N
XVIII-64	CH ₂ CH(Me)SOMe	Me	N
XVIII-65	CH ₂ CH ₃ SiMe ₃	Me	N
XVIII-66	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	Me	N
XVIII-67	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	Me	N

[0180]

[表120]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVIII-68	Ph	Me	N
XVIII-69	Ph(2-Cl)	Me	N
XVIII-70	Ph(3-Cl)	Me	N
XVIII-71	Ph(4-Cl)	Me	N
XVIII-72	Ph(2-F)	Me	N
XVIII-73	Ph(3-F)	Me	N
XVIII-74	Ph(4-F)	Me	N
XVIII-75	Ph(2-Me)	Me	N
XVIII-76	Ph(3-Me)	Me	N
XVIII-77	Ph(4-Me)	Me	N
XVIII-78	Ph(2-OMe)	Me	N
XVIII-79	Ph(3-OMe)	Me	N
XVIII-80	Ph(4-OMe)	Me	N
XVIII-81	Ph(2-OCF ₃)	Me	N
XVIII-82	Ph(3-OCF ₃)	Me	N
XVIII-83	Ph(4-OCF ₃)	Me	N
XVIII-84	Ph(2-OCHF ₂)	Me	N
XVIII-85	Ph(3-OCHF ₂)	Me	N
XVIII-86	Ph(4-OCHF ₂)	Me	N
XVIII-87	Ph(2-CF ₃)	Me	N
XVIII-88	Ph(3-CF ₃)	Me	N
XVIII-89	Ph(4-CF ₃)	Me	N
XVIII-90	Ph(2-NO ₂)	Me	N
XVIII-91	Ph(3-NO ₂)	Me	N
XVIII-92	Ph(4-NO ₂)	Me	N
XVIII-93	Ph(2-CN)	Me	N
XVIII-94	Ph(3-CN)	Me	N
XVIII-95	Ph(4-CN)	Me	N
XVIII-96	Ph(3-Bu ^t)	Me	N
XVIII-97	Ph(3,5-di-Me)	Me	N
XVIII-98	Ph(3,5-di-F)	Me	N
XVIII-99	Ph(2-Cl-6-F)	Me	N
XVIII-100		Me	N

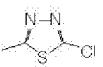
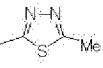
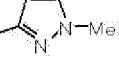
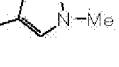
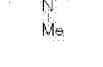
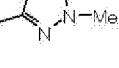
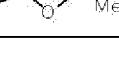
[0181]

[表121]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVIII-101	CH ₂ Ph	Me	N
XVIII-102	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	N
XVIII-103	CH ₂ CH=CHPh	Me	N
XVIII-104	CH ₂ C≡CPh	Me	N
XVIII-105	CH ₂ CH=NOMe	Me	N
XVIII-106	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	N
XVIII-107	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	N
XVIII-108	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	N
XVIII-109	CH ₂ CH=NOPr-i	Me	N
XVIII-110	CH ₂ C(Me)=NOPr-i	Me	N
XVIII-111	CH ₂ C(Me)=NOBu-t	Me	N
XVIII-112		Me	N
XVIII-113		Me	N
XVIII-114		Me	N
XVIII-115		Me	N
XVIII-116		Me	N
XVIII-117		Me	N
XVIII-118		Me	N
XVIII-119		Me	N
XVIII-120		Me	N
XVIII-121		Me	N

[0182]

[表122]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVIII-122		Me	N
XVIII-123		Me	N
XVIII-124		Me	N
XVIII-125		Me	N
XVIII-126		Me	N
XVIII-127		Me	N
XVIII-128		Me	N
XVIII-129		Me	N
XVIII-130		Me	N
XVIII-131		Me	N

[0183]

[表123]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVIII-132		Me	N
XVIII-133		Me	N
XVIII-134		Me	N
XVIII-135		Me	N
XVIII-136		Me	N
XVIII-137		Me	N
XVIII-138		Me	N
XVIII-139		Me	N
XVIII-140		Me	N
XVIII-141		Me	N
XVIII-142		Me	N
XVIII-143		Me	N
XVIII-144		Me	N
XVIII-145		Me	N

[0184]

[表124]

化合物番号	X ¹⁰	X ¹¹	W
XVIII-146	Me	Et	N
XVIII-147	Et	Et	N
XVIII-148	Pr-n	Et	N
XVIII-149	Pri	Et	N
XVIII-150	Bu-n	Et	N
XVIII-151	Bu-i	Et	N
XVIII-152	Bu-s	Et	N
XVIII-153	Bu-t	Et	N
XVIII-154	Pen-n	Et	N
XVIII-155	Pen-i	Et	N
XVIII-156	Pen-neo	Et	N
XVIII-157	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	N
XVIII-158	Ph	Et	N
XVIII-159	Ph(2-F)	Et	N
XVIII-160	Ph(3-F)	Et	N
XVIII-161	Ph(4-F)	Et	N
XVIII-162	Ph(2-Me)	Et	N
XVIII-163	Ph(3-Me)	Et	N
XVIII-164	Ph(4-Me)	Et	N
XVIII-165	Me	Me	CH
XVIII-166	Et	Me	CH
XVIII-167	Pr-n	Me	CH
XVIII-168	Pri	Me	CH
XVIII-169	Bu-n	Me	CH
XVIII-170	Bu-i	Me	CH
XVIII-171	Bu-s	Me	CH
XVIII-172	Bu-t	Me	CH
XVIII-173	Pen-n	Me	CH
XVIII-174	Pen-i	Me	CH
XVIII-175	Pen-neo	Me	CH
XVIII-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	CH
XVIII-177	Ph	Me	CH
XVIII-178	Ph(2-F)	Me	CH
XVIII-179	Ph(3-F)	Me	CH
XVIII-180	Ph(4-F)	Me	CH
XVIII-181	Ph(2-Me)	Me	CH
XVIII-182	Ph(3-Me)	Me	CH
XVIII-183	Ph(4-Me)	Me	CH

[0185]

[表125]

化合物番号	X ¹	R	
XIX-1	Pri	Pr-n	
XIX-2	Bu-n	Pr-n	
XIX-3	Bu-i	Pr-n	
XIX-4	Bu-s	Pr-n	
XIX-5	But	Pr-n	
XIX-6	Pen-n	Pr-n	
XIX-7	Pen-i	Pr-n	
XIX-8	Pen-neo	Pr-n	
XIX-9	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Pr-n	
XIX-10	CH ₂ Pr-e	Pr-n	
XIX-11	Ph	Pr-n	
XIX-12	Ph(2-F)	Pr-n	
XIX-13	Ph(3-F)	Pr-n	
XIX-14	Ph(4-F)	Pr-n	
XIX-15	Ph(2-Me)	Pr-n	
XIX-16	Ph(3-Me)	Pr-n	
XIX-17	Ph(4-Me)	Pr-n	
XIX-18	Pri	But	
XIX-19	Bu-n	But	
XIX-20	Bu-i	But	
XIX-21	Bu-s	But	
XIX-22	But	But	
XIX-23	Pen-n	But	
XIX-24	Pen-i	But	
XIX-25	Pen-neo	But	
XIX-26	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	But	
XIX-27	CH ₂ Pr-e	But	
XIX-28	Ph	But	
XIX-29	Ph(2-F)	But	
XIX-30	Ph(3-F)	But	
XIX-31	Ph(4-F)	But	
XIX-32	Ph(2-Me)	But	
XIX-33	Ph(3-Me)	But	
XIX-34	Ph(4-Me)	But	

[0186]

[表126]

化合物番号	X ¹	R
XIX-35	Pri	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-36	Burn	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-37	Bui	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-38	Bu-s	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-39	But	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-40	Pen-n	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-41	Pen-i	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-42	Pen-neo	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-43	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-44	CH ₂ Pr-c	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-45	Ph	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-46	Ph(2-F)	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-47	Ph(3-F)	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-48	Ph(4-F)	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-49	Ph(2-Me)	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-50	Ph(3-Me)	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-51	Ph(4-Me)	CH ₂ CH=CH ₂
XIX-52	Pri	CH ₂ C≡CH
XIX-53	Burn	CH ₂ C≡CH
XIX-54	Bui	CH ₂ C≡CH
XIX-55	Bu-s	CH ₂ C≡CH
XIX-56	But	CH ₂ C≡CH
XIX-57	Pen-n	CH ₂ C≡CH
XIX-58	Pen-i	CH ₂ C≡CH
XIX-59	Pen-neo	CH ₂ C≡CH
XIX-60	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	CH ₂ C≡CH
XIX-61	CH ₂ Pr-c	CH ₂ C≡CH

[0187]

[表127]

化合物番号	X ¹	R
XIX-62	Ph	CH ₂ C≡CH
XIX-63	Ph(2-F)	CH ₂ C≡CH
XIX-64	Ph(3-F)	CH ₂ C≡CH
XIX-65	Ph(4-F)	CH ₂ C≡CH
XIX-66	Ph(2-Me)	CH ₂ C≡CH
XIX-67	Ph(3-Me)	CH ₂ C≡CH
XIX-68	Ph(4-Me)	CH ₂ C≡CH
XIX-69	Pr-i	CH ₂ CF ₃
XIX-70	Bu-n	CH ₂ CF ₃
XIX-71	Bu-i	CH ₂ CF ₃
XIX-72	Bu-s	CH ₂ CF ₃
XIX-73	Bu-t	CH ₂ CF ₃
XIX-74	Pen-n	CH ₂ CF ₃
XIX-75	Pen-i	CH ₂ CF ₃
XIX-76	Pen-neo	CH ₂ CF ₃
XIX-77	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	CH ₂ CF ₃
XIX-78	CH ₂ Pr-c	CH ₂ CF ₃
XIX-79	Ph	CH ₂ CF ₃
XIX-80	Ph(2-F)	CH ₂ CF ₃
XIX-81	Ph(3-F)	CH ₂ CF ₃
XIX-82	Ph(4-F)	CH ₂ CF ₃
XIX-83	Ph(2-Me)	CH ₂ CF ₃
XIX-84	Ph(3-Me)	CH ₂ CF ₃
XIX-85	Ph(4-Me)	CH ₂ CF ₃
XIX-86	CH ₂ Pr-c	Bu-s
XIX-87	Ph(2-F)	CH ₂ CH ₂ OEt
XIX-88	Ph(3-F)	CH ₂ CH ₂ OMe
XIX-89	Ph(3-F)	CH ₂ CH ₂ OEt
XIX-90	Ph(3-F)	CH ₂ (CH ₂) ₂ OMe
XIX-91	CH ₂ CH ₂ CMe ₃	CH ₂ CH ₂ OEt

[0188]

[表128]

化合物番号	X ³	X ⁴	R
XX-1	Pr <i>i</i>	Me	Pr <i>n</i>
XX-2	Bu <i>n</i>	Me	Pr <i>n</i>
XX-3	Bu <i>i</i>	Me	Pr <i>n</i>
XX-4	Bu <i>s</i>	Me	Pr <i>n</i>
XX-5	Bu <i>t</i>	Me	Pr <i>n</i>
XX-6	Pen <i>n</i>	Me	Pr <i>n</i>
XX-7	Pen <i>i</i>	Me	Pr <i>n</i>
XX-8	Pen <i>neo</i>	Me	Pr <i>n</i>
XX-9	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	Pr <i>n</i>
XX-10	CH ₂ Pr <i>c</i>	Me	Pr <i>n</i>
XX-11	Ph	Me	Pr <i>n</i>
XX-12	Ph(2-F)	Me	Pr <i>n</i>
XX-13	Ph(3-F)	Me	Pr <i>n</i>
XX-14	Ph(4-F)	Me	Pr <i>n</i>
XX-15	Ph(2-Me)	Me	Pr <i>n</i>
XX-16	Ph(3-Me)	Me	Pr <i>n</i>
XX-17	Ph(4-Me)	Me	Pr <i>n</i>
XX-18	Pr <i>i</i>	Me	Bu <i>t</i>
XX-19	Bu <i>n</i>	Me	Bu <i>t</i>
XX-20	Bu <i>i</i>	Me	Bu <i>t</i>
XX-21	Bu <i>s</i>	Me	Bu <i>t</i>
XX-22	Bu <i>t</i>	Me	Bu <i>t</i>
XX-23	Pen <i>n</i>	Me	Bu <i>t</i>
XX-24	Pen <i>i</i>	Me	Bu <i>t</i>
XX-25	Pen <i>neo</i>	Me	Bu <i>t</i>
XX-26	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	Bu <i>t</i>
XX-27	CH ₂ Pr <i>c</i>	Me	Bu <i>t</i>
XX-28	Ph	Me	Bu <i>t</i>
XX-29	Ph(2-F)	Me	Bu <i>t</i>
XX-30	Ph(3-F)	Me	Bu <i>t</i>
XX-31	Ph(4-F)	Me	Bu <i>t</i>
XX-32	Ph(2-Me)	Me	Bu <i>t</i>
XX-33	Ph(3-Me)	Me	Bu <i>t</i>
XX-34	Ph(4-Me)	Me	Bu <i>t</i>

[0189]

[表129]

化合物番号	X ³	X ⁴	R
XX-35	Pr-i	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-36	Bu-n	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-37	Bu-i	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-38	Bu-s	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-39	But	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-40	Pen-n	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-41	Pen-i	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-42	Pen-neo	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-43	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-44	CH ₂ Pr-c	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-45	Ph	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-46	Ph(2-F)	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-47	Ph(3-F)	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-48	Ph(4-F)	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-49	Ph(2-Me)	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-50	Ph(3-Me)	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-51	Ph(4-Me)	Me	CH ₂ CH=CH ₂
XX-52	Pr-i	Me	CH ₂ C≡CH
XX-53	Bu-n	Me	CH ₂ C≡CH
XX-54	Bu-i	Me	CH ₂ C≡CH
XX-55	Bu-s	Me	CH ₂ C≡CH
XX-56	But	Me	CH ₂ C≡CH
XX-57	Pen-n	Me	CH ₂ C≡CH
XX-58	Pen-i	Me	CH ₂ C≡CH
XX-59	Pen-neo	Me	CH ₂ C≡CH
XX-60	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	CH ₂ C≡CH
XX-61	CH ₂ Pr-c	Me	CH ₂ C≡CH
XX-62	Ph	Me	CH ₂ C≡CH
XX-63	Ph(2-F)	Me	CH ₂ C≡CH
XX-64	Ph(3-F)	Me	CH ₂ C≡CH
XX-65	Ph(4-F)	Me	CH ₂ C≡CH
XX-66	Ph(2-Me)	Me	CH ₂ C≡CH
XX-67	Ph(3-Me)	Me	CH ₂ C≡CH
XX-68	Ph(4-Me)	Me	CH ₂ C≡CH

[0190]

[表130]

化合物番号	X ³	X ⁴	R
XX-69	Pr-i	Me	CH ₂ CF ₃
XX-70	Bu-n	Me	CH ₂ CF ₃
XX-71	Bu-i	Me	CH ₂ CF ₃
XX-72	Bu-s	Me	CH ₂ CF ₃
XX-73	But	Me	CH ₂ CF ₃
XX-74	Pen-n	Me	CH ₂ CF ₃
XX-75	Pen-i	Me	CH ₂ CF ₃
XX-76	Pen-neo	Me	CH ₂ CF ₃
XX-77	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	Me	CH ₂ CF ₃
XX-78	CH ₂ Pr-c	Me	CH ₂ CP ₃
XX-79	Ph	Me	CH ₂ CF ₃
XX-80	Ph(2-F)	Me	CH ₂ CF ₃
XX-81	Ph(3-F)	Me	CH ₂ CF ₃
XX-82	Ph(4-F)	Me	CH ₂ CF ₃
XX-83	Ph(2-Me)	Me	CH ₂ CF ₃
XX-84	Ph(3-Me)	Me	CH ₂ CF ₃
XX-85	Ph(4-Me)	Me	CH ₂ CF ₃
XX-86	Ph(3-F)	Me	CH ₂ CH ₂ OMe
XX-87	Ph(3-F)	Me	CH ₂ CH ₂ OEt
XX-88	Ph(4-F)	Me	CH ₂ CH ₂ OMe
XX-89	Ph(4-F)	Me	CH ₂ CH ₂ OEt

[0191]

[表131]

化合物番号	X^6		
		R	
XXI-1	Pr-i	Pr-n	
XXI-2	Bu-n	Pr-n	
XXI-3	Bu-i	Pr-n	
XXI-4	Bu-s	Pr-n	
XXI-5	Bu-t	Pr-n	
XXI-6	Pen-n	Pr-n	
XXI-7	Pen-i	Pr-n	
XXI-8	Pen-neo	Pr-n	
XXI-9	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$	Pr-n	
XXI-10	$\text{CH}_2\text{Pr-c}$	Pr-n	
XXI-11	Ph	Pr-n	
XXI-12	Ph(2-F)	Pr-n	
XXI-13	Ph(3-F)	Pr-n	
XXI-14	Ph(4-F)	Pr-n	
XXI-15	Ph(2-Me)	Pr-n	
XXI-16	Ph(3-Me)	Pr-n	
XXI-17	Ph(4-Me)	Pr-n	
XXI-18	Pr-i	Bu-t	
XXI-19	Bu-n	Bu-t	
XXI-20	Bu-i	Bu-t	
XXI-21	Bu-s	Bu-t	
XXI-22	Bu-t	Bu-t	
XXI-23	Pen-n	Bu-t	
XXI-24	Pen-i	Bu-t	
XXI-25	Pen-neo	Bu-t	
XXI-26	$\text{CH}_2(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{Me})_2$	Bu-t	
XXI-27	$\text{CH}_2\text{Pr-c}$	Bu-t	
XXI-28	Ph	Bu-t	
XXI-29	Ph(2-F)	Bu-t	
XXI-30	Ph(3-F)	Bu-t	
XXI-31	Ph(4-F)	Bu-t	
XXI-32	Ph(2-Me)	Bu-t	
XXI-33	Ph(3-Me)	Bu-t	
XXI-34	Ph(4-Me)	Bu-t	

[0192]

[表132]

化合物番号	X ⁶	R
XXI-35	Pr-i	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-36	Bu-n	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-37	Bu-i	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-38	Bu-s	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-39	Bu-t	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-40	Pen-n	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-41	Pen-i	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-42	Pen-neo	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-43	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-44	CH ₂ Pr-c	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-45	Ph	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-46	Ph(2-F)	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-47	Ph(3-F)	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-48	Ph(4-F)	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-49	Ph(2-Me)	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-50	Ph(3-Me)	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-51	Ph(4-Me)	CH ₂ CH=CH ₂
XXI-52	Pr-i	CH ₂ C≡CH
XXI-53	Bu-n	CH ₂ C≡CH
XXI-54	Bu-i	CH ₂ C≡CH
XXI-55	Bu-s	CH ₂ C≡CH
XXI-56	Bu-t	CH ₂ C≡CH
XXI-57	Pen-n	CH ₂ C≡CH
XXI-58	Pen-i	CH ₂ C≡CH
XXI-59	Pen-neo	CH ₂ C≡CH
XXI-60	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	CH ₂ C≡CH
XXI-61	CH ₂ Pr-c	CH ₂ C≡CH
XXI-62	Ph	CH ₂ C≡CH
XXI-63	Ph(2-F)	CH ₂ C≡CH
XXI-64	Ph(3-F)	CH ₂ C≡CH
XXI-65	Ph(4-F)	CH ₂ C≡CH
XXI-66	Ph(2-Me)	CH ₂ C≡CH
XXI-67	Ph(3-Me)	CH ₂ C≡CH
XXI-68	Ph(4-Me)	CH ₂ C≡CH

[0193]

[表133]

化合物番号	X ⁶	R
XXI-69	Pr-i	CH ₂ CF ₃
XXI-70	Bu-n	CH ₂ CF ₃
XXI-71	Bu-i	CH ₂ CF ₃
XXI-72	Bu-s	CH ₂ CF ₃
XXI-73	Bu-t	CH ₂ CF ₃
XXI-74	Pen-n	CH ₂ CF ₃
XXI-75	Pen-i	CH ₂ CF ₃
XXI-76	Pen-neo	CH ₂ CF ₃
XXI-77	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH(Me) ₂	CH ₂ CF ₃
XXI-78	CH ₂ Pr-c	CH ₂ CF ₃
XXI-79	Ph	CH ₂ CF ₃
XXI-80	Ph(2-F)	CH ₂ CF ₃
XXI-81	Ph(3-F)	CH ₂ CF ₃
XXI-82	Ph(4-F)	CH ₂ CF ₃
XXI-83	Ph(2-Me)	CH ₂ CF ₃
XXI-84	Ph(3-Me)	CH ₂ CF ₃
XXI-85	Ph(4-Me)	CH ₂ CF ₃

[0194]

[表134]

化合物番号	X ¹	R	R'		
				5	3 R'
XXII-1	Pen-i	Me	5-SH		
XXII-2	Pen-neo	Me	5-SH		
XXII-3	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	5-SH		
XXII-4	CH ₂ Pr-c	Me	5-SH		
XXII-5	Ph(3-F)	Me	5-SH		
XXII-6	Ph(3-Me)	Me	5-SH		
XXII-7	Pen-i	Et	5-SH		
XXII-8	Pen-neo	Et	5-SH		
XXII-9	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	5-SH		
XXII-10	CH ₂ Pr-c	Et	5-SH		
XXII-11	Ph(3-F)	Et	5-SH		
XXII-12	Ph(3-Me)	Et	5-SH		
XXII-13	Pen-i	Pri	5-SH		
XXII-14	Pen-neo	Pri	5-SH		
XXII-15	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	5-SH		
XXII-16	CH ₂ Pr-c	Pri	5-SH		
XXII-17	Ph(3-F)	Pri	5-SH		
XXII-18	Ph(3-Me)	Pri	5-SH		
XXII-19	Pen-i	Me	5-SMe		
XXII-20	Pen-neo	Me	5-SMe		
XXII-21	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	5-SMe		
XXII-22	CH ₂ Pr-c	Me	5-SMe		
XXII-23	Ph(3-F)	Me	5-SMe		
XXII-24	Ph(3-Me)	Me	5-SMe		
XXII-25	Pen-i	Et	5-SMe		
XXII-26	Pen-neo	Et	5-SMe		
XXII-27	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	5-SMe		
XXII-28	CH ₂ Pr-c	Et	5-SMe		
XXII-29	Ph(3-F)	Et	5-SMe		
XXII-30	Ph(3-Me)	Et	5-SMe		
XXII-31	Pen-i	Pri	5-SMe		
XXII-32	Pen-neo	Pri	5-SMe		
XXII-33	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	5-SMe		
XXII-34	CH ₂ Pr-c	Pri	5-SMe		

[0195]

[表135]

化合物番号	X ¹	R	R'
XXII-35	Ph(3-F)	Pri	5-SMe
XXII-36	Ph(3-Me)	Pri	5-SMe
XXII-37	Pen-i	Pri	5-OH
XXII-38	Pen-neo	Pri	5-OH
XXII-39	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	5-OH
XXII-40	CH ₂ Pr-c	Pri	5-OH
XXII-41	Ph(3-F)	Pri	5-OH
XXII-42	Ph(3-Me)	Pri	5-OH
XXII-43	Pen-i	Pri	5-CN
XXII-44	Pen-neo	Pri	5-CN
XXII-45	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	5-CN
XXII-46	CH ₂ Pr-c	Pri	5-CN
XXII-47	Pen-i	Pri	5-Cl
XXII-48	Pen-neo	Pri	5-Cl
XXII-49	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	5-Cl
XXII-50	CH ₂ Pr-c	Pri	5-Cl
XXII-51	Pen-i	Pri	5-CHO
XXII-52	Pen-neo	Pri	5-CHO
XXII-53	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	5-CHO
XXII-54	CH ₂ Pr-c	Pri	5-CHO
XXII-55	Pen-i	Pri	5-CH=NOH
XXII-56	Pen-neo	Pri	5-CH=NOH
XXII-57	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	5-CH=NOH
XXII-58	CH ₂ Pr-c	Pri	5-CH=NOH
XXII-59	Pen-i	Pri	5-OMe
XXII-60	Pen-neo	Pri	5-OMe
XXII-61	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	5-OMe
XXII-62	CH ₂ Pr-c	Pri	5-OMe
XXII-63	Pen-i	Pri	5-Me
XXII-64	Pen-neo	Pri	5-Me
XXII-65	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	5-Me
XXII-66	CH ₂ Pr-c	Pri	5-Me
XXII-67	Ph(3-F)	Et	3-NO ₂

[0196] [表136]

化合物番号	X ¹	R	R'
XXII-68	Ph(3-F)	Me	3-SMe
XXII-69	Ph(3-F)	Me	3-SOMe
XXII-70	Ph(3-F)	Me	3-SO ₂ Me
XXII-71	Pen-2	Pri	3-SH
XXII-72		Pri	5-SH
XXII-73		Me	5-SH
XXII-74	Ph(2-F)	CH ₂ CH ₂ OEt	5-SH
XXII-75	Ph(3-F)	CH ₂ (CH ₂) ₂ OMe	5-SH
XXII-76	Ph(3-F)	Me	5-CN

[0197] [表137]

化合物番号	X ¹	R	R'
XXIII-1	Pen-i	Me	2-SH
XXIII-2	Pen-neo	Me	2-SH
XXIII-3	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	2-SH
XXIII-4	CH ₂ Pr-c	Me	2-SH
XXIII-5	Ph(3-F)	Me	2-SH
XXIII-6	Ph(3-Me)	Me	2-SH
XXIII-7	Pen-i	Et	2-SH
XXIII-8	Pen-neo	Et	2-SH
XXIII-9	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	2-SH
XXIII-10	CH ₂ Pr-c	Et	2-SH
XXIII-11	Ph(3-F)	Et	2-SH
XXIII-12	Ph(3-Me)	Et	2-SH
XXIII-13	Pen-i	Pr-i	2-SH
XXIII-14	Pen-neo	Pr-i	2-SH
XXIII-15	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pr-i	2-SH
XXIII-16	CH ₂ Pr-c	Pr-i	2-SH
XXIII-17	Ph(3-F)	Pr-i	2-SH
XXIII-18	Ph(3-Me)	Pr-i	2-SH
XXIII-19	Pen-i	Me	2-SMe
XXIII-20	Pen-neo	Me	2-SMe
XXIII-21	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	2-SMe
XXIII-22	CH ₂ Pr-c	Me	2-SMe
XXIII-23	Ph(3-F)	Me	2-SMe
XXIII-24	Ph(3-Me)	Me	2-SMe
XXIII-25	Pen-i	Et	2-SMe
XXIII-26	Pen-neo	Et	2-SMe
XXIII-27	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Et	2-SMe
XXIII-28	CH ₂ Pr-c	Et	2-SMe
XXIII-29	Ph(3-F)	Et	2-SMe
XXIII-30	Ph(3-Me)	Et	2-SMe
XXIII-31	Pen-i	Pr-i	2-SMe
XXIII-32	Pen-neo	Pr-i	2-SMe
XXIII-33	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pr-i	2-SMe
XXIII-34	CH ₂ Pr-c	Pr-i	2-SMe

[0198]

[表138]

化合物番号	X ¹	R	R'
XXIII-35	Ph(3-F)	Pri	2-SMe
XXIII-36	Ph(3-Me)	Pri	2-SMe
XXIII-37	Pen-i	Pri	2-OH
XXIII-38	Pen-neo	Pri	2-OH
XXIII-39	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	2-OH
XXIII-40	CH ₂ Pr-c	Pri	2-OH
XXIII-41	Ph(3-F)	Pri	2-OH
XXIII-42	Ph(3-Me)	Pri	2-OH
XXIII-43	Pen-i	Pri	2-CN
XXIII-44	Pen-neo	Pri	2-CN
XXIII-45	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	2-CN
XXIII-46	CH ₂ Pr-c	Pri	2-CN
XXIII-47	Pen-i	Pri	2-Cl
XXIII-48	Pen-neo	Pri	2-Cl
XXIII-49	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	2-Cl
XXIII-50	CH ₂ Pr-c	Pri	2-Cl
XXIII-51	Pen-i	Pri	2-CHO
XXIII-52	Pen-neo	Pri	2-CHO
XXIII-53	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	2-CHO
XXIII-54	CH ₂ Pr-c	Pri	2-CHO
XXIII-55	Pen-i	Pri	2-CH=NOH
XXIII-56	Pen-neo	Pri	2-CH=NOH
XXIII-57	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	2-CH=NOH
XXIII-58	CH ₂ Pr-c	Pri	2-CH=NOH
XXIII-59	Pen-i	Pri	2-OMe
XXIII-60	Pen-neo	Pri	2-OMe
XXIII-61	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	2-OMe
XXIII-62	CH ₂ Pr-c	Pri	2-OMe
XXIII-63	Pen-i	Pri	2-Me
XXIII-64	Pen-neo	Pri	2-Me
XXIII-65	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Pri	2-Me
XXIII-66	CH ₂ Pr-c	Pri	2-Me
XXIII-67	Ph(3-F)	Et	4-NO ₂

[0199] [表139]

化合物番号	X ¹	R	R'
XXIII-68	Ph(3-F)	Me	4-SMe
XXIII-69	Ph(3-F)	Me	4-SOMe
XXIII-70	Ph(3-F)	Me	4-SO ₂ Me
XXIII-71	Pen-2	Pri	3-SH
XXIII-72		Pri	2-SH
XXIII-73		Me	2-SH
XXIII-74	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Et	2-CH=NOH
XXIII-75	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Et	2-CN
XXIII-76	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Et	2-CHO

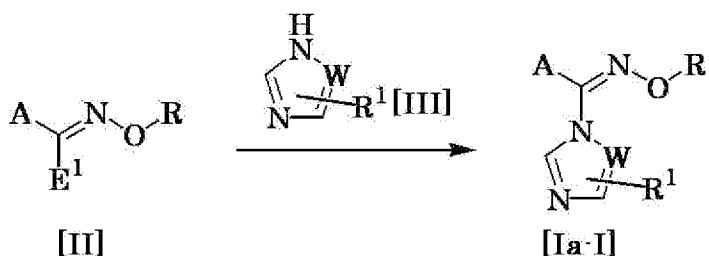
[0200] 一般式 [I] で表される本発明化合物は、以下に示す製造法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

[0201] 以下、例えば「一般式 [I-I] で表される化合物」、「式 [I-I] で表される化合物」、「化合物 [I-I]」は同意とする。

[0202] [製造方法 1]

一般式 [I] で表される本発明化合物のうち、R' が R¹ で表わされる一般式 [Ia-I] で表される化合物は、例えば以下の方法に従って製造することができる。

[0203] [化3]



[0204] (式中、A、R及びWは前記と同じ意味を表し、R¹は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシル基、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、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を表し、E¹は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メタンスルホニル基、メタンスルホニルオキシ基又はトリフルオロメタンスルホニルオキシ基等の脱離基を表す。)

[0205] 化合物 [Ia-I] は、化合物 [II] と化合物 [III] とを、溶媒中、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

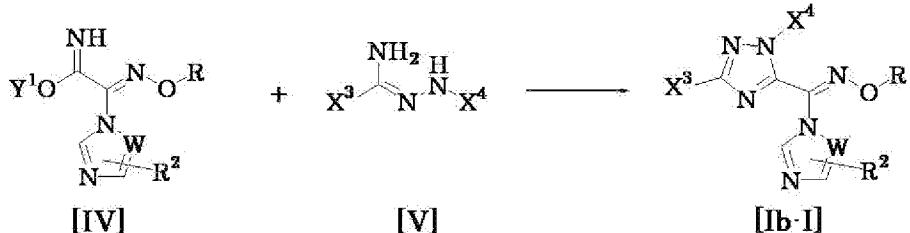
[0206] 本反応で用いられる化合物 [III] の使用量は、化合物 [II] 1当量に対して通常、1～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～2当量である。

[0207] 反応に使用できる溶媒としては、例えばジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン若しくはN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジ

メチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類；アセトニトリル若しくはプロピオニトリル等のニトリル類；ヘキサン若しくはヘプタン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン若しくはキシレン等の芳香族炭化水素類；1, 2-ジクロロエタン若しくはクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；又はこれらの混合物が挙げられる。溶媒の量は、化合物 [I I] 1モルに対して通常、0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。

- [0208] 本反応で使用できる塩基は、例えば水酸化ナトリウム若しくは水酸化カリウム等のアルカリ金属の水酸化物類、炭酸ナトリウム若しくは炭酸カリウム等のアルカリ金属の炭酸塩類、炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸水素カリウム等のアルカリ金属の重炭酸塩類等の無機塩基類；水素化ナトリウム若しくは水素化カリウム等の金属水素化物類；又はトリエチルアミン若しくは1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン等の有機塩基類等が挙げられる。塩基の使用量は、化合物 [I I] 1当量に対して通常1～10当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～5当量である。
- [0209] 本反応の反応温度は通常、-20°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは-10°C～100°Cの温度の範囲である。
- [0210] 本反応の反応時間は、反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～48時間の範囲である。
- [0211] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物 [I a-I] を単離することができる。単離した化合物 [I a-I] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等により更に精製することもできる。
- [0212] [製造方法2]
- [0213] 一般式 [I] で表される本発明化合物のうち、AがA²である式 [I b-I] で表される化合物は、例えば以下の方法に従って製造することができる。
- [0214]

[化4]



- [0215] (式中、 X^3 、 X^4 、R及びWは前記と同じ意味を表し、 Y^1 はC₁～C₄アルキル基を表し、R²は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、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を表す。)
- [0216] 化合物[Ib-I]は、化合物[IV]と化合物[V]とを、溶媒中、酸の存在下で反応させることにより製造することができる。
- [0217] 本反応で用いられる化合物[V]の使用量は、化合物[IV]1当量に対して通常、1～3当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～2当量である。
- [0218] 本反応で使用する化合物[V]及び[IV]は塩酸塩等の塩を用いてもよく、その場合、中和させるためにナトリウムメトキシド等のアルコールの金属塩類又はトリエチルアミン等の有機塩基類等を用いてもよい。
- [0219] 本反応で使用できる溶媒は、例えばジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；メタノール、エタノール若しくはプロパノール等のアルコール類；又はこれらの混合物が挙げられる。溶媒の量は、化合物[IV]1モルに対して通常0.1～10リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。
- [0220] 本反応で使用できる酸は、例えば酢酸、トリフルオロ酢酸等の脂肪族カルボン酸類等が挙げられる。酸の使用量は、化合物[IV]1当量に対して通常1～10当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～5当量である。
- [0221] 本反応の反応温度は通常、0°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは10～120°Cの温度の範囲である。

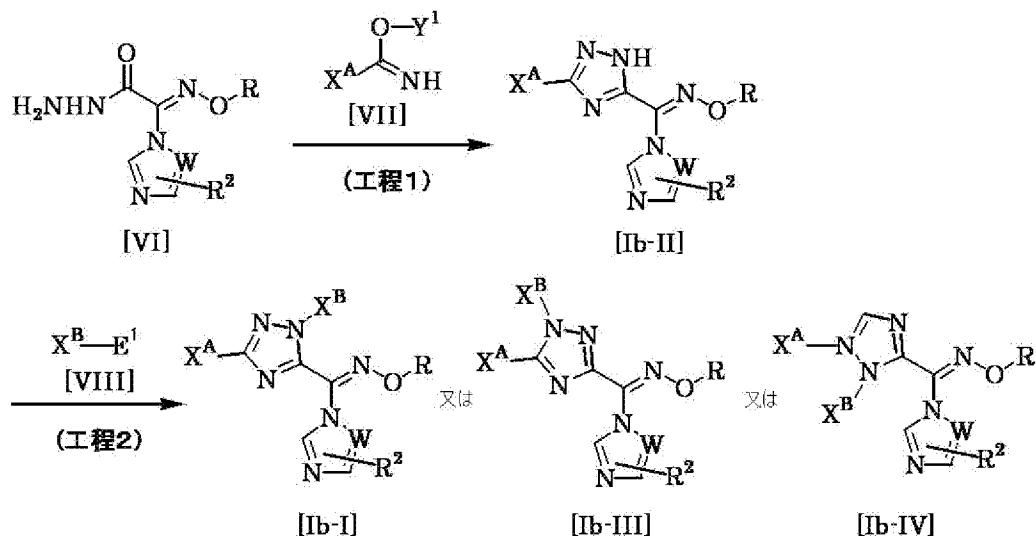
[0222] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～48時間の範囲である。

[0223] 反応終了後は、反応混合物を濃縮する等の操作を行うことにより、化合物[Ib-I]を単離することができる。単離した化合物[Ib-I]は、必要に応じて再結晶等により更に精製することもできる。

[0224] [製造方法3]

一般式[Ib-I]、[Ib-II]、[Ib-III]及び[Ib-IV]で表される化合物は以下の反応式からなる方法で製造することもできる。

[0225] [化5]



[0226] (式中、 X^A は X^3 、 X^5 又は X^{10} を表し、 X^B は X^4 、 X^6 又は X^{11} を表し、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^{10} 、 X^{11} 、R、 R^2 、W、E¹及びY¹は前記と同じ意味を表す。)

[0227] (工程1)

化合物[VII]と化合物[VIII]とを、溶媒中で反応させることにより、一般式[Ib-II]の化合物を製造することができる。

[0228] 本反応で用いられる化合物[VIII]の使用量は、化合物[VII]1当量に対して通常、1～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～2当量である。

[0229] 本反応で用いられる化合物[VIII]は塩酸塩等の塩を用いてもよく、そ

の場合、中和させるためにナトリウムメトキシド等のアルコールの金属塩類；酢酸ナトリウム又は酢酸カリウム等の酢酸塩基類；或いはトリエチルアミン等の有機塩基類等を用いてもよい。又、それらの使用量は過剰に用いてもよく、好ましくは1～10当量である。

[0230] 本反応で使用できる溶媒は、例えばメタノール、エタノール若しくはプロパノール等のアルコール類；ジエチルエーテル、1，2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；N，N-ジメチルアセトアミド、N，N-ジメチルホルムアミド、1，3-ジメチル-2-イミダゾリジノン若しくはN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類；アセトニトリル若しくはプロピオニトリル等のニトリル類；又はこれらの混合物が挙げられる。溶媒の量は、化合物[V I] 1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。

[0231] 本反応の反応温度は通常、室温から反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは50°C～100°Cの温度の範囲である。

[0232] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～48時間の範囲である。

[0233] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物[I b-I I]を単離することもできる。単離した化合物[I b-I I]は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0234] (工程2)

化合物[I b-I I]と化合物[V I I I]とを、溶媒中、塩基の存在下に反応させることにより、一般式[I b-I]、[I b-I I I]及び[I b-I V]の化合物を製造することができる。

[0235] 本反応で用いられる化合物[V I I I]の使用量は、化合物[I b-I I]1当量に対して通常、1.0～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.1～2当量である。

[0236] 本反応で使用できる溶媒及び塩基としては、前記〔製造方法1〕と同様のものを挙げることができる。溶媒の量は、化合物〔Ib-II〕1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。塩基の使用量は、化合物〔Ib-II〕1当量に対して通常、1～20当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～10当量である。

[0237] 本反応の反応温度は通常、−50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは−10°C～100°Cの温度の範囲である。

[0238] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～48時間の範囲である。

[0239] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物〔Ib-I〕、〔Ib-IIII〕及び〔Ib-IV〕を得ることができる。更に、カラムクロマトグラフィー等により化合物〔Ib-I〕、〔Ib-IIII〕及び〔Ib-IV〕をそれぞれ単離することができる。

[0240] [製造方法4]

〔製造方法1〕で使用する一般式〔IIa〕の化合物は、以下の反応式からなる方法で製造することができる。

[0241] [化6]



[0242] (式中、A及びRはそれぞれ前記と同じ意味を表し、E²は塩素又は臭素原子を表す。)

[0243] 即ち、一般式〔IX〕の化合物とハロゲン化剤とを、溶媒中で反応させることにより、一般式〔IIa〕の化合物を製造することができる。

[0244] 本反応で使用できるハロゲン化剤としては、五塩化リン、塩化チオニル、或いはトリフェニルホスфин存在下での四塩化炭素又は四臭化炭素等が挙げられる。ハロゲン化剤の使用量は、一般式〔IX〕1モルに対して1.0

～20.0モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～6.0モルである。

[0245] 本反応で使用できる溶媒は、例えばベンゼン若しくはトルエン等の芳香族炭化水素類；クロロホルム若しくは四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；又はアセトニトリル若しくはプロピオニトリル等のニトリル類等が挙げられる。溶媒の量は、化合物 [IX] 1モルに対して通常、0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～10リットルである。

[0246] 本反応の反応温度は通常、−50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは0°C～100°Cの温度の範囲である。

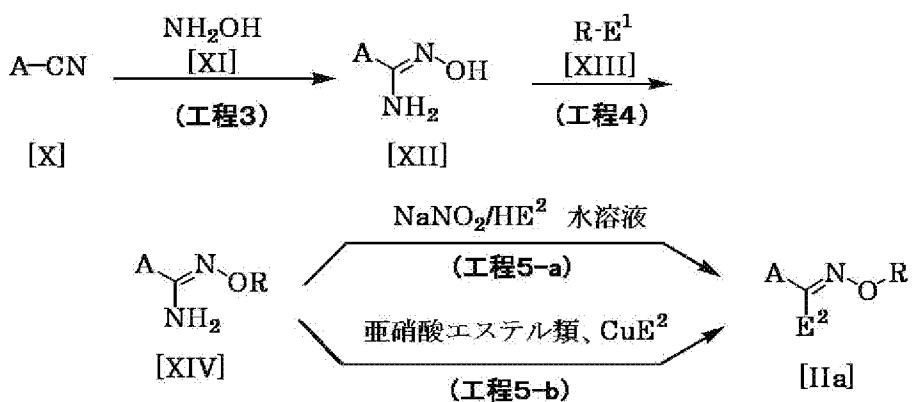
[0247] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～48時間の範囲である。

[0248] 反応終了後は、反応混合物を濃縮或いは水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物 [IIa] を単離することができる。単離した化合物 [IIa] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等により更に精製することもできる。

[0249] [製造方法5]

一般式 [IIa] の化合物は、以下の反応式からなる方法で製造することもできる。

[0250] [化7]



[0251] (式中、A、R、E¹及びE²それぞれ前記と同じ意味を表す。)

[0252] (工程3)

化合物 [X] と化合物 [XI] とを、溶媒中、塩基の存在下で反応させる

ことにより、一般式 [XII] の化合物を製造することができる。

- [0253] 本反応で用いられる化合物 [XI] の使用量は、化合物 [X] 1当量に対して通常、1～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～2当量である。化合物 [XI] は塩酸塩等の塩を用いてもよい。
- [0254] 本反応で使用できる溶媒は、例えば水、メタノール、エタノール若しくはプロパノール等のアルコール類；N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン若しくはN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類；又はこれらの混合物が挙げられる。溶媒の量は、化合物 [X] 1モルに対して、通常0. 1～50リットルであり、好ましくは0. 2～3. 0リットルである。
- [0255] 本反応で使用できる塩基は、例えば酢酸ナトリウム若しくは酢酸カリウム等の酢酸塩基類、水酸化ナトリウム若しくは水酸化カリウム等のアルカリ金属の水酸化物類、炭酸ナトリウム若しくは炭酸カリウム等のアルカリ金属の炭酸塩類、炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸水素カリウム等のアルカリ金属の重炭酸塩類等の無機塩基類；ナトリウムメトキシド若しくはナトリウムエトキシド若しくはカリウムtert-ブトキシド等のアルコールの金属塩類；又はトリエチルアミン若しくは1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン等の有機塩基類等が挙げられる。
- [0256] 塩基の使用量は、化合物 [X] 1当量に対して通常、1～3当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～2. 2当量である。
- [0257] 本反応の反応温度は通常、室温から反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは50°C～100°Cの温度の範囲である。
- [0258] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～24時間の範囲である。
- [0259] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物 [XII] を単離することもできる。単離した化合物 [XII] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等に

より更に精製することもできる。

[0260] (工程4)

化合物[XII]と化合物[XIII]とを、溶媒中、塩基の存在下で反応させることにより、一般式[XIV]の化合物を製造することができる。

[0261] 本反応で用いられる化合物[XIII]の使用量は、化合物[XII]1当量に対して通常、1.0～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.1～2当量である。

[0262] 使用できる溶媒及び塩基としては、前記【製造方法1】で説明した塩基と同様のものを挙げることができる。溶媒の量は、化合物[XII]1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。塩基の使用量は、化合物[XII]1当量に対して通常、1～20当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～10当量である。

[0263] 本反応の反応温度は通常、−50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは−10°C～100°Cの温度の範囲である。

[0264] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～24時間の範囲である。

[0265] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物[XIV]を単離することもできる。単離した化合物[XIV]は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0266] (工程5-a)

化合物[XIV]と亜硝酸ナトリウム(NaNO₂)とを、ハロゲン化水素水溶液中、反応させることにより、化合物[IIa]を製造することができる。

[0267] 本反応で用いられる亜硝酸ナトリウムの使用量は、化合物[XIV]1当量に対して通常、1.0～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.1～2当量である。

[0268] 本反応で用いられるハロゲン化水素水溶液中のハロゲン化水素含量は、化

化合物 [XIV] 1モルに対して、通常2～200当量であり、水溶液の量は好ましくは50～100リットルである。又必要に応じて溶媒を加えてもよい。

[0269] 本反応で使用できる溶媒は、例えば酢酸若しくはトリフルオロ酢酸等の脂肪族カルボン酸類；1, 2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；又はジメチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類が挙げられる。溶媒の量は、化合物 [XIV] 1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。

[0270] 本反応の反応温度は通常、-50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは-10°C～100°Cの温度の範囲である。

[0271] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～24時間の範囲である。

[0272] 反応終了後は、反応混合物を濾過或いは水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物 [IIa] を単離することもできる。単離した化合物 [IIa] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0273] (工程5-b)

化合物 [IIa] は、化合物 [XIV] と亜硝酸エステル類とを、ハロゲン化銅 (II) の存在下、溶媒中で反応させることにより製造することもできる。

[0274] 本反応で用いられるハロゲン化銅 (II) としては、臭化銅 (II) 又は塩化銅 (II) 等が挙げられる。ハロゲン化銅 (II) の使用量は、化合物 [XIV] 1当量に対して通常、1.0～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.1～2当量である。

[0275] 本反応で用いられる亜硝酸エステル類としては、亜硝酸t-ブチル又は亜硝酸アミル等が挙げられる。亜硝酸エステル類の使用量は、化合物 [XIV] 1当量に対して通常、1.0～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.1～2当量である。

[0276] 本反応で使用できる溶媒は、例えばジエチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；N, N-ジメチルアセトアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン若しくはN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類；ベンゼン、トルエン若しくはキシレン等の芳香族炭化水素類；アセトニトリル若しくはプロピオニトリル等のニトリル類；又はこれらの混合物が挙げられる。溶媒の量は、化合物 [XIV] 1モルに対して、通常0. 1～50リットルであり、好ましくは0. 2～3. 0リットルである。

[0277] 本反応の反応温度は通常、−50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは−10°C～100°Cの温度の範囲である。

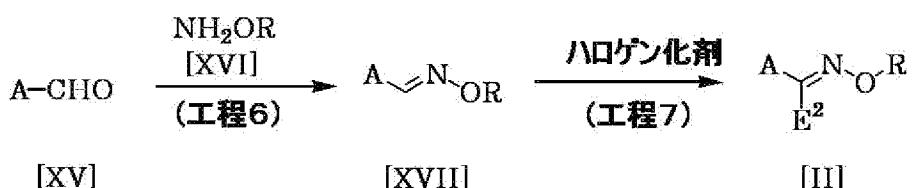
[0278] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～24時間の範囲である。

[0279] 反応終了後は水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物 [IIa] を単離することもできる。単離した化合物 [IIa] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0280] [製造方法 6]

一般式 [IIa] の化合物は以下の反応式からなる方法で製造することもできる。

[0281] [化8]



[0282] (式中、A、R及びE²それぞれ前記と同じ意味を表す。)

[0283] (工程6)

化合物 [XV] と化合物 [XVI] とを、溶媒中、塩基の存在下に反応させることにより、化合物 [XVII] を製造することができる。

- [0284] 本反応で用いられる化合物 [XVI] の使用量は、化合物 [XV] 1当量に対して通常、1.0～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.1～2当量である。又、化合物 [XVI] は塩酸塩又は硫酸塩等の塩を用いてもよい。
- [0285] 本反応で使用できる溶媒及び塩基としては、前記〔製造方法5〕の（工程3）と同様のものを挙げることができる。溶媒の量は、化合物 [XV] 1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。
- [0286] 本反応で用いられる塩基の使用量は、化合物 [XVI] 1当量に対して通常、1～3当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～2.2当量である。
- [0287] 本反応の反応温度は通常、−50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは−10°C～100°Cの温度の範囲である。
- [0288] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～24時間の範囲である。
- [0289] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物 [XVII] を単離することもできる。単離した化合物 [XVII] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。
- [0290] (工程7)
化合物 [XVII] とハロゲン化剤とを、溶媒中で反応させることにより、化合物 [IIa] を製造することができる。
- [0291] 本反応で使用できる溶媒は、例えばジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン若しくはN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類；又は1,2-ジクロロエタン若しくは四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類が挙げられる。溶媒

の量は、化合物 [XVII] 1モルに対して通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～10リットルである。

[0292] 本反応で使用できるハロゲン化剤としては、例えば塩素、臭素、塩化スルフリル、N-クロロコハク酸イミド又はN-ブロモコハク酸イミド等が挙げられる。ハロゲン化剤の使用量は、化合物 [XVII] 1当量に対して通常1～10当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～5当量である。

[0293] 本反応の反応温度は通常、−50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは−10°C～100°Cの温度範囲の範囲である。

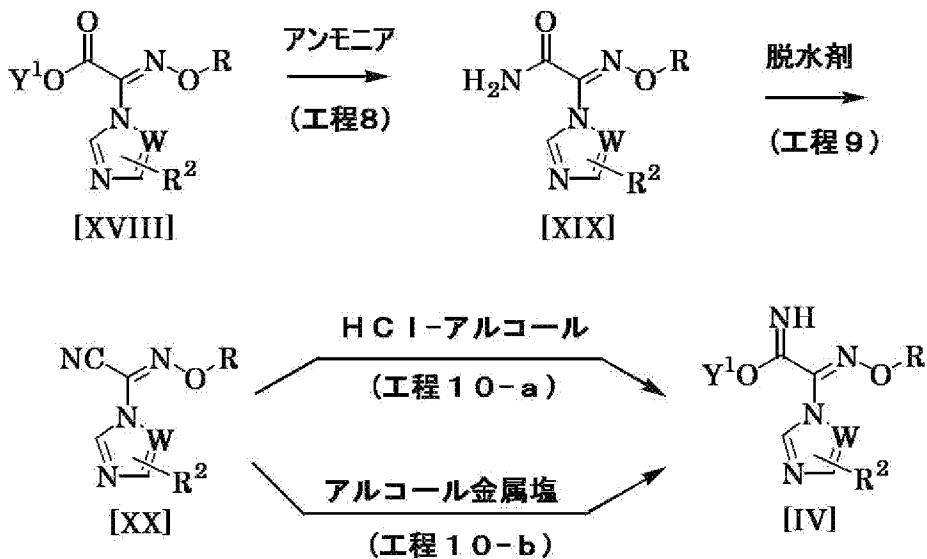
[0294] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～48時間の範囲である。

[0295] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物 [IIa] を単離することができる。又、単離した化合物 [IIa] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等により更に精製することもできる。

[0296] [製造方法7]

[製造方法2] で使用する式 [IV] で表される化合物は、以下の方法に従って製造することができる。

[0297] [化9]



[0298] (式中、R、R²、W及びY¹は前記と同じ意味を表す。)

[0299] (工程8)

化合物[XVIII]とアンモニアとを、溶媒中で反応させることにより、化合物[XIX]を製造することができる。

[0300] 本反応で使用するアンモニアの使用量は、化合物[XVIII]1当量に対して通常、1.0～10当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは2～5当量である。

[0301] 本反応で使用できる溶媒は、例えば水；ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン若しくはN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類；メタノール、エタノール若しくはプロパノール等のアルコール類又はこれらの混合物が挙げられる。溶媒の量は、化合物[XVIII]1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。

[0302] 本反応の反応温度は通常、-50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは-10°C～100°Cの温度の範囲である。

[0303] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～48時間の範囲である。

[0304] 反応終了後は、反応混合物を濃縮、或いは水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物[XIX]を単離することができる。単離した化合物[XIX]は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0305] (工程9)

化合物[XIX]と脱水剤とを、溶媒中で反応させることにより、化合物[XX]を製造することができる。

[0306] 本反応で使用できる溶媒は、例えばジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；N,N-ジメチルア

セトアミド、N、N-ジメチルホルムアミド、1、3-ジメチル-2-イミダゾリジノン若しくはN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類；アセトニトリル若しくはプロピオニトリル等のニトリル類；ベンゼン、トルエン若しくはキシレン等の芳香族炭化水素類；又は1、2-ジクロロエタン若しくはクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類が挙げられる。溶媒の量は、化合物 [XIX] 1モルに対して通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～10リットルである。

[0307] 本反応で使用できる脱水剤は、例えば五酸化リン、五塩化リン、オキシ塩化リン、トリホスゲン、無水トリフルオロ酢酸又は塩化チオニル等が挙げられる。脱水剤の使用量は、化合物 [XIX] 1当量に対して通常1～10当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～5当量である。

[0308] 本反応の反応温度は通常、-50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは-10°C～100°Cの温度範囲の範囲である。

[0309] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～48時間の範囲である。

[0310] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物 [XX] を単離することができる。又、単離した化合物 [XX] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等により更に精製することもできる。

[0311] (工程10-a)

化合物 [XX] と、塩酸ガスを含むメタノール又はエタノール等のアルコール類とを反応させることにより、化合物 [IV] を製造することができる。

[0312] 本反応で用いられる塩酸ガスの使用量は、化合物 [XX] 1当量に対して通常1～10当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～5当量である。又、アルコール類の使用量は、化合物 [XX] 1モルに対して通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～10リットルである。

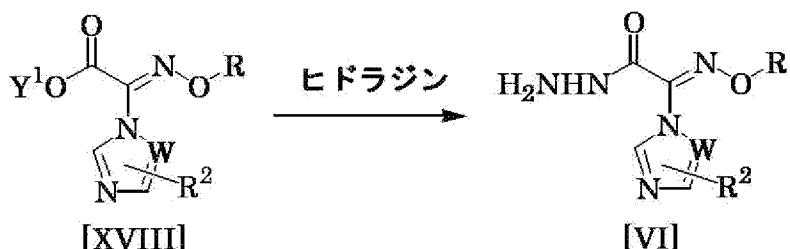
- [0313] 本反応の反応温度は通常、－50°Cから反応系における80°Cまでの任意の温度であり、好ましくは－10°C～50°Cの温度範囲の範囲である。
- [0314] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～48時間の範囲である。
- [0315] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮、乾燥する等の操作を行うことにより、化合物〔IV〕を単離することができる。又、単離した化合物〔IV〕は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等により更に精製することもできる。
- [0316] (工程10-b)
化合物〔IV〕は、化合物〔XX〕とナトリウムメトキシド又はナトリウムエトキシド等のアルコールの金属塩類と、溶媒中で反応させることにより製造することもできる。
- [0317] 本反応で用いられるアルコールの金属塩類の使用量は、化合物〔XX〕1当量に対して通常、触媒量～10当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは0.1～5当量である。
- [0318] 本反応で使用できる溶媒は、例えばジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；ベンゼン、トルエン若しくはキシレン等の芳香族炭化水素類；1,2-ジクロロエタン若しくはクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類；又はメタノール、エタノール若しくはプロパノール等のアルコール類が挙げられる。溶媒の量は、化合物〔XX〕1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。
- [0319] 本反応の反応温度は通常、－50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは－10°C～100°Cの温度範囲の範囲である。
- [0320] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～48時間の範囲である。
- [0321] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮、乾燥する等の操作を行うことにより、化合物〔IV〕を単離することができ

る。又、単離した化合物 [IV] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等により更に精製することもできる。

[0322] [製造方法 8]

[製造方法 3] で使用する式 [VI] で表される化合物は、以下の方法に従って製造することができる。

[0323] [化10]



[0324] (式中、R、R²、W及びY¹は前記と同じ意味を表す。)

[0325] 化合物 [XVII] とヒドラジンとを、溶媒中で反応させることにより、化合物 [VI] を製造することができる。ヒドラジンの使用量は、化合物 [XVII] 1当量に対して通常1～10当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～5当量である。使用するヒドラジンは水和物を用いても良い。

[0326] 本反応で使用できる溶媒は、例えばジエチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；又はメタノール、エタノール若しくはプロパノール等のアルコール類が挙げられる。溶媒の量は、化合物 [XVII] 1モルに対して通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～10リットルである。

[0327] 本反応の反応温度は通常、−50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは−10°C～60°Cの温度の範囲である。

[0328] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～24時間の範囲である。

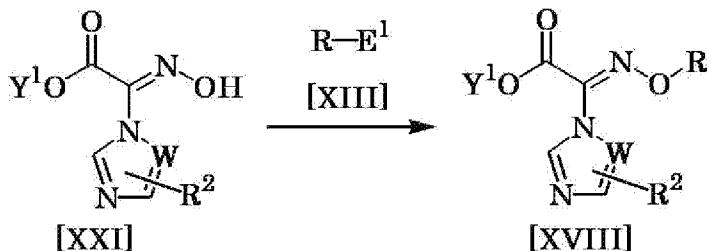
[0329] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物 [VI] を単離することができる。単離した化合物 [VI] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶

等により更に精製することもできる。

[0330] [製造方法9]

[製造方法8]で使用する式[XVII]で表される化合物は、以下の方法に従って製造することができる。

[0331] [化11]



[0332] (式中、R、R²、W、Y¹及びE¹は前記と同じ意味を表す。)

[0333] 一般式[XXI]の化合物と一般式[XIII]の化合物とを、溶媒中、塩基の存在下で反応させることにより、一般式[XVII]の化合物を製造することができる。

[0334] 本反応で使用する化合物[XIII]の使用量は、化合物[XXI]1当量に対して通常、1.0～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.1～2当量である。

[0335] 本反応で使用できる溶媒及び塩基としては、前記[製造方法1]で説明したものと同様のものを挙げることができる。溶媒の量は、化合物[XXI]1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。

[0336] 塩基の使用量は、化合物[XXI]1当量に対して通常、1～20当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～10当量である。

[0337] 本反応の反応温度は通常、−50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは−10°C～100°Cの温度の範囲である。

[0338] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～24時間の範囲である。

[0339] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物[XVII]を単離することもでき

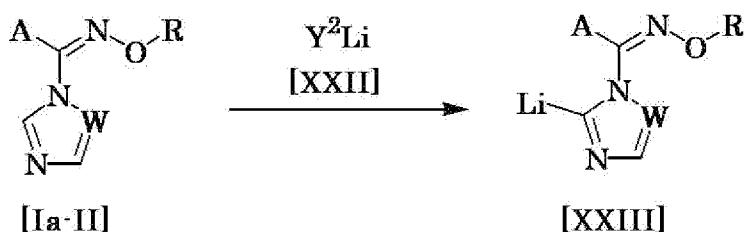
る。単離した化合物 [XVI-III] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0340] 尚、前記化合物 [XXI] は、例えばジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティ・パークイン・トランザクションズ 1 (Journal of the Chemical Society Perkin Transactions 1) 第 2235 頁～第 2239 頁 (1987 年) に記載の方法に準じて製造することができる。

[0341] [製造方法 10]

式 [XXII-III] で表される化合物は、以下の方法に従って製造することができる。

[0342] [化 12]



[0343] (式中、A、R、Wは前記と同じ意味を表し、Y²はC₁～C₄アルキル基又はジC₁～C₄アルキルアミノ基を表す。)

[0344] 一般式 [Ia-II] の化合物と一般式 [XXII] の化合物とを、溶媒中で反応させることにより、一般式 [XXIII] の化合物を製造することができる。

[0345] 本反応で使用する化合物 [XXII] の使用量は、化合物 [Ia-II] 1 当量に対して通常、1.0～5 当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは 1.1～2 当量である。

[0346] 本反応で使用できる溶媒は、例えばジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類を挙げることができる。溶媒の量は、化合物 [Ia-II] 1 モルに対して、通常 0.1～5.0 リットルであり、好ましくは 0.2～3.0 リットルである。

[0347] 本反応の反応温度は通常、−100°C から反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは −70°C～0°C の温度の範囲である。

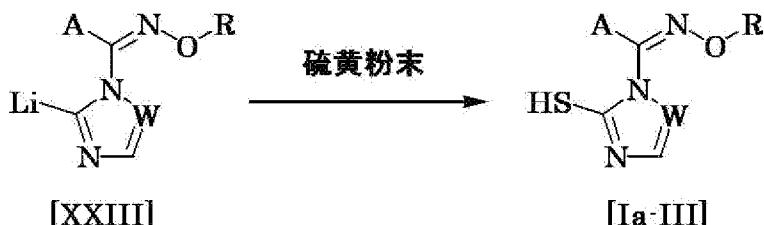
[0348] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～24時間の範囲である。

[0349] 反応終了後は、精製等を行わず、反応混合物のまま次の反応に用いる。

[0350] [製造方法11]

一般式[I]で表される本発明化合物のうち、式[Ia-I II]で表される化合物は、例えば以下の方法に従って製造することができる。

[0351] [化13]



[0352] (式中、A、R、Wは前記と同じ意味を表す。)

[0353] 前記[製造方法10]で説明した一般式[XXIII]の化合物を含む反応混合物と、硫黄粉末とを反応させることにより、一般式[Ia-I II]の化合物を製造することができる。

[0354] 本反応で使用する硫黄粉末の使用量は、化合物[XXIII]1当量に対して通常、1.0～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.1～2当量である。

[0355] 本反応で使用できる溶媒は、前記[製造方法10]で説明したものと同様のものを挙げることができる。溶媒の量は、化合物[XXIII]1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。

[0356] 本反応の反応温度は通常、-100°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは-70°C～0°Cの温度の範囲である。

[0357] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～24時間の範囲である。

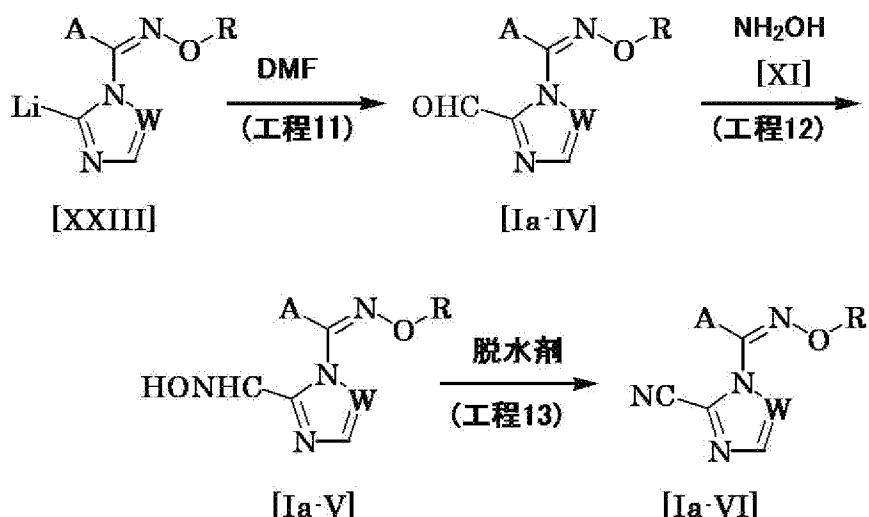
[0358] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物[Ia-I II]を単離することができます。

きる。単離した化合物 [Ia-IIV] は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0359] [製造方法 12]

一般式 [I] で表される本発明化合物のうち、式 [Ia-IIV]、[Ia-V]、[Ia-VI] で表される化合物は、例えば以下の方法に従って製造することができる。

[0360] [化14]



[0361] (式中、A、R、Wは前記と同じ意味を表す。)

[0362] (工程 11)

前記 [製造方法 10] で説明した一般式 [XXIII] の化合物を含む反応混合物と、ジメチルホルムアミド (DMF) とを反応させることにより、一般式 [Ia-IIV] の化合物を製造することができる。

[0363] 本反応で使用するDMFの使用量は、化合物 [XXIII] 1当量に対して通常、1.0～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.1～2当量である。

[0364] 本反応で使用できる溶媒は、前記 [製造方法 10] で説明したものと同様のものを挙げることができる。溶媒の量は、化合物 [XXIII] 1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。

[0365] 本反応の反応温度は通常、-100°Cから反応系における還流温度までの

任意の温度であり、好ましくは−70°C～0°Cの温度の範囲である。

[0366] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常、1～24時間の範囲である。

[0367] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物[I a—I V]を単離することができる。単離した化合物[I a—I V]は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0368] (工程12)

化合物[I a—I V]と化合物[X I]とを、溶媒中、塩基の存在下で反応させることにより、一般式[I a—V]の化合物を製造することができる。

[0369] 本反応で用いられる化合物[X I]の使用量は、化合物[I a—I V]1当量に対して通常、1～5当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～2当量である。化合物[X I]は塩酸塩等の塩を用いてもよい。

[0370] 本反応で使用できる溶媒は、例えば水；メタノール、エタノール若しくはプロパノール等のアルコール類；N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン若しくはN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類；又はこれらの混合物が挙げられる。溶媒の量は、化合物[I a—I V]1モルに対して、通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～3.0リットルである。

[0371] 本反応で使用できる塩基は、例えば酢酸ナトリウム若しくは酢酸カリウム等の酢酸塩基類、水酸化ナトリウム若しくは水酸化カリウム等のアルカリ金属の水酸化物類、炭酸ナトリウム若しくは炭酸カリウム等のアルカリ金属の炭酸塩類、炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸水素カリウム等のアルカリ金属の重炭酸塩類等の無機塩基類；ナトリウムメトキシド若しくはナトリウムエトキシド若しくはカリウムtert-ブトキシド等のアルコールの金属塩類；又はトリエチルアミン若しくは1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]

－7－ウンデセン等の有機塩基類等が挙げられる。

[0372] 塩基の使用量は、化合物〔Ia—Iv〕1当量に対して通常、0～3当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～2.2当量である。

[0373] 本反応の反応温度は通常、室温から反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは50°C～100°Cの温度の範囲である。

[0374] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～24時間の範囲である。

[0375] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物〔Ia—V〕を単離することもできる。単離した化合物〔Ia—V〕は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

[0376] (工程13)

化合物〔Ia—V〕と脱水剤とを、溶媒中で反応させることにより、化合物〔Ia—VI〕を製造することができる。

[0377] 本反応で使用できる溶媒は、例えばジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン若しくはテトラヒドロフラン等のエーテル類；N,N-ジメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン若しくはN-メチル-2-ピロリジノン等のアミド類；ジメチルスルホキシド若しくはスルホラン等の硫黄化合物類；アセトニトリル若しくはプロピオニトリル等のニトリル類；ベンゼン、トルエン若しくはキシレン等の芳香族炭化水素類；又は1,2-ジクロロエタン若しくはクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類が挙げられる。溶媒の量は、化合物〔Ia—V〕1モルに対して通常0.1～50リットルであり、好ましくは0.2～10リットルである。

[0378] 本反応で使用できる脱水剤は、例えば五酸化リン、五塩化リン、オキシ塩化リン、トリホスゲン、トリフルオロ酢酸又は塩化チオニル等が挙げられる。脱水剤の使用量は、化合物〔Ia—V〕1当量に対して通常1～10当量の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1～5当量である。

- [0379] 本反応の反応温度は通常、−50°Cから反応系における還流温度までの任意の温度であり、好ましくは−10°C～100°Cの温度範囲の範囲である。
- [0380] 本反応の反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1～48時間の範囲である。
- [0381] 反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出してから、濃縮する等の操作を行うことにより、化合物〔Ia～VI〕を単離することができる。又、単離した化合物〔Ia～VI〕は、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等により更に精製することもできる。
- [0382] 本発明の有害生物防除剤は、本発明の一般式〔I〕で表されるトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩を活性成分として含有することを特徴とする。
- [0383] 本発明の有害生物防除剤は、必要に応じ、農薬製剤に通常用いられる添加成分（担体）を含有することができる。
- [0384] この添加成分としては、固体担体又は液体担体等の担体、界面活性剤、結合剤や粘着付与剤、増粘剤、着色剤、拡展剤、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、その他必要に応じ、防腐剤や、植物片等を添加成分に用いてもよい。
- [0385] これらの添加成分は1種用いてもよいし、又、2種以上を組み合わせて用いてもよい。
- [0386] 上記添加成分について説明する。
- [0387] 固体担体としては、例えば、パイロフィライトクレー、カオリンクレー、珪石クレー、タルク、珪藻土、ゼオライト、ベントナイト、酸性白土、活性白土、アタパルガスクレー、バーミキュライト、パーライト、軽石、ホワイトカーボン（合成ケイ酸、合成ケイ酸塩等）、二酸化チタン等の鉱物系担体；木質粉、トウモイロコシ茎、クルミ殻、果実核、モミガラ、オガクズ、スマ、大豆粉、粉末セルロース、デンプン、デキストリン、糖類等の植物性担体；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担体；ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニル、ポリ

酢酸ビニル、エチレン - 酢酸ビニル共重合体、尿素 - アルデヒド樹脂等の高分子担体等が挙げられる。これらは単独で用いてもよいし、又、2種以上を組み合わせて用いてもよい（以下の各添加成分について同様である。）。

[0388] 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、シクロヘキサンオール等の一価アルコール類；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；プロピレン系グリコールエーテル等の多価アルコール誘導体類；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、シクロヘキサン、イソホロン等のケトン類；エチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、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；トルエン、C₉～C₁₀アルキルベンゼン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン、高沸点芳香族炭化水素等の芳香族炭化水素類；ジクロロエタン、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、ナタネ油、綿実油、ヤシ油、ヒマシ油等の植物油；水等を挙げることができる。

[0389] 界面活性剤としては、特に制限されないが、好ましくは水中でゲル化するか、或いは膨潤性を示すものであり、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、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、脂肪酸塩、ポリカルボン酸塩、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；

ジアルキルジアミノエチルベタイン、アルキルジメチルベンジルベタイン等のベタイン型、ジアルキルアミノエチルグリシン、アルキルジメチルベンジルグリシン等アミノ酸型等の両性界面活性剤

等が挙げられる。

[0390] 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、天然燐脂質（例えばセファリン酸、レシチン等）等が挙げられる。

- [0391] 増粘剤としては、例えばキサンタンガム、グーガム、カルボキシメチセルロース、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、デンプン誘導体、多糖類のような水溶性高分子；高純度ベントナイト、ホワイトカーボンのような無機微粉等が挙げられる。
- [0392] 着色剤としては、例えば酸化鉄、酸化チタン、ブルー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。
- [0393] 拡展剤としては、例えばシリコーン系界面活性剤、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、メタアクリル酸共重合体、多価アルコールのポリマーとジカルボン酸無水物とのハーフエステル、ポリステレンスルホン酸の水溶性塩等が挙げられる。
- [0394] 展着剤としては、例えばジアルキルスルホン酸ナトリウム、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フェニルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステルなどの種々の界面活性剤；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、合成樹脂エマルション等が挙げられる。
- [0395] 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。
- [0396] 固結防止剤としては、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、ホワイトカーボン、エステルガム、石油樹脂等が挙げられる。

- [0397] 崩壊剤としては、例えばトリポリリン酸ソーダ、ヘキサメタリン酸ソーダ、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。
- [0398] 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；フェノール系、アミン系、硫黄系、リン酸系等の酸化防止剤；サリチル酸系、ベンゾフェノン系等の紫外線吸収剤等が挙げられる。
- [0399] 防腐剤としては、例えばソルビン酸カリウム、1, 2-ベンズチアゾリン-3-オン等が挙げられる。
- [0400] 本発明の有害生物防除剤において、上記添加成分を含有させる場合、その含有割合については、質量基準で、担体では通常5～95%、好ましくは20～90%、界面活性剤では通常0.1%～30%、好ましくは0.5～10%、その他の添加剤は0.1～30%、好ましくは0.5～10%の範囲で選ばれる。
- [0401] 本発明の有害生物防除剤は、粉剤、粉粒剤、粒剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、錠剤、ジャンボ剤、乳剤、油剤、液剤、フロアブル剤、エマルション剤、マイクロエマルション剤、サスペンション剤、微量散布剤、マイクロカプセル剤、くん煙剤、エアゾル剤、ベイト剤、ペースト剤等の任意の剤型に製剤化して使用される。
- [0402] これらの製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は、水等の希釈剤で所定濃度に希釈して使用することができる。本発明化合物を含有する種々の製剤又はその希釈物の施用は、通常一般に行われている施用方法、即ち、散布（例えば噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粉、散粒、水面施用、箱施用等）、土壤施用（例えば混入、灌注等）、表面施用（例えば塗布、粉衣、被覆等）、浸漬、毒餌、くん煙施用等により行うことができ

る。又、家畜に対して前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での有害虫、特に有害昆虫の発生、成育を防除することも可能である。

[0403] 本発明の有害生物防除剤における有効成分の配合割合については、必要に応じて適宜選ばれる。例えば、

粉剤、粉粒剤等とする場合は0.01～20%（質量）、好ましくは0.05～10%（質量）

粒剤等とする場合は0.1～30%（質量）、好ましくは0.5～20%（質量）

水和剤、顆粒水和剤等とする場合は1～70%（質量）、好ましくは5～50%（質量）

水溶剤、液剤等とする場合は1～95%（質量）、好ましくは10～80%（質量）

乳剤等とする場合は5～90%（質量）、好ましくは10～80%（質量）

油剤等とする場合は1～50%（質量）、好ましくは5～30%（質量）

フロアブル剤等とする場合は5～60%（質量）、好ましくは10～50%（質量）

エマルション剤、マイクロエマルション剤、サスポエマルション剤等とする場合は5～70%（質量）、好ましくは10～60%（質量）

錠剤、ベイト剤、ペースト剤等とする場合は、1～80%（質量）、好ましくは5～50%（質量）

くん煙剤等とする場合は、0.1～50%（質量）、好ましくは1～30%（質量）

エアゾル剤等とする場合は、0.05～20%（質量）、好ましくは0.1～10%（質量）

の範囲から適宜選ぶのがよい。

[0404] これらの製剤は適当な濃度に希釈して散布するか、又は、直接施用する。

[0405] 本発明の有害生物防除剤の施用は、希釈剤で希釈して使用する場合には、

一般に0.1～5000 ppmの有効成分濃度で行う。製剤をそのまま使用する場合の単位面積あたりの施用量は、有効成分化合物として1ha当たり0.1～5000gで使用されるが、これらに限定されるものではない。

[0406] 尚、本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物を単独で有効成分としても十分有効であることはいうまでもないが、必要に応じて他の肥料、農薬、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、協力剤、殺菌剤、抗ウイルス剤、誘引剤、除草剤、植物生長調整剤などと混用、併用することができ、この場合に一層優れた効果を示すこともある。

[0407] 混合又は併用してもよい公知の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、協力剤化合物を例示する。

[0408] 1. アセチルコリンエステラーゼ阻害剤：

(1A) カルバマート化合物：アラニカルブ(alanycarb)、アルジカルブ(alidicarb)、アルドキシカルブ(aldoxycarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ブトカルボキシム(butocarboxim)、ブトキシカルボキシム(butoxycarboxim)、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、エチオフェンカルブ(ethiofen carb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、ホルメタネート(formetanate)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocarb)、メチオカルブ(methiocarb)、メソミル(methomyl)、メトルカルブ(metolcarb)、オキサミル(oxamyl)、ピリミカルブ(pirimicarb)、プロポキスル(propoxur)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオファノックス(thifanox)、トリアザメート(triazamate)、トリメタカルブ(trimethacarb)、XMC(XMC)、キシリルカルブ(xylylcarb)；

(1B) 有機リン化合物：アセフェート(acephate)、アザメチホス(azamethiphos)、アジンホス・エチル(azinphos-ethyl)、アジンホス・メチル(azinphos-methyl)、カズサホス(cadusafos)、クロレトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルメホス(chlormephos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス・メチル(chlorpyrifos-met

hyl)、クマホス(coumaphos)、シアノホス(cyanophos)、デメトン・S・メチル(demeton-S-methyl)、ジアミダホス(diamidafos)、ダイアジノン(diazinon)、ジクロルボス(dichlorvos)、ジクロトホス(dicrotophos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジオキサベンゾホス(dioxabenzofos)、ジスルホトン(disulfoton)、DSP(DSP)、EPN、エチオン(ethion)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrimfos)、ファムフル(famphur)、フェナミホス(fenamiphos)、フェニトロチオン(fenitrothion)、フェンチオン(fenthion)、フォノホス(fonofos)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ホスチエタン(fosthietan)、ヘプテノホス(heptenophos)、イサミドホス(isamidofofos)、イサゾホス(isazophos)、イソフェンホス(isofenphos-methyl)、イソプロピル-O-(メトキシアミノチオホソホリル)サリチレート(isopropyl-O-(methoxyaminothio-phosphoryl) salicylate)、イソキサチオン(isoxathion)、マラチオン(malathion)、メカルバム(mecarbam)、メタミドホス(methamidophos)、メチダチオン(methidathion)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、ナレッド(naled)、オメトエート(omethoate)、オキシジメトン・メチル(oxydemeton-methyl)、オキシデプロホス(oxydeprofos)、パラチオン(parathion)、パラチオン・メチル(parathion-methyl)、フェントエート(phentoate)、ホレート(phorate)、ホサロン(phosalone)、ホスマット(phosmet)、ホスマミドン(phosphamidon)、ホキシム(phoxim)、ピリミホス・メチル(pirimiphos-methyl)、プロフェノホス(profenofos)、プロパホス(propaphos)、プロペタムホス(propetamphos)、プロチオホス(prothiofos)、ピラクロホス(pyraclofos)、ピリダフェンチオン(pyridaphenthion)、キナルホス(quinalphos)、スルホテップ(sulfotep)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テメホス(temephos)、テルブホス(terbufos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、チオメトン(thiometon)、チオナジン(thionazin)、トリアゾホス(triazophos)、トリクロルホン(trichlorfon)、バミドチオン(vamidothion)、ジクロフェンチオン(dichlofenthion)、イミシアホス(imicyafos)、イソカルボホス(isocarbophos)、メスルフェンホス(mesulfenfos)

、フルピラゾホス(flupyrazofos)

[0409] 2. GABA受容体(クロライドチャネル)阻害剤

(2A) シクロジエン有機塩素系化合物: クロルデン(chlordane)、エンドスルファン(endosulfan)、ガンマ-BHC(gamma-BCH)；

(2B) フェニルピラゾール系化合物: アセトプロール(acetoprol)、エチプロール(ethiprole)、フィプロニル(fipronil)、ピラフルプロール(pyrafluprole)、ピリプロール(pyriproxyfen)、RZI-02-003(コード番号)

3. ナトリウムチャネルに作用する剤

(3A) ピレスロイド系化合物: アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリング(allethrin) [d-cis-trans、d-transを含む]、ビフェントリン(bifenthrin)、ビオアレスリン(bioallethrin)、ビオアレスリンS-シクロペンテニル(bioallethrinS-cyclopentenyl)ビオレスメトリン(bioresmethrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin) [beta-を含む]、シハロトリン(cyhalothrin) [gamma-, lambda-を含む]、シペルメトリン(cypermethrin) [alpha-, beta-, theta-, zeta-を含む]、シフェノトリン(cyphenothrin) [(1R)-trans-isomersを含む]、デルタメトリン(deltamethrin)、エンペントリン(empenthrin)、エスフェンバレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(etofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropothrin)、フェンバレーート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルメトリン(flumethrin)、タウフルバリネート[tau-を含む]、ハルフェンプロックス(halufenprox)、イミプロトリン(imiprothrin)、メトフルトリン(metofluthrin)、ペルメトリン(permethrin)、フェノトリン(phenothrin) [(1R)-trans-isomerを含む]、プラレトリン(prallethrin)、プロフルトリン(profluthrin)、ピレトリン(pyrethrine)、レスメトリン(resmethrin)、RU15525(コード番号)、シラフルオフェン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、ZXI8901(コード番号)、フルバリネート(fluvalinate)、テトラメチルフルスリン(tetramethylfluthrin)、メペルフル

スリン(meoperfluthrin)；

(3B) DDT系化合物：DDT、メトキシクロル(methoxychlor)

4. ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト／アンタゴニスト

(4A) ネオニコチノイド系化合物：アセタミプリド(acetamiprid)、クロチアニジン(clothianidin)、ジノテフラン(dinotefuran)、イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)；

(4B) ニコチン系化合物：硫酸ニコチン(nicotine-sulfate)

5. ニコチン性アセチルコリン受容体アロステリックアクチベーター

スピノシン系化合物：スピネトラム(spinetoram)、スピノサド(spinosad)

；

6. クロライドチャネルを活性化する剤

アバメクチン、ミルベマイシン系化合物：アバメクチン(abamectin)、エマメクチンベンゾエート(emamectinbenzoate)、レピメクチン(lepimectin)、ミルベメクチン(milbemectin)、イベルメクチン(ivermectin)、ポリナクチン複合体(polynactins)

7. 幼若ホルモン様の剤

ジオフェノラン(diofenolan)、ハイドロプレン(hydroprene)、キノプレン(kinoprene)、メトトリン(methothrin)、フェノキシカルブ(fenoxy carb)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)

[0410] 8. 非特異的作用(多作用点)の剤

1. 3-ジクロロプロペン(1,3-dichloropropene)、DCIP、エチレンジブロミド(ethylene dibromide)、メチルブロマイド(methyl bromide)、クロルピクリン(chloropicrin)、フッ化スルフリル(sulfuryl fluoride)

9. 摂食阻害剤

ピメトロジン(pymetrozine)、フロニカミド(flonicamid)、ピリフルキナゾン(pyriproxyfen)

10. ダニの成長制御剤

クロフェンテジン(clofentezine)、ジフロビダジン(diflovidazin)、ヘキサチアゾクス(hexythiazox)、エトキサゾール(etoxazole)

1 1. 昆虫腸内膜を破壊する剤

B T 剤 : *Bacillus sphaericus*、*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*、*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*、*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*、*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*、Bt crop proteins (Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1)、*Bacillus popilliae*、*Bacillus subtilis*

1 2. ATP 生合成酵素阻害剤

ジアフェンチウロン(diafenthiuron)；

有機スズ化合物 : アゾシクロチン(azocyclotin)、シヘキサチン(cyhexatin)、フェンブタンチン・オキシド(fenbutatinoxide)；

プロパルギット(propargite)、テトラジホン(tetradifon)

1 3. 脱共役剤

クロルフェナピル(chlorfenapyr)、DNOC(DNOC)

1 4. ニコチン性アセチルコリンチャネルブロッカー剤

ネライストキシン系化合物 : ベンスルタップ(bensultap)、カルタップ(car tap)、チオシクラム(thiocyclam)、チオスルタップ(thiosultap)

1 5. キチン生合成阻害剤 (タイプ0)

ベンゾイルウレア系化合物 : ビストリフルロン(bistrifluron)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフェヌロン(lufenuron)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、トリフルムロン(triflumuron)、フルアズロン(fluazuron)

1 6. キチン生合成阻害剤 (タイプ1)

ブプロフェジン(buprofezin)

1 7. 脱皮阻害剤 (双翅目対象)

シロマジン(cyromazine)

18. エクダイソンアゴニスト(脱皮促進)

ジアシリヒドラジン系化合物：クロマフェノジド(chromafenozide)、ハロフェノジド(halofenozide)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、テブフェノジド(tebufenozide)；

19. オクトパミンアゴニスト

アミトラズ(amitraz)

[0411] 20. ミトコンドリア電子伝達系(複合体ⅠⅡⅢ)阻害剤

シフルメトフェン(cyflumetofen)、ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、アセキノシル(acequinocyl)、フルアクリピリム(fluacrypyrim)、シエノピラフェン(cyenopyrafen)

21. ミトコンドリア電子伝達系(複合体Ⅰ)阻害剤

MET I 殺ダニ剤：フェナザキン(fenazaquin)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、ピリダベン(pyridaben)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)；

その他：ロテノン(rotenone)

22. ナトリウムチャネル阻害剤

インドキサカルブ(indoxacarb)、メタフルミゾン(metaflumizone)

23. 脂質生合成阻害剤

テトラニック系殺虫／殺ダニ剤：スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロメシフェン(spiromesifen)、スピロテトラマト(spirotetramat)

24. ミトコンドリア電子伝達系(複合体Ⅳ)阻害剤

りん化アルミニウム(aluminiumphosphide)、りん化水素(phosphine)、りん化亜鉛(zincphosphide)、石灰窒素(calciumcyanide)

25. 神経阻害(作用機作不明)剤

ビフェナゼート(bifenazate)

26. アコニターゼ阻害剤

フルオロ酢酸ナトリウム塩(sodiumfluoroacetate)

27. 共力剤

ピペロニルブトキシド(piperonylbutoxide)、DEF(DEF)

28. リアノジン受容体に作用する剤

クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、フルベンジアミド(flu bendiamide)、シアントラニリプロール(cyantraniliprole)

29. その他（作用性が不明）の剤

アザディラクチン(azadirachtin)、アミドフルメット(amidoflumet)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、キノメチオネート(chinomethionat)、CL 900 167(コード番号)、クリオライト(cryolite)、ジコホル(dicofol)、ジシクラニル(dicyclanil)、ジエノクロル(dienochlor)、ジノブトン(dinobuton)、酸化フェンブタスズ(fenbutatinoxide)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フルエンスルホン(fluensulfone)、フルフェネリム(flufenerim)、フルスルファミド(flusulfamide)、カランジン(karanjin)、メタム(metham)、メトプレン(methoprene)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、メチルイソチオシアネート(methylisothiocyanate)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、スルコフロン(sulcofuron-sodium)、スルフラミド(sulflramid)、スルホキサフル(sulfoxaflor)

30. 昆虫病原性糸状菌、殺線虫微生物

ボーベリア・バッシアーナ(Beauveriabassiana)、ボーベリア・テネーラ(Beauveriatenella)、バーティシリウムレカニ(Verticilliumlecanii)、ペキロマイセス・テヌイペス(Paciliomycestenuipes)、ペキロマイセス・フモソロセウス(Paeciliomycesfumosoroseus)、ボーベリア・ブロンニアティ(Beauveriabronniartii)、モナクロスボリウム・フィマトパガム(Monacrosporiumphymatophagum)、パスツーリアペネトランス胞子(Pasteuriapenetrae)

31. 性フェロモン

(Z)-11-ヘキサデセナール、(Z)-11-ヘキサデセニル=アセタート、リトルアA(litture-A)、リトルアB(litture-B)、Z-13-イコセ

ン-10-オン、(Z, E)-9, 12-テトラデカジエニル=アセタート、(Z)-9-テトラデセン-1-オール、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-9, 12-テトラデカジエニル=アセタート、(Z, E)-9, 11-テトラデカジエニル=アセタート

[0412] 混合又は併用してもよい公知の殺菌剤又は病害防除剤化合物を例示する。

[0413] 1. 核酸生合成阻害剤

アシリアルアラニン化合物：ベナラキシル(benalaxyI)、ベナラキシル・M(ben alaxyI-M)、フララキシル(furalaxyI)、メタラキシル(metaxyI)、メタラキシル・M(metaxyI-M)；

オキサゾリジノン系化合物：オキサジキシル(oxadixyl)；

ブチロラクトン系化合物：クロジラコン(clozytacon)、オフラセ(ofurace)；

ヒドロキシ-(2-アミノ)ピリミジン系化合物：ブピリメート(bupirimite)、ジメチリモル(dimethirimol)、エチリモル(ethirimol)；

イソキサゾール系化合物：ヒメキサゾール(hymexazol)；

イソチアゾロン系化合物：オクチリノン(octhilinone)；

カルボン酸系化合物：オキソリニック酸(oxolinicacid)

2. 有糸分裂及び細胞分裂阻害剤

ベンゾイミダゾール系化合物：ベノミル(benomyl)、カルベンダジム(carbendazim)、フベリダゾール(fuberidazole)、チアベンダゾール(thiabendazole)；

チオファネート系化合物：チオファネート(thiophanate)、チオファネート・メチル(thiophanate-methyl)；

N-フェニルカルバマート系化合物：ジエトフェンカルブ(diethofencarb)；

トルアミド系化合物：ゾキサミド(zoxamide)；

フェニルウレア系化合物：ペンシクリン(pencycuron)；

ピリニジルメチルベンズアミド系化合物：フルオピコリド(fluopicolide)

3. 呼吸阻害剤

ピリミジンアミン系化合物：ジフルメトリム(diflumetorim)；

カルボキサミド系化合物：ベノダニル(benodanil)、フルトラニル(flutolanil)、メプロニル(mepronil)、フルオピラム(fluopyram)、フェンフラム(fenfuram)、カルボキシン(carboxin)、オキシカルボキシン(oxycarboxin)、チフルザミド(thifluzamide)、ビキサafen(bixafen)、フラメトピル(furametryr)、イソピラザム(isopyrazam)、ペンフルフェン(penflufen)、ペンチオピラド(penthiopyrad)、セダキサン(sedaxane)、ボスカリド(boscalid)；

メトキシアクリレート系化合物：アゾキシストロビン(azoxystrobin)、エネストロブリン(enestroburin)、ピコキシストロビン(picoxystrobin)、ピラオキシストロビン(pyraoxystrobin)；

メトキカルバマート系化合物：ピラクロストロビン(pyraclostrobin)、ピラメトストロビン(pyrametostrobin)；

オキシイミノアセテート化合物：クレスキシム・メチル(kresoxim-methyl)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)；

オキシイミノセトアミド系化合物：ジモキシストロビン(dimoxystrobin)、メトミノストロビン(metominostrobin)、オリサストロビン(orysastrobin)；

オキサゾリジンジオン系化合物：ファモキサドン(famoxadone)；

ジヒドロジオキサジン系化合物：フルオキサストロビン(fluoxastrobin)；

イミダゾリノン系化合物：フェナミド(fenamidone)；

ベンジルカルバマート系化合物：ピリベンカルブ(pyrribencarb)；

シアノイミダゾール系化合物：シアゾファミド(cyazofamid)；

スルファモイルトリアゾール系化合物：アミスルブロム(amisulbrom)；

ジニトロフェニルクロトン酸系化合物：ビナパクリル(binapacryl)、メプチルジノカップ(meptyldinocap)、ジノカップ(dinocap)；

2, 6 - ジニトロアニリン系化合物：フルアジナム(fluazinam)；

ピリミジノンヒドラゾン系化合物：フェリムゾン(ferimzone)；

トリフェニルスズ系化合物：T P T A (PTPA)、T P T C (PTPC)、T P T H (

TPTH) ;

チオフェンカルボキサミド系化合物：シリチオファム(silthiofam)；

トリアゾロピリミジルアミン系化合物：アメトクトラジン(ametoctradin)

[0414] 4. アミノ酸及びタンパク質合成阻害剤

アニリノピリミジン系化合物：シプロジニル(cyprodinil)、メパニピリム(mepanipyrim)、ピリメタニル(pyrimethanil)；

エノピランウロン酸系抗生物質：ブラストサイジン-S(blasticidin-S)、ミルディオマイシン(mildiomycin)；

ヘキソピラノシル系抗生物質：カスガマイシン(kasugamycin)；

グルコピラノシル系抗生物質：ストレプトマイシン(streptomycin)；

テトラサイクリン系抗生物質：オキシテトラサイクリン(oxytetracycline)

5. シグナル伝達系に作用する剤

キノリン系化合物：キノキシフェン(quinoxyfen)；

キナゾリン系化合物：プロキナジド(proquinazid)；

フェニルピロール系化合物：フェンピクロニル(fenpiclonil)、フルジオキソニル(fludioxonil)；

ジカルボキシミド系化合物：クロゾリネート(chlozolate)、イプロジオング(iprodione)、プロシミドン(procymidone)、ビンクロゾリン(vinclozolin)；

6. 脂質及び細胞膜合成阻害剤

ホスホロチオレート系化合物：エジフェンホス(edifenphos)、イプロベンホス(iprobenfos)、ピラゾホス(pyrazophos)；

ジチオラン系化合物：イソプロチオラン(isoprothiolane)；

芳香族炭化水素系化合物：ビフェニル(biphenyl)、クロロネブ(chloroneb)、ジクロラン(dicloran)、キントゼン(quintozene)、テクナゼン(tecnazene)、トルクロホス・メチル(tolclofos-methyl)；

1, 2, 4 - チアジアゾール系化合物：エトリジアゾール(etridiazole)；

カルバマート系化合物：ヨードカルブ(iodocarb)、プロパモカルブ塩酸塩(

propamocarb-hydrochloride)、プロチオカルブ(prothiocarb)；

桂皮酸アミド系化合物：ジメトモルフ(dimethomorph)、フルモルフ(flumorph)；

バリンアミドカルバマート系化合物：ベンチアバリカルブ・イソプロピル(benthiavalicarb-isopropyl)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)、バリフェナレート(valifenalate)；

マンデル酸アミド系化合物：マンジプロパミド(mandipropamid)；

バチルスズブチリス及び殺菌性リポペプチド生産物：バチルスズブチリス(*Bacillus subtilis*) (strain : QST713)

[0415] 7. ステロール生合成阻害剤

ペペラジン系化合物：トリホリン(triforine)；

ピリジン系化合物：ピリフェノックス(pyrifenoxy)；

ピリミジン系化合物：フェナリモル(fenarimol)、ヌアリモル(nuarimol)；

イミダゾール系化合物：イマザリル(imazalil)、オキスピコナゾールスマル酸塩(oxpoconazole-fumarate)、ペフラゾエート(pefurazoate)、プロクロラズ(prochloraz)、トリフルミゾール(triflumizole)；

トリアゾール系化合物：アザコナゾール(azaconazole)、ビテルタノール(biteranol)、ブロムコナゾール(bromuconazole)、シプロコナゾール(cyproconazole)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、ジニコナゾール(diniconazole)、ジニコナゾール・M(diniconazole-M)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、エタコナゾール(etaconazole)、フェンブコナゾール(fenbuconazole)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)、フルシラゾール(flusilazole)、フルトリアホール(flutriafol)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、イミベンコナゾール(imibenconazole)、イプロコナゾール(ipconazole)、メトコナゾール(metconazole)、ミクロブタニル(myclobutanil)、ペンコナゾール(pencoconazole)、プロピコナゾール(propiconazole)、プロチオコナゾール(prothiconazole)、シメコナゾール(simeconazole)、テブコナゾール(tebuconazole)、テトラコナゾール(tetraconazole)、トリアジメホン(triadimefon)、トリ

アジメノール(triadimenol)、トリチコナゾール(triticonazole)、フルコナゾール(furconazole)、フルコナゾール・シス(furconazole-cis)、キンコナゾール(quinconazole)；

モルホリン系化合物：アルジモルフ(aldimorph)、ドデモルフ(dodemorph)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、トリデモルフ(tridemorph)；

ピペリジン系化合物：フェンプロピジン(fenpropidin)、ピペラリン(piperalin)；

スピロケタールアミン系化合物：スピロキサミン(spiroxamine)；

ヒドロキシアニリド系化合物：フェンヘキサミド(fenhexamid)；

チオカルバマート系化合物：ピリブチカルブ(pyributicarb)；

アリルアミン系化合物：ナフトイフィン(naftifine)、テルビナフィン(terbinafine)

8. グルカン合成阻害剤

グルコピラノシリ系抗生物質：バリダマイシン(validamycin)；

ペプチジルピリジンスクレオチド化合物：ポリオキシン(polyoxin)

9. メラニン合成阻害剤

イソベンゾフラノン系化合物：フサライド(phthalide)；

ピロロキノリン系化合物：ピロキロン(pyroquilon)；

トリアゾロベンゾチアゾール系化合物：トリシクラゾール(tricyclazole)

；

カルボキサミド系化合物：カルプロパミド(carpropamid)、ジクロシメット(diclocymet)；

プロピオンアミド系化合物：フェノキサニル(fenoxanil)

[0416] 10. 植物病害抵抗性を誘導する剤

ベンゾチアジアゾール系化合物：アシベンゾラル・S・メチル(acibenzolar-S-methyl)；

ベンゾイソチアゾール系化合物：プロベナゾール(probenazole)；

チアジアゾールカルボキサミド系化合物：チアジニル(tiadinil)、イソチ

アニル(isotianil)；

天然物：ラミナリン

1.1. 作用性不明及び多作用点の剤

銅化合物：水酸化第二銅(copperhydroxide)、オクタン酸銅(copperdioctanoate)、塩基性塩化銅(copperoxychloride)、硫酸銅(coppersulfate)、酸化第一銅(cuprousoxide)、オキシキノリン銅(oxine-copper)、ボルドー液(Bordeauxmixture)、ノニルフェノールスルホン酸銅(coppernonylphenolsulphonate)；

硫黄化合物：硫黄(sulfur)；

ジチオカルバマート系化合物：ファーバム(ferbam)、マンコゼブ(mancozeb)、マンネブ(maneb)、メチラム(metiram)、プロピネブ(propineb)、チウラム(thiram)、ジネブ(zineb)、ジラム(ziram)、クフラネブ(cufraneb)；

フタルイミド系化合物：キャプタン(captan)、フォルペット(folpet)、カプタホール(captafol)；

クロロニトリル系化合物：クロロタロニル(chlorothalonil)；

スルファミド系化合物：ジクロフルアニド(dichlofluanid)、トリルフルアニド(tolylfluanid)；

グアニジン系化合物：グアザチン(guazatine)、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-triacetate)、ドジン(dodine)；

その他の化合物：アニラジン(anilazine)、ジチアノン(dithianon)、シモキサニル(cymoxanil)、ホセチル(fosetyl)(alminium, calcium, sodium)、亜リン酸及び塩(phosphorousacidandsalts)、テクロフタラム(tecloftalam)、トリアゾキシド(triazoxide)、フルスルファミド(flusulfamide)、ジクロメジン(diclomezine)、メタスルホカルブ(methasulfocarb)、エタボキサム(ethaboxam)、シフルフェナミド(cyflufenamid)、メトラフェノン(metrafenone)、炭酸水素カリウム(potassiumbicarbonate)、炭酸水素ナトリウム(sodiumbicarbonate)、B A F - 0 4 5 (コード番号)、B A G - 0 1 0 (コード番号)、

ベンチアゾール(benthiazole)、ブロノポール(bronopol)、カルボネ(carbone)、キノメチオネート(chinomethionat)、ダゾメット(dazomet)、D B E D C (DBEDC)、デバカルブ(debacarb)、ジクロロフェン(dichlorophen)、ジフェンゾコート(difenzoquat-methylsulfate)、ジメチルジスルフィド(dimethyl disulfide)、ジフェニルアミン(diphenylamine)、エトキシキン(ethoxyquin)、フルメトベル(flumetover)、フルオルイミド(fluoroimide)、フルチアニル(flutianil)、フルキサピロキサド(fluxapyroxad)、フランカルボン酸(furan carboxylic acid)、メタム(metam)、ナーバム(nabam)、ナタマイシン(natamycin)、ニトラピリン(nitrapyrin)、ニトロタル・イソプロピル(nitrothal-isopropyl)、オルソフェニルフェノール(o-phenylphenol)、オキサジニラゾール(oxazinylazole)、硫酸オキシキノリン(oxyquinolinesulfate)、フェナジンオキシド(phenazineoxide)、ポリカーバメート(polycarbamate)、ピリオフェノン(pyriofenone)、S-2188(コード番号)、銀(silver)、SYP-Z-048(コード番号)、テブフロキン(tebufloquin)、トルニファニド(tolnifanide)、トリクラミド(trichlamide)、ミネラルオイル(mineraloils)、オーガニックオイル(organic oils)；

[0417] 混合又は併用してもよい公知の除草剤化合物、植物成長調整剤化合物を以下に例示する。

[0418] A 1. アセチルC o Aカルボキシラーゼ(ACCase)阻害型除草剤

(A 1-1) アリールオキシフェノキシプロピオン酸系化合物：クロジナホップ(clodinafop-propargyl)、シハロホップ・ブチル(cyhalofop-butyl)、ジクロホップ・メチル(diclofop-methyl)、ジクロホップ・P・メチル(diclofop-P-methyl)、フェノキサプロップ・P・エチル(fenoxyaprop-P-ethyl)、フルアジホップ(fluazifop-butyl)、フルアジホップ・P(fluazifop-P-butyl)、ハロキシホップ(haloxyfop)、ハロキシホップ-エトイル(haloxyfop-etotyl)ハロキシホップ・P(haloxyfop-P)、メタミホップ(metamifop)、プロパキザホップ(propaquizafo)、キザロホップ(quinalofop-ethyl)、キザロホップ・P・エチル(quinalofop-P-ethyl)、キザロホップ・P・テフリル(quinalof-

op-P-tefuryl)、フェンチアプロップ・エチル(fenthiaprop-ethyl)；

(A 1-2) シクロヘキサンジオン系化合物：アロキシジム(alloxydim)、ブトロキシジム(butroxydim)、クレトジム(clethodim)、シクロキシジム(cycloxydim)、プロホキシジム(profoxydim)、セトキシジム(sethoxydim)、テプラロキシジム(tepraloxoym)、トラルコキシジム(tralkoxydim)；

(A 1-3) フェニルピラゾリン系化合物：アミノピラリド(aminopyralid)、ピノキサデン(pinoxaden)；

B. アセト乳酸合成酵素(ALS)阻害型除草剤

(B-1) イミダゾリノン系化合物：イマザメタベンズ(imazamethabenz-methyl)、イマザモックス(imazamox)、イマザピク(imazapic)(アミン等との塩を含む)、イマザピル(imazapyr)(イソプロピルアミン等の塩を含む)、イマザキン(imazaquin)、イマゼタピル(imazethapyr)；

(B-2) ピリミジニルオキシ安息香酸系化合物：ビスピリバック・ナトリウム塩(bispyribac-sodium)、ピリベンゾキシム(pyrabenoxim)、ピリフトリド(pyriftalid)、ピリミノバック・メチル(pyriminobac-methyl)、ピリチオバッカ・ナトリウム塩(pyrithiobac-sodium)、ピリミスルファン(pyrimisulfan)；

(B-3) スルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系化合物：フルカルバゾン・ナトリウム塩(flucarbazone-sodium)、チエンカルバゾン(thien carbazole)(ナトリウム塩、メチルエステル等を含む)、プロポキシカルバゾン・ナトリウム塩(propoxycarbazone-sodium)、プロカルバゾン・ナトリウム塩(procacbzone-sodium)；

(B-4) スルホニルウレア系化合物：アミドスルフロン(amidosulfuron)、アジムスルフロン(azimsulfuron)、ベンスルフロン・メチル(bensulfuron-methyl)、クロリムロン・エチル(chlorimuron-ethyl)、クロルスルフロン(chlorsulfuron)、シノスルフロン(cinosulfuron)、シクロスルファムロン(cyclosulfamuron)、エタメトスルフロン・メチル(ethametsulfuron-methyl)、エトキシスルフロン(ethoxysulfuron)、フラザスルフロン(flazasulfuron)、フ

ルピルスルフロン(flupyrulfuron-methyl-sodium)、フォラムスルフロン(fo ramsulfuron)、ハロスルフロン・メチル(halo sulfuron-methyl)、イマゾスル フロン(imazosulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム塩(iodosulfu on-methyl-sodium)、メソスルフロン・メチル(mesosulfuron-methyl)、メトス ルフロン・メチル(metsulfuron-methyl)、ニコスルフロン(nicosulfuron)、 オキサスルフロン(oxasulfuron)、プリミスルフロン(primisulfuron-methyl) 、プロスルフロン(prosulfuron)、ピラゾスルフロン・エチル(pyrazosulfuro n-ethyl)、リムスルフロン(rimsulfuron)、スルホメツロン・メチル(sulfome turon-methyl)、スルフォスルフロン(sulfosulfuron)、チフェンスルフロン ・メチル(thifensulfuron-methyl)、トリアスルフロン(triasulfuron)、トリ ベニュロン・メチル(tribenuron-methyl)、トリフロキシスルフロンナトリウ ム塩(trifloxysulfuron-sodium)、トリフルスルフロン・メチル(triflusulfu ron-methyl)、トリトルスルフロン(tritosulfuron)、オルトルファムロン(or thosulfamuron)、プロピリスルフロン(propirisulfuron)、メタゾスルフロン (metazosulfuron) フルセトスルフロン(flucetosulfuron)；

(B-5) トリアゾロピリミジン系化合物：クロランスラム・メチル(clor ansulam-methyl)、ジクロスラム(diclosulam)、フロラスラム(forasulam)、 フルメツラム(flumetsulam)、メトスラム(metosulam)、ペノキススラム(peno xsulam)、ピロクススラム(pyroxsulam)；

[0419] C 1. 光化学系II (PhotosystemII) での光合成阻害剤1

(C 1-1) フェニルカルバマート系除草剤：デスマディファム(desmedip ham)、フェンメディファム(phenmedipham)；

(C 1-2) ピリダジノン系化合物：クロリダゾン(chloridazon)、ブロムピ ラゾン(brompyrazon)；

(C 1-3) トリアジン系化合物：アメトリン(ametryn)、アトラジン(atra zine)、シアナジン(cyanazine)、デスマトリン(desmetryne)、ジメタメトリン (dimethametryn)、エグリナジン(egluzazine-ethyl)、プロメトン(prometon) 、プロメトリン(prometryn)、プロパジン(propazine)、シマジン(simazine)

、シメトリン(simetryn)、テルブメトン(terbumeton)、テルブチラジン(terbutylazine)、テルブトリン(terbutryn)、トリエタジン(trietazine)；

(C 1-4) トリアジノン系化合物：メタミトロン(metamitron)、メトリブジン(metribuzin)；

(C 1-5) トリアゾリノン系化合物：アミカルバゾン(amicarbazone)；

(C 1-6) ウラシル系化合物：ブロマシル(bromacil)、レナシル(lenacil)、ターバシル(terbacil)；

C 2. 光化学系II (PhotosystemII) での光合成阻害除草剤2

(C 2-1) アミド系化合物：ペンタノクロール(pentanochlor)、プロパンル(propanil)；

(C 2-2) 尿素系化合物：クロルブロムロン(chlorbromuron)、クロロトルロン(chlorotoluron)、クロロクスロン(chloroxuron)、ジメフロン(dimefuron)、ジウロン(diuron)、エチジムロン(ethidimuron)、フェニュロン(fenuron)、フルオメツロン(fluometuron)、イソプロツロン(isoproturon)、イソウロン(isouron)、リニュロン(linuron)、メタベンズチアズロン(methabenzthiazuron)、メトブロムロン(metobromuron)、メトキスロン(metoxyuron)、モノリニュロン(monolinuron)、ネブロン(neburon)、シデュロン(siduron)、テブチウロン(tebuthiuron)、メトベンズロン(metobenzuron)；

C 3. 光化学系II (PhotosystemII) での光合成阻害除草剤3

(C 3-1) ベンゾチアジアゾン系化合物：ベンタゾン(bentazone)；

(C 3-2) ニトリル系化合物：ブロモフェノキシム(bromofenoxim)、ブロモキシニル(bromoxynil)（酪酸、オクタン酸又はヘプタン酸等のエステル体を含む）、アイオキシニル(ioxynil)；

(C 3-3) フェニルピラジン系除草性化合物：ピリダフォル(pyridafol)、ピリデート(pyridate)；

D. 光化学系I からのラジカル生成型除草性剤

(D-1) ビピリジウム系化合物：ジクワット(diquat)、パラコート(paraquatdichloride)；

[0420] E. プロトポルフィノリーゲンオキシダーゼ (PPO) 阻害型除草剤

(E-1) ジフェニルエーテル系化合物：アシフルオルフェン(acifluorfen-sodium)、ビフェノックス(bifenox)、クロメトキシフェン(chlomethoxyfen)、エトキシフェン(ethoxyfen-ethyl)、フルオログリコフェン(fluoroglycofen-ethyl)、ホメサafen(fomesafen)、ラクトフェン(lactofen)、オキシフルオルフェン(oxyfluorfen)；

(E-2) N-フェニルフタルイミド系化合物：シニドン・エチル(cinidon-ethyl)、フルミクロラック・ペンチル(flumiclorac-pentyl)、フルミオキサジン(flumioxazin)、クロルフタリム(chlorphthalim)；

(E-3) オキシジアゾール系化合物：オキサジアルギル(oxadiargyl)、オキサジアゾン(oxadiazon)；

(E-4) オキサゾリジンジオン系化合物：ペントキサゾン(pentoxazole)

；

(E-5) フェニルピラゾール系化合物：フルアゾレート(fluazolate)、ピラフルフェン・エチル(pyraflufen-ethyl)；

(E-6) ピリミジンジオン系化合物：ベンズフェンジゾン(benzfendizone)、ブタフェナシル(butafenacil)、サフルフェナシル(saflufenacil)；

(E-7) チアジアゾール系化合物：フルチアセット・メチル(fluthiaacet-methyl)、チジアジミン(thidiazimin)；

(E-8) トリアゾリノン系化合物：アザフェニジン(azafenidin)、カルフェントラゾン・エチル(carfentrazone-ethyl)、スルフェントラゾン(sulfentrazone)、ベンカルバゾン(bencarbazone)；

(E-9) その他の化合物：フルフェンピル・エチル(flufenpyr-ethyl)、プロフルアゾール(profluazol)、ピラクロニル(pyraclonil)、SYP-298 (コード番号)、SYP-300 (コード番号)；

F 1. フィトエンデサチュラーゼ (PDS) 阻害剤除草剤

(F 1-1) ピリダジノン系化合物：ノルフルラゾン(norflurazon)；

(F 1-2) ピリミジンカルボキサミド系化合物：ジフルフェニカン(difluf

enican)、ピコリナafen(picolinafen)；

(F 1-3) その他の化合物：

ベフルブタミド(beflubutamid)、フルリドン(Fluridone)、フルロクロリドン(Flurochloridone)、フルルタモン(Flurtamone)；

F 2. 4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害型除草剤

(F 2-1) カリストモン系化合物：メソトリオン(mesotrione)；

(F 2-2) イソキサゾール系化合物：ピラスルホトール(pyrasulfotole)、イソキサフルトール(isoxaflutole)、イソキサクロルトール(isoxachlortole)；

(F 2-3) ピラゾール系化合物：ベンゾフェナップ(benzofenap)、ピラゾリネート(pyrazolynate)、ピラゾキシフェン(pyrazoxyfen)；

(F 2-4) トリケトン系化合物：スルコトリオン(sulcotrione)、テフリルトリオン(tefuryltrion)、テムボトリオン(tembotrione)、ピラスルホトール(pyrasulfotole)、トプラメゾン(topramezone)、ビシクロピロン(bicyclopyrone)；

F 3. カロチノイド生合成阻害剤(ターゲット未知)除草剤

(F 3-1) ジフェニルエーテル系化合物：アクロニフェン(aclonifen)；

(F 3-2) イソキサゾリジノン系化合物：クロマゾン(clomazone)；

(F 3-3) トリアゾール系化合物：アミトロール(amitrole)；

G. EPS Pシンターゼ合成阻害(芳香族アミノ酸合成阻害)型除草剤

(G-1) グリシン系化合物：グリホサート(glyphosate)(ナトリウム、アミン、プロピルアミン、イソプロピルアミン、ジメチルアミン又はトリメシウム等の塩を含む)；

H. グルタミン合成阻害剤除草剤

(H-1) ホスフィン酸系化合物：ビラナホス(bilanafos)、グルホシネート(glufosinate)(アミン又はナトリウム等の塩を含む)；

I. ジヒドロプロテロエート(DHP)阻害剤除草剤

(I-1) カルバマート系化合物：アシュラム(asulam)；

[0421] K 1. 微小管の集合阻害型除草性剤

(K 1-1) ベンズアミド系化合物：プロピザミド(propyzamide)、テブタム(tebutam)；

(K 1-2) 安息香酸系化合物：クロルタル・ジメチル(chlorthal-dimethyl)；

(K 1-3) ジニトロアニリン系化合物：ベンフルラリン(benfluralin)、ブトラリン(butralin)、ジニトラミン(dinitramine)、エタルフルラリン(ethalfluralin)、フルクロラリン(fluchloralin)、オリザリン(oryzalin)、ペンジメタリン(pendimethalin)、プロジアミン(prodiamine)、トリフルラリン(trifluralin)；

(K 1-4) ホスホロアミデート系化合物：アミプロホス・メチル(amiprofos-methyl)、ブタミホス(butamifos)；

(K 1-5) ピリジン系化合物：ジチオピル(dithiopyr)、チアゾピル(thiazopyr)；

K 2. 有糸分裂／微小管組織形成阻害型除草剤

(K 2-1) カルバマート系化合物：カルベタミド(carbetamide)、クロルプロファム(chlorpropham)、プロファム(propham)、スエップ(swep)、カルブチレート(karbutilate)；

K 3. 超長鎖脂肪酸伸長酵素(VLCFA)阻害型除草剤

(K 3-1) アセトアミド系化合物：ジフェナミド(diphenamid)、ナプロパミド(napropamide)、ナプロアニリド(naproanilide)；

(K 3-2) クロロアセトアミド系化合物：アセトクロール(acetochlor)、アラクロール(alachlor)、ブタクロール(butachlor)、ブテナクロール(butenachlor)、ジエタチル(diethyl-ethyl)、ジメタクロール(dimethachlor)、ジメテナミド(dimethenamid)、ジメテナミド・P(dimethenamid-P)、メタザクロール(metazachlor)、メトラクロール(metolachlor)、ペトキサミド(pethoxamid)、プレチラクロール(pretilachlor)、プロパクロール(pr

opachlor)、プロピソクロール(propisochlor)、S-メトラクロール(S-metolachlor)、テニルクロール(thenylchlor)；

(K3-3) オキシアセトアミド系化合物：フルフェナセット(flufenacet)、メフェナセット(mefenacet)；

(K3-4) テトラドリノン系化合物：フェントラザミド(fentrazamide)；

(K3-5) その他の化合物：アニロホス(anilofos)、ブロモブチド(bromo butide)、カafenストロール(cafenstrole)、インダノファン(indanofan)、ピペロホス(piperophos)、フェノキサスルホン(fenoxyasulfone)、ピロキサスルホン(pyroxasulfone)、イプフェンカルバゾン(ipfencarbazone)；
L. セルロース合成阻害剤除草剤

(L-1) ベンズアミド系化合物：イソキサベン(isoxaben)；

(L-2) ニトリル系化合物：ジクロベニル(dichlobenil)、クロルチアミド(chlorthiamid)；

(L-3) トリアゾロカルボキサミド系化合物：フルポキサム(flupoxame)；

M. アンカッپラー（細胞膜破裂）型除草剤

(M-1) ジニトロフェノール系化合物：ジノテルブ(dinoterb)、D N O C (アミン又はナトリウム等の塩を含む)；

N. 脂質生合成（A C C a s e 阻害以外）阻害型除草剤

(N-1) ベンゾフラン系化合物：ベンフレセート(benfuresate)、エトフメセート(ethofumesate)；

(N-2) ハロゲン化カルボン酸系化合物：ダラポン(dalapon)、フルプロパネット(fluopropanate)、T C A (ナトリウム、カルシウム又はアンモニア等の塩を含む)；

(N-3) ホスホジチオエート系化合物：ベンスリド(bensulide)；

(N-4) チオカルバマート系化合物：ブチレート(butylate)、シクロエート(cycloate)、ジメピペレート(dimethylpiperate)、E P T C、エスプロカルブ(esprocarb)、モリネート(molinate)、オルベンカルブ(orbencarb)、ペブレー

ト(pebulate)、プロスルホカルブ(prosulfocarb)、チオベンカルブ(thiobencarb)、チオカルバジル(tiocarbazil)、トリアレート(tri-allate)、バーナレート(vernolate)；

O. 合成オーキシン型除草剤

(O-1) 安息香酸系化合物：クロランベン(chloramben)、2, 3, 6-TBA、ジカンバ(dicamba)（アミン、ジエチルアミン、イソプロピルアミン、ジグリコールアミン、ナトリウム又はリチウム等の塩を含む）；

(O-2) フェノキシカルボン酸系化合物：2, 4, 5-T、2, 4-D（アミン、ジエチルアミン、トリエタノールアミン、イソプロピルアミン、ナトリウム又はリチウム等の塩を含む）、2, 4-DB、クロメプロップ(clometoprop)、ジクロルプロップ(dichlorprop)、ジクロルプロップ-P(dichlorprop-P)、MCPA、MCPA・チオエチル(MCPA-thioethyl)、MCPB（ナトリウム塩、エチルエステル等を含む）、メコプロップ(mecoprop)（ナトリウム、カリウム、イソプロピルアミン、トリエタノールアミン、ジメチルアミン等の塩を含む）、メコプロップ-P・カリウム塩(mecoprop-P)；

(O-3) ピリジンカルボン酸系化合物：クロピラリド(clopyralid)、フルキシビル(fluoroxypr)、ピクロラム(picloram)、トリクロビル(triclopyr)、トリクロビルブトテイル(triclopyr-butotyl)；

(O-4) キノリンカルボン酸系化合物：キンクロラック(quinclorac)、キンメラック(quinmerac)；

(O-5) その他の化合物：ベナゾリン(benzolin)；

P. オーキシン輸送阻害型除草剤

(P-1) フタラマート(Phthalamates) 系化合物：ナプタラム(naptalam)（ナトリウム等との塩を含む）；

(P-2) セミカルバゾン系化合物：ジフルフェンゾビル(diflufenzopyr)；

[0422] Z. 作用性未知の除草剤

フラムプロップ・M(flamprop-M)（メチル、エチル、イソプロピルエステルを含む）、フラムプロップ(flamprop)（メチル、エチル、イソプロピルエステ

ルを含む)、クロルフルレノール(chlorflurenol-methyl)、シンメチリン(cimethilin)、クミルロン(cumyluron)、ダイムロン(daimuron)、メチルダイムロン(methylidymuron)、ジフェンゾコート(difenoquat)、エトベンザニド(etobenzanid)、ホサミン(fosamine)、ピリブチカルブ(pyributicarb)、オキサジクロメホン(oxaziclomefone)、アクロレイン(acrolein)、A E - F - 150 944 (コード番号)、アミノシクロピラクロル(aminocyclopyrachlor)、シアナミド(cyanamide)、heptamaloxylglucan、インダジフラム(indaziflam)、トリアジフラム(triaziflam)、キノクラミン(quinoclamine)、エンドターレニナトリウム塩(endothal-disodium)、フェニソファム(phenisopham)

植物生長調節剤：

1 - メチルシクロプロペン(1-methylcyclopropene)、1 - ナフチルアセトアミド(1-naphthylacetamide)、2, 6 - ジイソプロピルナフタレン(2, 6-diisopropynaphthalene)、4 - CPA、ベンジルアミノプリン(benzylaminopurine)、アンシミドール(ancymidol)、アビグリシン(aviglycine)、カルボネ(carvone)、クロルメコート(chlormequat)、クロプロップ(cloprop)、クロキシホナック(cloxyfonac)、クロキシホナック・カリウム塩(cloxyfonac-potassium)、シクラニリド(cyclanilide)、サイトカイニン(cytokinins)ダミノジット(daminodide)、ジケグラック(dikegulac)、ジメチピン(dimethipin)、エテホン(ethephon)、エチクロゼート(ethychlozate)、フルメトラリン(flumetralin)、フルレノール(flurenol)、フルルプリミドール(flurprimidol)、ホルクロルフェニュロン(forchlorfenuron)、ジベレリン(gibberellinacid)、イナベンフィド(inabenfide)、インドール酢酸(indolaceticacid)、インドール酪酸(indolbutyricacid)、マレイン酸ヒドラジド(maleichydrazide)、メフルイジド(mefluidide)、メピコート・クロリド(mepiquatchloride)、デシリアルコール(n-decanol)、パクロブトラゾール(pacllobutrazol)、プロヘキサジオン・カルシウム塩(prohexadione-calcium)、プロヒドロジャスモン(prohydrojasmon)、シントフェン(sintofen)、チジアズロン(thidiazuron)、トリアコンタノール(triacontanol)、トリネキサパック・エチル(trinexap

ac-ethyl)、ウニコナゾール(uniconazole)、ウニコナゾール-P(uniconazole-P)

[0423] 混合又は併用してもよい公知の薬害軽減化合物を例示する。

[0424] ベノキサコル(benoxacor)、フリラゾール(furilazole)、ジクロルミド(diclofornid)、ジシクロノン(dicyclonone)、DKA-24(N1, N2-ジアリル-N2-ジクロロアセチルグリシンアミド)、AD-67(4-ジクロロアセチル-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン)、PPG-1292(2, 2-ジクロロ-N-(1, 3-ジオキサン-2-イルメチル)-N-(2-プロペニル)アセトアミド)、R-29148(3-ジクロロアセチル-2, 2, 5-トリメチル-1, 3-オキサゾリジン)、クロキントセツトメキシル(cloquintocet-mexyl)、ナフトル酸無水物(1, 8-Naphthalic Anhydride)、メフェンピルージエチル(mefenpyr-diethyl)、メフェンピル(mefenpyr)、メフェンピルエチル(mefenpyr-ethyl)、フェンクロラゾール-エチル(fenchlorazole-ethyl)、フェンクロリム(fenclorim)、MG-191(2-ジクロロメチル-2-メチル-1, 3-ジオキサン)、シオメトリニル(cyometrinil)、フルラゾール(flurazole)、フルキソフェニム(fluxofenim)、イソキサジafen(isoxadifen)、イソキサジafen-エチル(isoxadifen-ethyl)、メコプロップ(mecoprop)、MCPA、ダイムロン(daimuron)、2, 4-D、MON 4660(コード番号)、オキサベトリニル(oxabetrinil)、シプロスルファミド(cyprosulfamide)、及び、TI-35(コード番号)。

[0425] 本発明の有害生物防除剤は、バッタ目害虫、アザミウマ目害虫、カメムシ目害虫、コウチュウ目害虫、ハエ目害虫、チョウ目害虫、ハチ目害虫、トビムシ目害虫、シミ目害虫、ゴキブリ目害虫。シロアリ目害虫、チャタテムシ目害虫、ハジラミ目害虫、シラミ目害虫、植物寄生性ダニ類、植物寄生性線虫類、植物寄生性軟体動物、その他の有害動物、不快動物、衛生害虫、寄生虫等の有害生物に対して、優れた防除効果を示す。そのような有害生物の例としては、以下の如き生物種を例示することができる。

[0426] バッタ目害虫としては、例えばキリギリス科のクサキリ(Ruspilia lineosa

) 等、コオロギ科のエンマコオロギ (*Teleogryllusemma*) 等、ケラ科のケラ (*Gryllotalpaorientalis*) 、バッタ科のコバネイナゴ (*Oxyahylaintricate*) 、トノサマバッタ (*Locustamigratoria*) 、マイグラトリーグラスホッパー (*Melanoplussanguinipes*) 等、オンブバッタ科のオンブバッタ (*Atractomorphalata*) 、マツムシ科のカヤコオロギ (*Euscyrtusjaponicus*) 、ノミバッタ科のノミバッタ (*Xyajaponicus*) 等を挙げることができる。

[0427] アザミウマ目害虫としては、例えばアザミウマ科のヒラズハナアザミウマ (*Frankliniellaintonsa*) 、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniellaoccidentalis*) 、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothripsdorsalis*) 、ミナミキイロアザミウマ (*Thripspalmi*) 、ネギアザミウマ (*Thripstabaci*) 等、クダアザミウマ科のカキクダアザミウマ (*Ponticulothripsdiospyrosi*) 、イネクダアザミウマ (*Haplothripsaculeatus*) 等を挙げることができる。

[0428] カメムシ目害虫としては、例えばセミ科のイワサキクサゼミ (*Moganniaminuta*) 等、アワフキムシ科のシロオビアワフキ (*Aphrophoraintermedia*) 等、ツノゼミ科のトビイロツノゼミ (*Machaerotypussibiricus*) 等、ヨコバイ科のフタテンヒメヨコバイ (*Arboridiaapicalis*) 、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoascaonukii*) 、ツマグロヨコバイ (*Nephrotettixcincticeps*) 、イナズマヨコバイ (*Reciliadorsalis*) 等、ヒシウンカ科のヒシウンカ (*Pentastiridiusapicalis*) 等、ウンカ科のヒメトビウンカ (*Laodelphaxstriatellus*) 、トビイロウンカ (*Nilaparvatalugens*) 、セジロウンカ (*Sogatellafurcifera*) 等、シマウンカ科のシマウンカ (*Nisianervosa*) 等、ハネナガウンカ科のサトウマダラウンカ (*Kamendakasaccharivora*) 等、コガラシウンカ科のレッドファンガスバック (*Achilusflammeus*) 等、ハゴロモ科のベッコウハゴロモ (*Orosangajaponicus*) 等、アオバハゴロモ科のトビイロハゴロモ (*Mimophantiamaritima*) 等、キジラミ科のナシキジラミ (*Cacopsyllapyrisuga*) 等、ヒメキジラミ科のマンゴーキジラミ (*Calophyamangiferae*) 等、フィロキセラ科のブドウネアブラムシ (*Daktulosphairavitifoliae*) 等、カサアブラムシ科のカラマツカサアブラムシ (*Adelgeslaricis*) 、ハリモミヒノカサアブラ

ムシ (*Adelgestsugae*) 等、アブラムシ科のエンドウヒゲナガアブラムシ (*Acyrthosiphonpisum*) 、ワタアブラムシ (*Aphisgossypii*) 、ユキヤナギアブラムシ (*Aphisspiraecola*) 、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphiserysimi*) 、モモアカアブラムシ (*Myzuspersicae*) 、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphisgraminum*) 、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphumpadi*) 等、コナジラミ科のミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthusspiniferus*) 、タバココナジラミ (*Bemisiatabaci*) 、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisiaargentifolii*) 、オンシツコナジラミ (*Trialeurodesvaporariorum*) 等、ワタフキカイガラムシ科のオオワラジカイガラムシ (*Drosichacorpulenta*) 、イセリアカイガラムシ (*Iceryapurchasi*) 等、コナカイガラムシ科のパイナップルコナカイガラムシ (*Dysmicoccusrevipes*) 、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcuscitri*) 、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcuscomstocki*) 等、カタカイガラムシ科のツノロウムシ (*Ceroplastesceriferus*) 等、カタカイガラモドキ科のカンシャカタカイガラモドキ (*Aclerdatakahashii*) 等、マルカイガラムシ科のアカマルカガラムシ (*Aonidiellaaurantii*) 、ナシマルカイガラムシ (*Diaspidiotusperniciosus*) 、ヤノネカイガラムシ (*Unaspisyanonensis*) 等、カスミカメムシ科のライガスバック (*Lygushesperus*) 、アカヒゲホソミドリカスミガメ (*Trigonotyluscaelestialium*) 等、グンバイムシ科のツツジグンバイ (*Stephanitispyrioides*) 、ナシグンバイ (*Stephanitisnashi*) 等、カメムシ科のトゲシラホシカメムシ (*Eysarcorisaeneus*) 、イネカメムシ (*Lagynotomuselongatus*) 、ミナミアオカメムシ (*Nezaraviridula*) 、チャバネアオカメムシ (*Plautiacrossota*) 等、マルカメムシ科のタイワンマルカメムシ (*Megacoptacribalaria*) 等、ナガカメムシ科のカンシャコバネナガカメムシ (*Cavaleriussaccharivorus*) 等、メダカナガカメムシ科のオオメダカナガカメムシ (*Malcusjaponicus*) 等、ホシカメムシ科のアカホシカメムシ (*Dysdercuscingulatus*) 等、ホソヘリカメムシ科のホソクモヘリカメムシ (*Leptocorisacuta*) 、クモヘリカメムシ (*Leptocorisachinensis*) 等、ヘリカメムシ科のオオクモヘリカメムシ (*Anacanthocorisstriicornis*) 等、ヒメヘリカメムシ

科のアカヒメヘリカメムシ (*Rhopalusmaculatus*) 等、トコジラミ科のトコジラミ (*Cimexlectularis*) 等を挙げることができる。

- [0429] コウチュウ目害虫としては、例えばコガネムシ科のドウガネブイブイ (*Anomaracuprea*)、ヒメコガネ (*Anomararufocuprea*)、マメコガネ (*Popilliajaponica*)、サイカブトムシ (*Oryctesrhinoceros*) 等、コメムシ科のトビイロナボソコメツキ (*Agriotesogurae*)、オキナワカンシャクシコメツキ (*Melanotusokinawensis*)、マルクビクシコメツキ (*Melanotusfortnumifortnumi*) 等、カツオブシムシ科のヒメマルカツオブシムシ (*Anthrenusverbasci*) 等、ナガシンクイムシ科のオオナガシンクイムシ (*Heterobostrychushamatipennis*) 等、シバンムシ科のジンサンシバンムシ (*Stegobiumpaniceum*) 等、ヒヨウホンムシ科のヒメヒヨウホンムシ (*Pitinusclavipes*) 等、コクヌスト科のコクヌスト (*Tenebroidesmanritanicus*) 等、カッコウムシ科のアカアシホシカムシ (*Necrobiarufipes*)、ケシキスイ科のクリヤケシキスイ (*Carpophilushemipterus*) 等、ホソヒラタムシ科のカブコブホソヒラタムシ (*Ahasverusadvena*) 等、チビヒラタムシ科のサビカクムネヒラタムシ (*Cryptolestesferrugineus*) 等、テントウムシ科のインゲンテントウ (*Epilachnavarivestis*)、ニジュウヤホシテントウ (*Henosepilachnavigintioctopunctata*) 等、ゴミムシダマシ科のチャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebriomolitor*)、コクヌストモドキ (*Triboliumcastaneum*) 等、ツチハンミョウ科のマメハンミョウ (*Epicautagorhami*) 等、カミキリムシ科のツヤハダゴマダラカミキリ (*Anophoraglabripennis*)、ブドウトラカミキリ (*Xylotrechuspyrrhoderus*)、マツノマダラカミキリ (*Monochamusalternatus*) 等、マメゾウムシ科のアズキゾウムシ (*Callosobruchuschinensis*) 等、ハムシ科のコロラドハムシ (*Leptinotarsadecemlineata*)、ウェスタンコーンルートワーム (*Diabroticavirgifera*)、ダイコンハムシ (*Phaedonbrassicae*)、キスジノミハムシ (*Phyllotretastriolata*) 等、ミツギリゾウムシ科のアリモドキゾウムシ (*Cylasformicarius*) 等、ゾウムシ科のアルファルファタコゾウムシ (*Hyperapostica*)、ヤサイゾウムシ (*Listroderescostirostris*)、イモゾウムシ (*Euscepespso*)

stfasciatus) 等、イネゾウムシ科のイネゾウムシ (*Echinochenemusbipunctatus*) 、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrusoryzophilus*) 等、オサゾウムシ科のコクゾウムシ (*Sitophiluszeamais*) 、シバオサゾウムシ (*Sphenophorusvenatus*) 等、キクイムシ科のマツノキクイムシ (*Tomicuspiniperda*) 等、ナガキクイムシ科のヤチダモノナガキクイムシ (*Crossotarsusniponicus*) 等、ヒラタキクイムシ科のヒラタキクイムシ (*Lyctusbrunneus*) 等を挙げることができる。

- [0430] ハエ目としては、例えばガガンボ科のキリウジガガンボ (*Tipulaaaino*) 等、ケバエ科のラブバッグ (*Plecianearctica*) 等、キノコバエ科のシイタケトンボキノコバエ (*Exechiaшиitakevora*) 等、クロバネキノコバエ科のジャガイモクロバネキノコバエ (*Phyxiascabiei*) 等、タマバエ科のダイズサヤタマバエ (*Asphondyliayushima*) 、ヘシアンバエ (*Mayetioladestructor*) 等、カバエ科のネッタイシマカ (*Aedesaegypti*) 、アカイエカ (*Culexpiapienspallens*) 等、ブユ科のウシブユ (*Simuliumtakahashii*) 等、ユスリカ科のイネユスリカ (*Chironomusoryzae*) 等、アブ科のキンメアブ (*Chrysopssuavis*) 、ウシアブ (*Tabanustrigonus*) 等、ハナアブ科のハイジマハナアブ (*Eumerusstrigatus*) 等、ミバエ科のミカンコミバエ (*Bactroceradorsalis*) 、オウトウハマダラミバエ (*Euphrantajaponica*) 、チチュウカイミバエ (*Ceratitiscapitata*) 等、ハモグリバエ科のマメハモグリバエ (*Liriomyzatrilobii*) 、ナモグリバエ (*Chromatomyiahorticola*) 等、キモグリバエ科のムギキモグリバエ (*Meromyzanigriventris*) 等、ショウジョウバエ科のオウトウショウジョウバエ (*Drosophilasuzukii*) 、キイロショウジョウバエ (*Drosophilamelano gaster*) 等、ミギワバエ科のイネミギワバエ (*Hydrelliagriseola*) 等、シラミバエ科のウマシラミバエ (*Hippoboscaequina*) 等、フンバエ科のササカワフンバエ (*Parallelpmmasasakawai*) 等、ハナバエ科のタマネギバエ (*Deliaantiqua*) 、タネバエ (*Deliaplatura*) 等、ヒメイエバエ科のヒメイエバエ (*Fanniacanicularis*) 等、イエバエ科のイエバエ (*Muscadomestica*) 、サシバエ (*Stomoxyscalcitrans*) 等、ニクバエ科のセンチニクバエ (*Sarcophagaper-*

egrina) 等、ウマバエ科のウマバエ (*Gasterophilusintestinalis*) 等、ウシバエ科のウシバエ (*Hypodermalineatum*) 等、ヒツジバエ科のヒツジバエ (*Oestrusovis*) 等を挙げることができる。

[0431] チョウ目としては、例えばコウモリガ科のコウモリガ (*Endoclitaexcrescens*) 等、ツヤコガ科のブドウツヤコガ (*Antispilaampelopsis*) 等、ボクトウガ科のゴマフボクトウ (*Zeuzeraleuconotum*) 等、ハマキガ科のミダレカクモンハマキ (*Archipsfuscocupreanus*) 、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyesoranafasciata*) 、ナシヒメヒンクイ (*Grapholitamolesta*) 、チャハマキ (*Homonamagnanima*) 、マメシンクイガ (*Leguminivoraglycinivorella*) 、コドリンガ (*Cydiapomonella*) 等、ホソハマキ科のブドウホソハマキ (*Eupoeciliaambiguaella*) 等、ミノガ科のミノガ (*Bambalinasp.*) 、チャミノガ (*Eumetaminuscula*) 等、ヒロズコガ科のコクガ (*Nemapogongranella*) 、イガ (*Tineatranslucens*) 等、チビガ科のナシチビガ (*Bucculatrixpyrivorella*) 等、ハモグリガ科のモモハモグリガ (*Lyonetiadlerkella*) 等、ホソガ科のチャノホソガ (*Caloptiliatheivora*) 、キンモンホソガ (*Phyllonorycterringoniella*) 等、コハモグリガ科のミカンハモグリガ (*Phylloconistiscitrella*) 等、アトヒゲコガ科のネギコガ (*Acrolepiopsissapporensis*) 等、スガ科のコナガ (*Plutellaxylostella*) 、リンゴスガ (*Yponomeutaorientalis*) 等、メムシガ科のリンゴヒメシンクイ (*Argyresthiaconjugella*) 等、スカシバガ科のブドウスカシバ (*Nokonaregalis*) 等、キバガ科のジャガイモガ (*Phthorimaeaoperculella*) 、バクガ (*Sitotrogacerealella*) 、ワタアカミムシ (*Pectinophoragossypiella*) 等、シンクイガ科のモモシンクイガ (*Carposinasasakii*) 等、マダラガ科のリンゴハマキクロバ (*IIIiberispruni*) 等、イラガ科のイラガ (*Monemaflavescens*) 等、ツトガ科のツトガ (*Ancylolomiajaponica*) 、ニカメイガ (*Chilosuppressalis*) 、コブノメイガ (*Cnaphalocrocismedinalis*) 、アワノメイガ (*Ostriniafurnacalis*) 、ヨーロピアンコーンボーラー (*Ostriniaubialis*) 等、メイガ科のスジマダラメイガ (*Cadra cautella*) 、ハチノスツヅリガ (*Galleriamellonella*) 等、トリバガ科のブドウトリバ (*N*

ippoptiliavitis) 等、アゲハチョウ科のアゲハ (*Papilioxuthus*) 等、シロチョウ科のモンシロチョウ (*Pierisrapae*) 等、セセリチョウ科のイチモンジセセリ (*Parnaraguttataguttata*) 等、シャクガ科のヨモギエダシャク (*Ascotisselenaria*) 等、カレハガ科のマツカレハ (*Dendrolimusspectabilis*) 、オビカレハ (*Malacosomaneustriumtestaceum*) 等、スズメガ科のエビガラスズメ (*Agriusconvolvuli*) 等、ドクガ科のチャドクガ (*Arnapseudoconspersa*) 、マイマイガ (*Lymantriadispar*) 等、ヒトリガ科のアメリカシロヒトリ (*Hyphantriacunea*) 等、ヤガ科のタマナヤガ (*Agrotisipsilon*) 、タマナギンウワバ (*Autographanigrisigna*) 、オオタバコガ (*Helicoverpaarmigera*) 、コーンボールワーム (*Helicoverpazea*) 、タバコバドワーム (*Heliothisvirescens*) 、シロイチモジョトウ (*Spodopteraexigua*) 、ハスモンヨトウ (*Spodopteralitura*) 等を挙げることができる。

- [0432] ハチ目としては、例えばミフシハバチ科のチュウレンジハバチ (*Argepagan* a) 等、ハバチ科のクリハバチ (*Apethymuskuri*) 、カブラハバチ (*Athaliarosaeruficornis*) 等、タマバチ科のクリタマバチ (*Dryocosmuskuriphilus*) 等、スズメバチ科のキイロスズメバチ (*Vespasimillimaxanthoptera*) 等、アリ科のヒアリ (*Solenopsisinvicta*) 等、ハカリバチ科のバラハカリバチ (*Megachilennipponica*) 等を挙げることができる。
- [0433] トビムシ目害虫としては、例えばマルトビムシ科のキボシマルトビムシ (*Bourletiellahortensis*) 等を挙げることができる。
- [0434] シミ目害虫としては、例えばシミ科のセイヨウシミ (*Lepismasaccharina*) 、ヤマトシミ (*Ctenolepismavillosa*) 等を挙げることができる。
- [0435] ゴキブリ目害虫としては、例えばゴキブリ科のワモンゴキブリ (*Periplanetaamericana*) 、チャバネゴキブリ科のチャバネゴキブリ (*Blattellagermanica*) 等を挙げることができる。
- [0436] シロアリ目害虫としては、例えばレイビシロアリ科のアメリカカンザイシロアリ (*Incisitermesminor*) 等、ミゾガラシロアリ科のイエシロアリ (*Coptotermesformosanus*) 等、シロアリ科のタイワンシロアリ (*Odontotermesform*

osanus) 等を挙げることができる。

- [0437] チャタテムシ目害虫としては、例えばコチャタテ科のコチャタテ (*Trogium pulsatorium*) 等、コナチャタテ科のウスグロチャタテ (*Liposceliscorrodens*) 等を挙げることができる。
- [0438] ハジラミ目害虫としては、例えばトリハジラミ科のニワトリナガハジラミ 等、ケモノハジラミ科のウシハジラミ (*Damaliniabovis*) 等を挙げができる。
- [0439] シラミ目害虫としては、例えばケモノジラミ科のブタジラミ (*Haematopinus suis*) 等、ヒトジラミ科のヒトジラミ (*Pediculushumanus*) 等、ケモノホソジラミ科のイヌジラミ (*Linognathussetosus*) 等、ケジラミ科のケジラミ等を挙げができる。
- [0440] 植物寄生性ダニ類としては、例えばハシリダニ科のムギダニ (*Penthaleus major*) 等、ホコリダニ科のシクラメンホコリダニ (*Phytomuspallidus*) 、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemuslatus*) 等、シラミダニ科のシラミダニの一種 (*Siteroptessp.*) 等、ヒメハダニ科のブドウヒメハダニ (*Brevipalpuslewisi*) 等、ケナガハダニ科のナミケナガハダニ (*Tuckerellapavoniformis*) 等、ハダニ科のアンズアケハダニ (*Eotetranychusboreus*) 、ミカンハダニ (*Panonychuscitri*) 、リンゴハダニ (*Panonychusulmi*) 、ナミハダニ (*Tetranychusurticae*) 、カンザワハダニ (*Tetranychuskanzawai*) 等、ナガクダフシダニ科のマツフシダニ (*Trisetacuspinii*) 等、フシダニ科のミカンサビダニ (*Aculopspelekassi*) 、ナシサビダニ (*Epitrimeruspyri*) 、シトラスラストマイト (*Phyllocoptraoleivora*) 等、ハリナガフシダニ科のイヌツゲフシダニ (*Diptacuscrenatae*) 等、コナダニ科のムギコナダニ (*Aleuroglyphusovatus*) 、ケナガコナダニ (*Tyrophagusputrescentiae*) 、ロビンネダニ (*Rhizoglyphusrobini*) 等を挙げができる。
- [0441] 植物寄生性線虫類としては、例えばロンギドルス科のブドウオオハリセンチュウ (*Xiphinema index*) 等、トリコドルス科のヒメユミハリセンチュウ (*Paratrichodorusminor*) 等、ラブディティス科の一種 (*Rhabditellasp.*) 等、

ティレンクス科の一種 (*Aglenchus* spp.) 等、ティロドルス科の一種 (*Cephalenchus* spp.) 等、アングイナ科のイチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*) 、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*) 等、ホプロライムス科のニセフクロセンチュウ (*Rotylenchulus reniformis*) 、ナミラセンセンチュウ (*Helicotylenchus dihystera*) 等、パラティレンクス科のチャピンセンチュウ (*Paratylenchus curvitatus*) 等、メロイドギネ科のサツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) 、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*) 等、ヘテロデラ科のジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 、ダイズシストセンチュウ (*Heteroderaglycines*) 等、テロティレンクス科のナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*) 等、プシレンクス科のラシンセンチュウの一種 (*Psilenchus* spp.) 等、クリコネマ科のワセントセンチュウ類の一種 (*Criconemoides* spp.) 等、ティレンクルス科のミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*) 等、スフェロネマ科のツバキマルセンチュウ (*Sphaeronema camelliae*) 等、プラティレンクス科のカンキツネモグリセンチュウ (*Sphaeronema camelliae*) 、カンキツネモグリセンチュウ (*Radopholus citrophilus*) 、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) 、ニセネコブセンチュウ (*Nacobbus aberrans*) 、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*) 、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*) 等、イオトンキウム科のヒラタケヒダコブセンチュウ (*Iotonchium ungulatum*) 等、アフェレンクス科のニセネグサレセンチュウ (*Aphelenchus avenae*) 等、アフェレンコイデス科のイネセンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*) 、イチゴセンチュウ (*Aphelenchoides fragariae*) 等、パラシタフェレンクス科のマツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 等を挙げることができる。

[0442] 植物寄生性軟体動物としては、例えばタニシモドキ科のスクミリンゴガイ (*Pomaceacanaliculata*) 等、アシヒダナメクジ科のアシヒダナメクジ (*Leavia caulis alte*) 等、アフリカマイマイ科のアフリカマイマイ (*Achatina fulica*) 等、ナメクジ科のフタスジナメクジ (*Meghimatium umbilicatum*) 等、オカモ

ノアラガイ科のオカモノアラガイ (*Succinealauta*) 等、パツラマイマイ科のパツラマイマイ (*Discuspauper*) 等、コハクガイ科のエゾコハクガイ (*Zonitoidesyessoensis*) 等、コウラナメクジ科のコウラナメクジ (*Limaxflavus*) 、ノハラナメクジ (*Derocerasreticulatum*) 等、ベッコウマイマイ科のハリマキビ (*Parakaliellaharimensis*) 等、オナジマイマイ科のウスカワマイマイ (*Acustadespectasieboldiana*) 、オナジマイマイ (*Bradybaenasimilaris*) 等を挙げることができる。

- [0443] その他の有害動物、不快動物、衛生害虫、家畜害虫、寄生虫等の有害生物としては、例えば、ダニ目のオオサシダニ科のトリサシダニ (*Ornithonyssussylvium*) 等、ヘギイタダニ科のミツバチヘギイタダニ (*Varroajacobsoni*) 等、ワクモ科のワクモ (*Dermanyssusgallinae*) 等、オオサシダニ科のトリサシダニ (*Ornithonyssussylvium*) 等、マダニ科のオウシマダニ (*Boophilusmicroplus*) 、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalusanguineus*) 、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalislongicornis*) 等、ヒゼンダニ科のヒゼンダニ (*Sarcoptesscabiesi*) 等、等脚目ダンゴムシ科のオカダンゴムシ (*Armadillidiumvulgare*) 等、エビ目アメリカザリガニ科のアメリカザリガニ (*Procambarusclarkii*) 等、ワラジムシ目ワラジムシ科のオカワラジムシ (*Armadillidiumvulgare*) 等、ゲジ目ゲジ科のゲジやオオムカデ目トビズムカデ (*Scolopendrasubspinipes*) 等のムカデ害虫目、オビヤスデ目ヤケヤスデ科のヤケヤスデ (*Oxidusgracilis*) 等のヤスデ綱害虫、クモ目ヒメグモ科のセアカゴケグモ (*Theridiidaehasseltii*) 等、クモ目フクログモ科のカバキコマチグモ (*Chiracanthiumjaponicum*) 等、サソリ目のアフガンデストーカー (*Androctonuscrassicauda*) 等、線形動物内部寄生虫である回虫類 (*Ascarislumbricoides*) 等、ぎょう虫類 (*Syphaciasp.*) 等、フィラリア類 (*Wuchereriabancrofti*) 等、扁形動物内部寄生虫である肝臓ジストマ (*Distomumsp.*) 、肺臓ジストマ (*Paragonimuswestermanii*) 、横川吸虫 (*Metagonimusyokokawai*) 、日本住血吸虫 (*Schistosomaorientale*) 、有鉤条虫 (*Taeniasolium*) 、無鉤条虫 (*Taeniarhynchusaginatus*) 、エキノコックス (*Echinococcus*) 、広

節裂頭条虫 (*Diphyllobothrium latum*) 等を挙げることができる。

[0444] 本発明の有害生物防除剤は、既存の有害生物防除剤に抵抗性を獲得した、前記に例示した有害生物等にも防除効果を示す。

[0445] 又、本発明の有害生物防除剤は、遺伝子組換え、人工交配等で害虫耐性、病害耐性、除草剤耐性等の特性を獲得した植物に使用することもできる。

[0446] 次に、本発明化合物の製造方法、製剤方法並びに用途を下記の実施例で詳細に説明するが、本発明はこれら実施例に何ら制約されるものではない。又、本発明化合物の製造中間体の製造法も併せて記載する。

実施例

[0447] [実施例 1]

1-[O-メチル-{2-(3-フルオロフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール（本発明化合物番号 I-73）の製造

[0448] (1) 2-(3-フルオロフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボン酸 1. 16 g (5. 60 ミリモル) と触媒量の N, N-ジメチルホルムアミドとを塩化チオニル (15 ml) に加え、1. 5 時間還流した。反応混合物を減圧下濃縮して、残渣を酢酸エチルに溶解し、O-メチルヒドロキシアミン塩酸塩 0. 94 g (11 ミリモル) を加え攪拌した。反応混合物へ炭酸カリウム 2. 3 g (17 ミリモル) を少量ずつ、氷と一緒に加え、室温で 2 時間攪拌した。この反応混合物に希塩酸を注加して、混合液を弱酸性にし、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、減圧下濃縮し、2-(3-フルオロフェニル)-N-メトキシ-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミド 1. 38 g (収率：定量的)を得た。

尚、2-(3-フルオロフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボン酸は、ジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー (Journal of Heterocyclic Chemistry) 第 1561 頁～第 1564 頁 (1983 年) に記載の方法に準じて製造した。

¹H-NMRデータ (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 3.94 (3H, s), 7.11-7.13 (1H, m), 7.46-7.52 (1H, m), 7.80-7.90 (2H, m), 8.31 (1H, s), 9.31 (1H, s)

[0449] (2) 前記(1)で得られた2-(3-フルオロフェニル)-N-メトキシ-2H-1,2,3-トリアゾール-4-カルボキサミド1.38g (5.84ミリモル)のアセトニトリル溶液(10ml)に、トリフェニルホスフイン4.4g (17ミリモル)と四塩化炭素5.2g (33ミリモル)を加えて12時間還流した。反応混合物を減圧下に濃縮して、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、乳白色粉末のO-メチル-{2-(3-フルオロフェニル)-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイルクロリド1.02g (収率: 68%)を得た。

¹H-NMRデータ (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 4.15 (3H, s), 7.07-7.12 (1H, m), 7.42-7.50 (1H, m), 7.84-7.94 (2H, m), 8.09 (1H, s)

[0450] (3) 前記(2)で得られたO-メチル-{2-(3-フルオロフェニル)-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイルクロリド1.02g (4.00ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド溶液(10ml)に、1,2,4-トリアゾールO.41 (5.9ミリモル)と炭酸カリウム1.1g (8.0ミリモル)を加え、80°Cに加熱し、5時間攪拌した。反応混合物を室温に戻した後、飽和食塩水にあけ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。無機物を濾別した後、減圧下に濃縮した。得られた粗結晶を再結晶(クロロホルム/ヘキサン)により精製して、標題化合物O.40g (収率35%)を得た。

[0451] [実施例2]

1-[O-メチル-{2-(4-フルオロフェニル)-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]-1H-1,2,4-トリアゾール(本発明化合物番号II-74)の製造

[0452] (1) ジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー (Journal of Heterocyclic Chemistry) 第1561頁～第1564頁 (1983年) に記

載の方法に準じて製造された2-(4-フルオロフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボニトリル1. 20 g (6. 38ミリモル) のメタノール溶液 (10 ml) に、塩酸ヒドロキシルアンモニウム0. 58 g (8. 3ミリモル) と炭酸カリウム1. 1 g (8. 0ミリモル) を加えて3時間還流した。反応混合物を減圧下に濃縮して、得られた残渣に食塩水と酢酸エチルを加え、抽出分離して得られた有機層を、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。無機物を濾別した後、減圧下に濃縮してN-ヒドロキシ-2-(4-フルオロフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミジン1. 13 g (収率80%)を得た。

¹H-NMRデータ (CDCl₃+DMSO-d₆/TMS δ (ppm)) : 5.25 (2H, s), 7.15-7.23 (2H, m), 8.02-8.08 (2H, m), 9.69 (1H, s)

[0453] (2) 60 wt %水素化ナトリウム0. 17 g (4. 3ミリモル) をN,N-ジメチルホルムアミド (5 ml) に懸濁させた混合物に、前記(1)で得られたN-ヒドロキシ-2-(4-フルオロフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミジン0. 96 g (4. 3ミリモル) のN,N-ジメチルホルムアミド溶液 (10 ml) を、氷冷下で滴下した。室温で30分攪拌後、再び氷冷下でヨウ化エチル0. 74 g (4. 7ミリモル) を滴下した。室温で2時間攪拌後、飽和食塩水にあけ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。無機物を濾別した後、減圧下に濃縮して得られた残渣であるN-エトキシ-2-(4-フルオロフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミジンと酢酸10 ml 及び濃塩酸20 ml を混合した。得られた溶液へ氷冷下、亜硝酸ナトリウム0. 59 g (8. 6ミリモル) の水溶液を滴下した。室温で2時間攪拌後、析出した結晶を濾過により採取し、水洗した。減圧下乾燥し、O-エチル-[2-(4-フルオロフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル]カルボヒドロキシモイルクロリド0. 86 g (収率74%)を得た。

¹H-NMRデータ (CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 1.41 (3H, s), 4.40 (2H, q), 7.1

5-7. 21 (2H, m), 8. 06-8. 11 (2H, m)

[0454] (3) 前記(2)で得られたO-エチル-[2-(4-フルオロフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル]カルボヒドロキシモイルクロリド0. 40g (1. 5ミリモル)のN, N-ジメチルホルムアミド溶液(5mL)に、1, 2, 4-トリアゾール0. 19g (2. 3ミリモル)と炭酸カリウム1. 1g (3. 0ミリモル)を加え、80°Cに加熱し5時間攪拌した。反応混合物を室温に戻した後、飽和食塩水にあけ、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、無機物を濾別した後、減圧下に濃縮した。得られた残渣を再結晶(クロロホルム/ヘキサン)により生成して、標題化合物0. 29g (収率64%)を得た。

[0455] [実施例3]

1-[O-メチル-{3-(3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル}カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール(本発明化合物番号IV-73)の製造

[0456] (1) リービッヒアナーレンデルケミー(Liebigs Annalender Chemie)第48頁～第65頁(1984年)に記載の方法に準じて製造された5-ヒドロキシメチル-3-(3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール1. 2g (5. 8ミリモル)のベンゼン溶液(50mL)に、二酸化マンガン2. 2g (25ミリモル)を加えて、5時間還流した。反応混合物を室温に戻した後、無機物を濾別した。ろ液を減圧下濃縮し、3-(3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-カルバルデヒド1. 09g (収率: 91%)を得た。

[0457] (2) 前記(1)で得られた3-(3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-カルバルデヒド1. 09g (5. 3ミリモル)のエタノール溶液(10mL)に、O-メチルヒドロキシアミン塩酸塩0. 49g (5. 9ミリモル)と酢酸ナトリウム0. 52g (6. 3ミリモル)を加えて3時間還流した。反応混合物を減圧下に濃縮して得られた残渣に食塩水と酢酸エチルを加え、抽出分離して得られた有機層を、無水

硫酸マグネシウムで乾燥した。無機物を濾別した後、減圧下に濃縮して3-(3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-5-カルバルデヒド オーメチルオキシム1.04g(収率83%)を得た。

[0458] (3) 前記(2)で得られた3-(3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-5-カルバルデヒド オーメチルオキシム1.04g(4.4ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド溶液(50mL)に、N-クロロ口こはく酸イミド2.4g(18ミリモル)を加えて60°Cで3時間攪拌した。反応混合物を室温に戻した後、水にあけ、酢酸エチルで抽出して得られた有機層を、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。無機物を濾別した後、減圧下に濃縮して得られた残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:6)により精製し、オーメチル-[3-(3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]カルボヒドロキシモイルクロリド0.65g(収率55%)を得た。

¹H-NMRデータ($\text{CDCl}_3/\text{TMS} \delta$ (ppm)) : 4.13(3H,s), 4.19(3H,s), 7.06-7.12(1H,m), 7.36-7.43(1H,m), 7.75-7.91(2H,m)

[0459] (4) 前記(3)で得られた、オーメチル-[3-(3-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル]カルボヒドロキシモイルクロリド0.30g(1.1ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド溶液(5mL)に、1,2,4-トリアゾール0.12(1.7ミリモル)と炭酸カリウム0.30g(2.2ミリモル)を加え、80°Cに加熱し2時間攪拌した。反応混合物を室温に戻した後、飽和食塩水にあけ、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、無機物を濾別した後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)により精製して、標題化合物0.22g(収率67%)を得た。

[0460] [実施例4]

1-[O-メチル-{3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル}カルボヒドロキシモイル]-1H-1,2,4-トリアゾール(本発明化合物番号IV-74)の製造

[0461] (1) ジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティ・パーキン・ランスアクションズ 1 (Journal of the Chemical Society Perkin Transactions 1) 第2235頁～第2239頁(1987年)に記載の方法に準じて製造された1-(エトキシカルボニルカルボヒドロキシモイル)-1H-1,2,4-トリアゾール37g(0.20モル)のN,N-ジメチルホルムアミド溶液(200mL)に、ヨウ化メチル28.6g(0.20モル)と炭酸カリウム42g(0.30モル)を加え、室温にて3時間攪拌した。反応混合物を水にあけ、酢酸エチルで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。無機物を濾別した後、減圧下に濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:8)により精製して1-(O-メチルエトキシカルボニルカルボヒドロキシモイル)-1H-1,2,4-トリアゾール19.4g(収率48%)を得た。

¹H-NMRデータ(CDCl_3/TMS δ (ppm)) : 1.40 (3H, t), 4.16 (3H, s), 4.44 (2H, q), 8.07 (1H, s), 8.75 (1H, s)

[0462] (2) 前記(1)で得られた1-(O-メチルエトキシカルボニルカルボヒドロキシモイル)-1H-1,2,4-トリアゾール15.85g(80ミリモル)をメタノール100mLに溶解し、アンモニア水30mLを加え、室温で1時間攪拌した。溶媒を減圧留去し、得られた残渣を塩化メチレン100mLに懸濁し、ピリジン19g(240ミリモル)を加えた後、無水トリフルオロ酢酸50.4g(240ミリモル)を氷冷下に滴下した。滴下終了後、室温で一晩攪拌した。反応溶液を減圧下に濃縮し、残渣に塩化メチレンを加え、有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液、クエン酸水溶液、塩化ナトリウム水溶液で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:2)で精製し、1-(O-メチルシアノカルボヒドロキシモイル)

—1H—1, 2, 4—トリアゾール 7. 49 g (収率 62%) を得た。

¹H-NMR データ ($\text{CDCl}_3/\text{TMS} \delta$ (ppm)) : 4.30 (3H, s), 8.11 (1H, s), 9.09 (1H, s)

[0463] (3) 前記(2)で得られた 1-(O-メチルシアノカルボヒドロキシモイル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール 0.8 g (5.29ミリモル) をメタノール 20mL に溶解し、28%ナトリウムメトキシドメタノール溶液 0.1 g (0.52ミリモル) を加え、室温で 5 時間攪拌した。反応溶液に 4-フルオロ-1-N'-メチルベンゾヒドラゾンアミド塩酸塩 1.07 g (5.29ミリモル)、トリエチルアミン 0.53 g (5.29ミリモル)、酢酸 0.47 g (7.94ミリモル) を順次加えた。室温で一晩攪拌し、反応溶液を減圧下に濃縮し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル:ヘキサン = 1:2~3:1) で精製し、標題化合物 0.36 g (収率 23%) を得た。

[0464] [実施例 5]

1-[O-メチル-(3-ベンジル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール (本発明化合物番号 I V-206) の製造

(1) ヒドラジン 1 水和物 0.41 g (8.26ミリモル) をエタノール 5 mL に溶解し、氷冷下で 1-(O-メチルエトキシカルボニルカルボヒドロキシモイル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール 1.64 g (8.26ミリモル) をエタノール 5 mL に溶解した溶液を滴下した。滴下終了後、反応温度を室温まで昇温し、一晩攪拌した。溶媒を減圧下留去することで 1-(O-メチルヒドラジノカルボニルカルボヒドロキシモイル)-1H-1, 2, 4-トリアゾール 1.54 g (収率 100%) を得た。

[0465] (2) フェニルアセトニトリル 1.0 g (8.54ミリモル) をエタノール 5 mL に溶解し、反応温度が 20°C を越えないように注意しながら、塩化アセチルを 4 mL 加えた。室温で一晩攪拌後、反応溶液を減圧下に濃縮した。得られた残渣をエタノール 20 mL に溶解し、前記(1)で得られた 1-

○—メチルヒドラジノカルボニルカルボヒドロキシモイル) —1H—1, 2, 4—トリアゾール 1. 6 g (8. 54ミリモル) をエタノール 15mL に溶解させた溶液と、ジイソプロピルエチルアミン 16. 5 g (128ミリモル) の混合溶液を加え、70°Cで一晩攪拌した。反応溶液を減圧下に濃縮し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : メタノール = 20 : 1) で精製し、標題化合物 1. 94 g (収率 80%) を得た。

[0466] [実施例 6]

1—[○—メチル—(3—ベンジル—1—メチル—1H—1, 2, 4—トリアゾール—5—イル) カルボヒドロキシモイル] —1H—1, 2, 4—トリアゾール (本発明化合物番号 I V—101) と 1—[○—メチル—(5—ベンジル—1—メチル—1H—1, 2, 4—トリアゾール—3—イル) カルボヒドロキシモイル] —1H—1, 2, 4—トリアゾール (本発明化合物番号 V I I—101) の製造

[0467] 1—[○—メチル—(3—ベンジル—1H—1, 2, 4—トリアゾール—5—イル) カルボヒドロキシモイル] —1H—1, 2, 4—トリアゾール 1. 94 g をジメチルホルムアミドに溶解し、炭酸カリウム 1. 04 g (7. 37ミリモル) 、ヨウ化メチル 1. 27 g (9. 22ミリモル) を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製し、1—[○—メチル—(3—ベンジル—1—メチル—1H—1, 2, 4—トリアゾール—5—イル) カルボヒドロキシモイル] —1H—1, 2, 4—トリアゾール 0. 61 g (収率 33%) と 1—[○—メチル—(5—ベンジル—1—メチル—1H—1, 2, 4—トリアゾール—3—イル) カルボヒドロキシモイル] —1H—1, 2, 4—トリアゾール 0. 95 g (収率 52%) を得た。

[0468] [実施例 7]

1—[○—メチル—(3—イソペンチル—1—メチル—1H—1, 2, 4

ートリアゾール-5-イル)カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール(本発明化合物番号IV-11)、1-[O-メチル-(5-イソペンチル-1-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール(本発明化合物番号VII-11)及び1-[O-メチル-(3-イソペンチル-4-メチル-4H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール(本発明化合物番号XVI-11)の製造

[0469] 実施例4に準じて得られた1-[O-メチル-(3-イソペンチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール2.79g(10.6ミリモル)をジメチルスルホキシド(30ml)に溶解し、炭酸カリウム1.75g(12.7ミリモル)、ヨウ化メチル1.79g(12.7ミリモル)を加え、室温で2時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)で精製し、1-[O-メチル-(3-イソペンチル-1-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール0.94g(収率32%)と、1-[O-メチル-(5-イソペンチル-1-メチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール1.53g(収率52%)及び1-[O-メチル-(3-イソペンチル-4-メチル-4H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール0.11g(収率4%)を得た。

[0470] [実施例8]

1-[O-メチル-{2-(3-メチルフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]-5-メルカプト-1H-1, 2, 4-トリアゾール(本発明化合物番号XXII-6)の製造

[0471] 実施例 1 に準じて得られた 1-[O-メチル-{2-(3-メチルフェニル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール 0.39 g (1.4 ミリモル) をテトラヒドロフラン 10 mL に溶解し、-60°C に冷却した混合液へ、1.6 M n-ブチルリチウムヘキサン溶液 1.0 mL (1.6 ミリモル) を滴下し、1 時間攪拌した。得られた反応溶液へ硫黄粉末 0.06 g (1.9 ミリモル) を加え、更に 2 時間攪拌した。反応終結を薄層クロマトグラフィーで確認後、酢酸 1 mL とメタノール 1 mL の混合物を滴下した。室温に戻した後、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 1, 5) で精製し、標題化合物 0.31 g (収率 71%) を得た。

[0472] [実施例 9]

1-[O-エチル-{2-(2-メチルブチル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]-2-シアノイミダゾール (本発明化合物番号 X X I I - 74, 75) の製造

[0473] (1) 実施例 1 に準じて得られた 1-[O-エチル-{2-(2-メチルブチル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]イミダゾール 0.86 g (3.1 ミリモル) をテトラヒドロフラン 10 mL に溶解し -60°C に冷却した混合液へ、1.6 M n-ブチルリチウムヘキサン溶液 2.1 mL (3.4 ミリモル) を滴下し、1 時間攪拌した。得られた反応溶液へ N, N-ジメチルホルムアミド (DMF) 0.34 g (4.7 ミリモル) を滴下し、更に 3 時間攪拌した。反応終結を薄層クロマトグラフィーで確認後、酢酸 1 mL とメタノール 1 mL の混合物を滴下した。室温に戻した後、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、1-[O-エチル-{2-(2-メチルブチル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]-2-ホルミルイミダゾールを得た。

[0474] (2) 前記(1)で得られた1-[O-エチル-{2-(2-メチルブチル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]-2-ホルミルイミダゾールのエタノール溶液(10mL)に、ヒドロキシアミニン塩酸塩0.43g(6.2ミリモル)を加えて、室温にて12時間攪拌した。反応混合物を減圧下に濃縮して得られた残渣に食塩水と酢酸エチルを加え、抽出分離して得られた有機層を、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。無機物を濾別した後、減圧下に濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:3)で精製し、1-[O-エチル-{2-(2-メチルブチル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]-2-ヒドロキシイミノメチルイミダゾール0.53g(収率54%)を得た。

¹H-NMRデータ(CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 0.82 (3H, d), 0.88 (3H, t), 1.1-1.3 (2H, m), 1.25 (3H, t), 2.0-2.1 (1H, m), 4.1-4.4 (4H, m), 7.04 (1H, s), 7.25 (1H, s), 7.75 (1H, s), 8.01, (1H, s), 9.94 (1H, s)

[0475] (3) 前記(2)で得られた1-[O-エチル-{2-(2-メチルブチル)-2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル}カルボヒドロキシモイル]-2-ヒドロキシイミノメチルイミダゾール0.44g(1.4ミリモル)をジエチルエーテル10mLに溶解した混合液へ、塩化チオニルを0.33g(2.8ミリモル)室温にて滴下し、5時間攪拌した。反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=1:4)で精製し、標題化合物0.28g(収率67%)を得た。

¹H-NMRデータ(CDCl₃/TMS δ (ppm)) : 0.87 (3H, d), 0.92 (3H, t), 1.1-1.4 (2H, m), 1.37 (3H, t), 2.08-2.17 (1H, m), 4.0-4.5 (4H, m), 7.26 (1H, s), 7.33 (1H, s), 7.94 (1H, s).

[0476] 前記実施例に準じて合成した本発明化合物[I]の構造式と物性値を、前記実施例を含め表140～表145に示す。尚、化合物番号は以後の記載に

において参照される。

[0477] [表140]

化合物番号		融点(°C)又は屈折率(n_D^{20})
I-11	屈折率	1.5218
I-12	融点	42-44
I-18	融点	83-85
I-21	屈折率	1.5413
I-68	融点	114-116
I-72	融点	78-80
I-73	融点	112-115
I-74	融点	176-179
I-76	融点	62-65
I-91	融点	144-146
I-105	屈折率	1.5419
I-115	融点	126-129
I-117	融点	134-136
I-132	融点	134-137
I-133	融点	167-170
I-140	屈折率	1.5236
I-143	屈折率	1.5424
I-157	融点	100-101
I-202	屈折率	1.5380
I-203	融点	104-105
I-204	融点	176-178
II-7	屈折率	1.5202
II-9	融点	77-78
II-11	屈折率	1.5171
II-12	屈折率	1.5170
II-18	屈折率	1.5129
II-30	融点	78-81
II-68	融点	102-104
II-72	融点	68-69
II-73	融点	83-85
II-74	融点	93-95
II-76	融点	95-98
II-79	融点	87-88
II-134	融点	130-133
II-157	融点	103-105
II-190	融点	49-52
II-202	屈折率	1.5172
II-203	屈折率	1.5213
II-204	融点	114-117

[0478]

[表141]

化合物番号	融点(°C)又は屈折率(n_D^{20})	
III-4	屈折率	1.5213
III-6	屈折率	1.5138
III-7	融点	65-68
III-8	屈折率	1.515
III-9	融点	61-62
III-11	融点	38-39
III-12	融点	55-56
III-13	屈折率	1.5088
III-18	融点	55-56
III-30	融点	63-65
III-73	融点	95-97
III-134	融点	140-143
III-188		測定不可
III-189	屈折率	1.5202
III-190	融点	51-52
III-195		測定不可
III-203		測定不可
III-204	屈折率	1.5062
III-205	屈折率	1.5342
III-206	融点	58-61
III-207	融点	88-89
III-208	融点	0-30
IV-7	屈折率	1.5224
IV-9	屈折率	1.5232
IV-11	屈折率	1.5198
IV-18	屈折率	1.5157
IV-30	屈折率	1.5420
IV-68	融点	124-126
IV-72	融点	112-114
IV-73	屈折率	1.5892
IV-74	融点	137-139
IV-76	融点	71-74
IV-77	融点	114-117
IV-79	融点	139-142
IV-94	融点	146-149
IV-95	融点	226-228
IV-99	屈折率	1.5635
IV-101	屈折率	1.5782
IV-102	屈折率	1.5724

[0479]

[表142]

化合物番号	融点(°C)又は屈折率(n_D^{20})	
IV-115	融点	119-122
IV-117	屈折率	1.5753
IV-119	屈折率	1.5880
IV-124	融点	150-153
IV-125		測定不可
IV-128	融点	113-115
IV-129	融点	88-91
IV-130	融点	109-112
IV-131	融点	99-102
IV-132	融点	97-100
IV-133	融点	111-114
IV-134	融点	190-193
IV-136	融点	179-180
IV-138	融点	110-113
IV-139	融点	150-153
IV-140	融点	166-169
IV-170	融点	172-175
IV-172	融点	204-207
IV-174	融点	110-111
IV-176	屈折率	1.5190
IV-180	融点	224-227
IV-183	融点	215-218
IV-196	融点	141-142
IV-203	融点	167-170
IV-204	融点	86-88
IV-205	融点	101-102
IV-206		測定不可
IV-207	融点	129-131
IV-208	融点	212-215
IV-209	融点	129-131
IV-210	屈折率	1.5800
IV-211	融点	204-207
IV-212		測定不可
IV-213	融点	234-237
IV-214		測定不可
IV-215	融点	124-127
IV-216	融点	117-120
IV-217	融点	225-228
IV-218	融点	250-253

[0480]

[表143]

化合物番号	融点(°C)又は屈折率(n_D^{20})
IV-219	融点 223-226
IV-220	融点 222-225
IV-221	融点 246-249
IV-222	融点 122-125
IV-223	測定不可
IV-224	融点 110-113
IV-225	融点 180-183
IV-226	融点 148-149
IV-227	融点 99-102
IV-228	融点 129-132
IV-229	融点 227-230
IV-230	融点 237-240
IV-231	融点 179-182
IV-232	融点 130-133
V-137	融点 149-152
V-203	融点 129-132
V-204	融点 142-145
V-205	融点 128-129
V-206	融点 199-201
V-207	融点 151-154
VI-12	屈折率 1.5082
VI-18	屈折率 1.5062
VI-73	屈折率 1.5680
VI-138	融点 175-177
VI-175	融点 180-183
VI-176	融点 171-174
VI-180	融点 169-172
VII-7	融点 81-84
VII-9	融点 156-158
VII-11	屈折率 1.5240
VII-18	屈折率 1.5220
VII-30	融点 95-96
VII-74	融点 103-105
VII-77	融点 110-113
VII-95	屈折率 1.5920
VII-101	融点 114-116
VII-102	融点 110-112
VII-133	屈折率 1.5800
VII-136	測定不可

[0481]

[表144]

化合物番号	融点(°C)又は屈折率(n_D^{20})	
VII-138	融点	167-170
VII-184	融点	111-112
VII-185	融点	135-137
VII-186		測定不可
VII-187	屈折率	1.5740
VII-188	屈折率	1.5840
VII-189		測定不可
VII-190		測定不可
VII-191	屈折率	1.5950
VII-192	融点	135-138
VII-193	屈折率	1.5960
VII-194	融点	134-137
VIII-137	融点	140-143
VIII-184	融点	161-164
VIII-185		測定不可
VIII-186	融点	123-126
IX-12	融点	91-94
IX-18	融点	82-84
X-21	屈折率	1.5400
X-137	屈折率	1.5380
XI-68	融点	146-147
XI-129	融点	108-110
XI-130	融点	187-190
XIII-18	屈折率	1.5240
XIII-158	融点	140-141
XIV-11	屈折率	1.5203
XIV-18	融点	80-81
XIV-68	融点	124-127
XIV-72	融点	118-119
XIV-73	融点	131-134
XIV-76	屈折率	1.5918
XIV-77	融点	138-140
XIV-98	融点	119-121
XIV-101	屈折率	1.5809
XIV-158	融点	126-128
XV-11	屈折率	1.5167
XV-17	屈折率	1.5104
XV-18	融点	73-74

[0482]

[表145]

化合物番号	融点(°C)又は屈折率(n_D^{20})	
XVI-11	屈折率	1.5317
XVI-18	融点	142-144
XVI-30		測定不可
XVI-95		測定不可
XVI-102		測定不可
XIX-7	屈折率	1.5139
XIX-8	屈折率	1.5122
XIX-25	融点	67-70
XIX-27	融点	72-75
XIX-41	屈折率	1.5252
XIX-42		測定不可
XIX-63	融点	104-107
XIX-86	屈折率	1.5263
XIX-87	屈折率	1.5610
XIX-88	屈折率	1.5730
XIX-89	屈折率	1.5640
XIX-91	融点	40-42
XX-81		測定不可
XXI-9	屈折率	1.5013
XXII-2	融点	168-171
XXII-3	融点	172-174
XXII-5	融点	189-192
XXII-6	融点	190-193
XXII-8	融点	152-155
XXII-12	融点	177-179
XXII-13	融点	139-142
XXII-14	融点	154-156
XXII-15	融点	150-153
XXII-23		測定不可
XXII-31	屈折率	1.5260
XXII-67	融点	111-114
XXII-68	融点	107-108
XXII-69	屈折率	1.6053
XXII-70	融点	121-124
XXII-71	屈折率	1.5360
XXII-72	融点	213-216
XXII-74		測定不可
XXII-75	融点	145-147
XXII-76	融点	81-84
XXIII-74	屈折率	1.5390
XXIII-75	屈折率	1.5250

[0483] 化合物番号 I I I - 188、I I I - 195、IV-125、IV-20

6、XX-81、については、¹H-NMRデータ (TMS/ δ (ppm) 値) を以下に示す。

[0484] 化合物番号 I I I - 188 ($CDCl_3$) : 0.94 (6H, d), 1.34 (6H, d), 2.35 (1H, sept), 4.25 (2H, d), 4.53 (1H, sept), 7.12 (1H, s), 7.45 (1H, s), 7.89 (1H, s), 8.15 (1H, s)

[0485] 化合物番号 I I I - 195 ($CDCl_3$) : 0.42-0.47 (2H, m), 0.61-0.67 (2H, m)

, 1.34 (6H, d) , 1.33–1.43 (1H, m) , 4.29 (2H, d) , 4.53 (1H, sept) , 7.12 (1H, s) , 7.46 (1H, s) , 7.89 (1H, s) , 8.16 (1H, s)

[0486] 化合物番号 I I I – 203 (CDCl₃) : 1.37 (6H, d) , 2.75 (2H, q) , 4.55 (2H, t) , 5.06–5.15 (2H, m) , 5.72–5.85 (1H, m) , 7.94 (1H, s) , 8.07 (1H, s) , 9.04 (1H, s)

[0487] 化合物番号 I V – 125 (CDCl₃) : 3.93 (3H, s) , 3.96 (3H, s) , 4.15 (3H, s) , 7.86 (1H, s) , 7.95 (1H, s) , 8.07 (1H, s) , 9.05 (1H, s)

[0488] 化合物番号 I V – 206 (CDCl₃) : 4.16 (3H, s) , 4.18 (2H, s) , 7.23–7.30 (5H, m) , 8.02 (1H, s) , 8.91 (1H, s) , 12.0 (1H, s)

[0489] 化合物番号 I V – 210 (CDCl₃) : 2.60 (3H, s) , 4.02 (3H, s) , 4.23 (3H, s) , 7.21 (1H, d) , 7.97 (1H, d) , 8.21 (1H, d) , 9.11 (1H, s) , 9.18 (1H, s)

[0490] 化合物番号 I V – 212 (CDCl₃) : 3.93 (3H, s) , 4.03 (3H, s) , 4.23 (3H, s) , 7.51 (1H, t) , 8.06 (1H, s) , 8.09 (1H, d) , 8.27 (1H, d) , 8.74 (1H, s) , 9.10 (1H, s)

[0491] 化合物番号 I V – 214 (CDCl₃) : 2.45 (3H, s) , 4.21 (3H, s) , 7.27 (1H, d) , 8.09 (1H, s) , 8.13 (1H, s) , 8.59 (1H, d) , 8.94 (1H, s)

[0492] 化合物番号 I V – 223 (CDCl₃) : 2.56 (3H, s) , 4.03 (3H, s) , 4.23 (3H, s) , 7.32 (1H, d) , 7.83 (1H, d) , 8.06 (1H, s) , 8.98 (1H, s) , 9.07 (1H, s)

[0493] 化合物番号 V I I – 136 (CDCl₃) : 4.11 (3H, s) , 4.20 (3H, s) , 7.64 (2H, d) , 8.10 (1H, s) , 8.82 (2H, d) , 8.94 (1H, s)

[0494] 化合物番号 V I I – 186 (CDCl₃) : 4.13 (3H, s) , 4.22 (3H, s) , 7.28–7.32 (1H, m) , 7.84 (1H, d) , 8.07 (1H, s) , 8.64 (1H, d) , 9.06 (1H, s)

[0495] 化合物番号 V I I – 189 (CDCl₃) : 2.40 (3H, s) , 4.07 (3H, s) , 4.25 (3H, s) , 7.14 (1H, d) , 7.94 (1H, s) , 8.05 (1H, s) , 8.53 (1H, d) , 9.06 (1H, s)

[0496] 化合物番号 V I I - 1 9 O (CDCl_3) : 3.95 (3H, s) , 4.09 (3H, s) , 4.19 (3H, s) , 7.61 (1H, t) , 7.93 (1H, d) , 8.10 (1H, s) , 8.20 (1H, d) , 8.36 (1H, s) , 8.92 (1H, s)

[0497] 化合物番号 V I I I - 1 8 5 (CDCl_3) : 1.45 (3H, t) , 4.08 (3H, s) , 4.41 (2H, q) , 7.52 (1H, d) , 8.03 (1H, d) , 8.09 (1H, s) , 8.75 (1H, s) , 8.99 (1H, s)

[0498] 化合物番号 X V I - 3 0 (CDCl_3) : 0.30-0.67 (4H, m) , 1.10-1.21 (1H, m) , 2.80 (2H, d) , 3.66 (3H, s) , 4.19 (3H, s) , 8.04 (1H, s) , 9.05 (1H, s)

[0499] 化合物番号 X V I - 9 5 (CDCl_3) : 4.02 (3H, s) , 4.22 (3H, s) , 7.83 (2H, d) , 8.04 (1H, s) , 8.11 (2H, d) , 9.10 (1H, s)

[0500] 化合物番号 X V I - 1 0 2 (CDCl_3) : 3.06-3.20 (4H, m) , 3.34 (3H, s) , 4.17 (3H, s) , 7.19-7.33 (5H, m) , 8.02 (1H, s) , 9.05 (1H, s)

[0501] 化合物番号 X I X - 4 2 (CDCl_3) : 1.0 (9H, s) , 4.28 (2H, s) , 4.83 (2H, d) , 5.30-5.41 (2H, m) , 6.0-6.09 (1H, m) , 7.94 (1H, s) , 8.07 (1H, s) , 9.01 (1H, s)

[0502] 化合物番号 X X - 8 1 (CDCl_3) : 4.04 (3H, s) , 4.76 (2H, q) , 7.06-7.12 (1H, m) , 7.35-7.42 (1H, m) , 7.74-7.86 (2H, m) , 8.10 (1H, s) , 9.05 (1H, s)

[0503] 化合物番号 X X I I - 2 3 (CDCl_3) : 2.71 (3H, s) , 4.13, 4.21 (3H, s) , 7.0-7.84 (4H, m) , 8.01, 8.05 (1H, s) , 8.47, 8.67 (1H, s)

[0504] 化合物番号 X X I I - 7 4 (CDCl_3) : 1.22 (3H, t) , 3.56 (2H, q) , 3.81 (2H, t) , 4.52 (2H, t) , 7.23-7.80 (4H, m) , 7.94 (1H, s) , 8.20 (1H, s) .

[0505] 化合物番号 X X I I I - 7 6 (CDCl_3) : 0.81 (3H, d) , 0.90 (3H, t) , 1.26 (3H, t) , 1.05-1.43 (2H, m) , 1.9-2.1 (1H, m) , 4.05-4.43 (4H, m) , 7.24 (1H, s) , 7.45 (1H, s) , 7.90 (1H, s) , 9.71 (1H, s)

[0506] 次に代表的な製剤例を挙げて製剤方法を具体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率は、これのみに限定されることなく広い範囲で変更可能である。又、以下の説明において「部」は質量部を意味する。

[0507] [製剤例 1] 乳剤

化合物番号の I - 73 化合物	10部
シクロヘキサン	30部
ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル	11部
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウム	4部
メチルナフタリン	45部

以上を均一に溶解して乳剤とした。又、化合物番号 5 - 006 に代えて、表 1 ~ 表 139 に記載の化合物各々を用いて同様に乳剤を得ることができた。

[0508] [製剤例 2] 水和剤

化合物番号 I II - 12 の化合物	10部
ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩	0.5部
ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル	0.5部
珪藻土	24部
クレー	65部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とした。又、化合物番号 5 - 006 に代えて、表 1 ~ 表 139 に記載の化合物各々を用いて同様に水和剤を得ることができた。

[0509] [製剤例 3] 粉剤

化合物番号 I II - 30 の化合物	2部
珪藻土	5部
クレー	93部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とした。又、化合物番号 5 - 006 に代えて、表 1 ~ 表 139 に記載の化合物各々を用いて同様に粉剤を得ることができた。

[0510] [製剤例 4] 粒剤

化合物番号 I V - 73 の化合物	5部
ラウリルアルコール硫酸エステルのナトリウム塩	2部
リグニンスルホン酸ナトリウム	5部

カルボキシメチルセルロース 2部

クレー 86部

以上を均一に混合粉碎した。この混合物に水20部相当量を加えて練り合せ、押出式造粒機を用いて14～32メッシュの粒状に加工した後、乾燥して粒剤とした。又、化合物番号5-006に代えて、表1～表139に記載の化合物各々を用いて同様に粒剤を得ることができた。

[0511] 次に本発明化合物を有効成分とする有害生物防除剤の奏する効果について、試験例をもって説明する。

[0512] [試験例1] ワタアブラムシ殺虫試験

製剤例2に準じて調製した水和剤を、有効成分として500 ppmの濃度に水で希釈した。この希釈薬液に、予めワタアブラムシ若虫を接種しておいたキュウリ苗を浸漬し、風乾した。処理後のキュウリ苗は25°Cの恒温室に置き、3日後に生存虫数を数え、数1の計算式により死虫率を求めた。本試験は1連制で行なった。

[0513] [数1]

$$\text{死虫率} (\%) = \left(1 - \frac{\text{生存虫数}}{\text{供試虫数}} \right) \times 100$$

[0514] この試験により90%以上の死虫率を示す化合物を以下に示す。

I-11、I-12、I-18、I-21、I-68、I-72、I-73
 、I-74、I-76、I-91、I-105、I-115、I-117、
 I-132、I-133、I-140、I-143、I-157、I-20
 2、I-204、II-7、II-9、II-11、II-12、II-1
 8、II-30、II-68、II-72、II-73、II-74、II
 -76、II-79、II-134、II-157、II-190、II-
 202、II-203、II-204、III-4、III-6、III-7
 、III-8、III-9、III-11、III-12、III-13、
 III-30、III-73、III-188、III-189、III-
 190、III-195、III-203、III-204、III-20

5、III-206、III-207、III-208、IV-9、IV-11、IV-18、IV-30、IV-68、IV-72、IV-73、IV-74、IV-76、IV-79、IV-94、IV-95、IV-99、IV-101、IV-102、IV-115、IV-124、IV-125、IV-128、IV-129、IV-130、IV-131、IV-132、IV-133、IV-134、IV-136、IV-139、IV-176、IV-196、IV-205、VI-73、VI-138、IV-196、IV-205、IV-209、IV-210、IV-212、IV-215、IV-216、IV-217、IV-218、IV-221、IV-224、IV-225、IV-227、IV-228、IV-229、IV-231、IV-232、V-203、V-204、V-205、VI-12、VI-18、VI-73、VI-138、VI-175、VI-176、VII-18、VII-74、VII-95、VII-136、VI-I-138、VII-I-186、VII-I-187、VII-I-188、VII-I-189、VII-I-191、VII-I-193、VII-I-194、VII-I-197、VII-I-184、VII-I-185、VII-I-186、IX-12、IX-18、X-21、XI-129、XI-130、XII-I-18、XIV-11、XIV-18、XIV-72、XIV-73、XIV-76、XIV-98、XIV-101、XV-11、XV-17、XV-18、XIX-7、XIX-25、XIX-27、XIX-41、XIX-42、XIX-63、XIX-86、XIX-87、XIX-88、XIX-89、XIX-91、XX-81、XXI-9、XXII-2、XXII-3、XXII-5、XXII-6、XXII-8、XXII-12、XXII-13、XXII-14、XXII-15、XXII-31、XXII-67、XXII-71

[0515] [試験例2] ワタアブラムシ殺虫試験（灌注）

製剤例2に準じて調製した水和剤を、有効成分として500 ppmの濃度になるように水で希釀した。この希釀薬剤液を、予めワタアブラムシ若虫を

接種しておいたキュウリ苗の地際部に5mL灌注処理した。処理後のキュウリ苗は25°Cの恒温室に置き、3日後に生存虫数を数え、数1の計算式により死虫率を求めた。試験は1連制にて行なった。

[0516] この試験により90%以上の死虫率を示す化合物を以下に示す。

I-11、I-18、I-68、I-72、I-73、I-74、I-15
7、II-12、II-18、II-30、II-68、II-72、II
-73、II-76、II-79、II-157、III-11、III-
73、IV-18、IV-30、IV-68、IV-73、IV-74、I
V-76、IV-94、IV-133、IV-139、IV-209、IV
-216、IV-227、IV-231、V-203、VI-73、VII
-191、IX-42、IX-87、XXII-6

[0517] [試験例3] トビイロウンカ殺虫試験

製剤例2に準じて調製した水和剤を、有効成分として500ppmの濃度になるように水で希釈した。この希釈薬液に、イネの芽だし粉を浸漬し、容量60mLのプラスティックカップに入れた。このプラスティックカップにトビイロウンカ3齢幼虫を10頭放ち、蓋をして25°Cの恒温室に置いた。6日後に生存虫数を数え、数1の計算式により死虫率を求めた。本試験は1連制で行なった。

[0518] この試験により90%以上の死虫率を示す化合物を以下に示す。

I-11、I-12、I-18、I-21、I-68、I-72、I-73
、I-74、I-76、I-91、I-105、I-115、I-117、
I-132、I-133、I-140、I-143、I-157、I-20
2、I-203、I-204、II-7、II-9、II-11、II-1
2、II-18、II-30、II-68、II-72、II-73、II
-74、II-76、II-79、II-134、II-157、II-1
90、II-202、II-203、II-204、III-4、III-
6、III-7、III-8、III-9、III-11、III-12、
III-13、III-18、III-30、III-73、III-13

4、III-188、III-189、III-190、III-195、
III-203、III-204、III-205、III-206、II
I-207、III-208、IV-7、IV-9、IV-11、IV-1
8、IV-30、IV-68、IV-72、IV-73、IV-74、IV
-76、IV-77、IV-79、IV-94、IV-95、IV-99、
IV-101、IV-102、IV-115、IV-117、IV-119
、IV-124、IV-125、IV-128、IV-129、IV-13
0、IV-131、IV-132、IV-133、IV-134、IV-1
36、IV-138、IV-139、IV-180、IV-196、IV-
204、IV-209、IV-210、IV-215、IV-216、IV
-221、IV-223、IV-224、IV-225、IV-227、I
V-229、IV-231、IV-232、V-137、V-203、V-
204、V-205、V-207、VI-12、VI-18、VI-73、
VI-138、VII-11、VII-74、VII-101、VII-1
38、VII-186、VII-187、VII-188、VII-191
、VII-193、VII-194、VIII-137、VIII-184
、VIII-185、VIII-186、IX-18、X-21、XI-6
8、XI-129、XI-130、XII-18、XII-158、X
IV-11、XIV-18、XIV-68、XIV-72、XIV-73、
XIV-76、XIV-77、XIV-98、XIV-101、XIV-1
58、XV-11、XV-17、XV-18、XVI-11、XVI-18
、XVI-30、IX-7、IX-8、IX-25、IX-27、
IX-41、IX-42、IX-63、IX-86、IX-87
、IX-88、IX-89、IX-91、XX-81、XXI-9、
XXII-3、XXII-5、XXII-6、XXII-8、XXII-1
2、XXII-13、XXII-14、XXII-15、XXII-31、
XXII-67、XXII-69、XXII-70、XXII-72、XX
III-74

[0519] [試験例 4] トビイロウンカ浸透移行性殺虫試験

製剤例 2 に準じて調製した水和剤を、有効成分として 1800 ppm の濃度になるように水で希釈した。この希釈薬液を、2.5 葉期になったイネが栽培されているペーパーポット（縦 1.5 cm × 横 1.5 cm × 高さ 3 cm）に 250 µL を灌注処理し、容量 700 mL のプラスティックカップに入れた。このプラスティックカップにトビイロウンカ 3 齢幼虫を 5 頭放ち、蓋をして 25°C の恒温室に置いた。6 日後に生存虫数を数え、数 1 の計算式により死虫率を求めた。本試験は 2 連制で行なった。

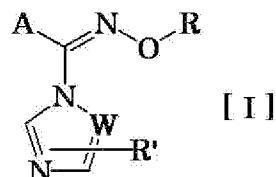
[0520] この試験により 90% 以上の死虫率を示す化合物を以下に示す。

I-11、I-12、I-18、I-68、I-73、I-76、I-115、I-202、II-11、II-12、II-18、II-30、II-68、II-73、II-74、II-157、III-4、III-6、III-7、III-8、III-12、III-13、III-30、III-203、XVI-30、XVI-102、XIX-7、XIX-8、XIX-27、XIX-41、XIX-42

請求の範囲

[請求項1] 一般式 [I]

[化1]



[式中、

Aは、1, 2, 3-トリアゾール或いは1, 2, 4-トリアゾールの何れかを表すと共に、1～2個の同一又は相異なる置換基Xで置換されてもよく、該1, 2, 3-トリアゾール又は該1, 2, 4-トリアゾールの窒素原子は酸化されてN-オキシドになってもよく、

Xは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、シアノ基、C₁～C₈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C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、C₁～C₆アルキルチオC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシイミノC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆トリアルキルシリルC₁～C₆アルキル基、シアノC₁～C₆アルキル基、置換基群αから選ばれる置換基で置換されてもよいフェニル基、置換基群αから選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₁～C₆アルキル基、置換基群αから選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₂～C₆アルケニル基、置換基群αから選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₂～C₆アルキニル基、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子

から選択される 1 から 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 1 から 10 の複素環基（該基は 1 ~ 5 個のハロゲン原子、C₁ ~ C₆ アルキル基、C₁ ~ C₆ ハロアルキル基、C₁ ~ C₆ アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される 1 から 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 1 から 10 の複素環基で置換された C₁ ~ C₆ アルキル基（該複素環基は 1 ~ 5 個のハロゲン原子、C₁ ~ C₆ アルキル基、C₁ ~ C₆ ハロアルキル基、C₁ ~ C₆ アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）、又は、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される 1 から 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 1 から 10 の複素環基で置換された C₁ ~ C₆ アルコキシ C₁ ~ C₆ アルキル基（該複素環基は 1 ~ 5 個のハロゲン原子、C₁ ~ C₆ アルキル基、C₁ ~ C₆ ハロアルキル基、C₁ ~ C₆ アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）を表し、前記複素環基に窒素原子が含まれる場合は酸化されて N-オキシドになってもよく、

R は、水素原子、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、C₁ ~ C₆ ハロアルキル基、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル基、C₂ ~ C₆ ハロアルキニル基、シアノ C₁ ~ C₆ アルキル基、C₁ ~ C₆ アルキルチオ C₁ ~ C₆ アルキル基、C₁ ~ C₆ アルキルスルフィニル C₁ ~ C₆ アルキル基、C₁ ~ C₆ アルキルスルホニル C₁ ~ C₆ アルキル基又は C₁ ~ C₆ アルコキシ C₁ ~ C₆ アルキル基を表し、

R' は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ヒドロキシル基、メルカプト基、C₁ ~ C₆ アルキル基、C₁ ~ C₆ アルコキシ基、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、ホルミル基、ヒドロキシイミノ C₁ ~ C₄ アルキル基又は酸素原子（但し、R' が窒素原子に置換する場合）を表し、

Wは、窒素原子又はメチル基を表す。]

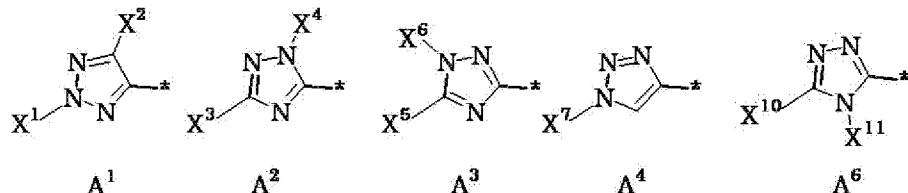
で表されることを特徴とするトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩。

「置換基群 α 」

ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基、C₁～C₆ハロアルコキシ基、メチレンジオキシ基、ニトロ基、C₁～C₆アルコキカルボニル基、カルバモイル基及びシアノ基

[請求項2] 前記一般式[I]において、Aが式、

[化2]



A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 又は A^6 で示される複素環基であり、

X¹、X³、X⁴、X⁵、X⁶、X⁷、X¹⁰又はX¹¹はそれぞれ独立して、水素原子、C₁～C₈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C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₂～C₆ハロアルケニル基、C₂～C₆ハロアルキニル基、C₁～C₆アルキルチオC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基、C₃～C₆シクロアルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルコキシC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆トリアルキルシリルC₁～C₆アルキル基、シアノC₁～C₆アルキル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₁～C₆アルキル基、置換

基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₂～C₆アルケニル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₂～C₆アルキニル基、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基（該基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基で置換されたC₁～C₆アルキル基（該複素環基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）、又は、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基で置換されたC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基（該複素環基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）を表し、

X²は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、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C₁～C₆アルキル基又はC₁～C₆ハロアルキル基を表す、

請求項1に記載のトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩。

[請求項3]

前記一般式〔I〕において、Aが式、

A¹、A²、A³、A⁴又はA⁶で示される複素環基であり、

X¹、X³、X⁴、X⁵、X⁶、X⁷、X¹⁰又はX¹¹がそれぞれ独立して、水素原子、C₁～C₈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C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルチオC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルフ

イニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基、C₁～C₆アルコキシミノC₁～C₆アルキル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニル基、置換基群 α から選ばれる置換基で置換されてもよいフェニルC₁～C₆アルキル基、同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基（該基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）又は同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1から5個のヘテロ原子を有する炭素数1から10の複素環基で置換されたC₁～C₆アルキル基（該複素環基は1～5個のハロゲン原子、C₁～C₆アルキル基、C₁～C₆ハロアルキル基、C₁～C₆アルコキシ基又はシアノ基で置換されていてもよい。）であり、

X²が、水素原子、ハロゲン原子又はC₁～C₆アルキル基である、請求項2に記載のトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩。

[請求項4] 請求項1～3のいずれかに記載のトリアゾール誘導体又はその農業上許容される塩を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2011/001964

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
See extra sheet.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D249/08, A01N43/647, A01N43/653, A01N43/78, A01N43/80, A01P7/04,
C07D401/14, C07D403/06, C07D403/14, C07D405/14, C07D409/14, C07D413/14,
C07D417/14

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2011
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2011	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2011

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS/REGISTRY (STN), JSTPlus/JMEDPlus/JST7580 (JDreamII)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP 07-173155 A (Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.), 11 July 1995 (11.07.1995), claims 1 to 2; test examples 1 to 2 & JP 3462247 B2	1-4
Y	WO 2009/130193 A1 (Bayer Cropscience S.A.), 29 October 2009 (29.10.2009), claims 1 to 21 (Family: none)	1-4
Y	CN 1188764 A (Kagaku Kogyobu Han'yo Kako Kenkyuin), 29 July 1998 (29.07.1998), claims 1 to 4; compounds 10, 21, 32 & CN 1072211 C	1-4

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	
"A"	document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E"	earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L"	document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O"	document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P"	document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T"	later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&"	document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
20 May, 2011 (20.05.11)

Date of mailing of the international search report
31 May, 2011 (31.05.11)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2011/001964

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2001-055387 A (Sagami Chemical Research Center), 27 February 2001 (27.02.2001), claim 1 & WO 2000/75138 A1 & EP 1184382 A1	1-4
A	JP 01-308260 A (Kumiai Chemical Industry Co., Ltd.), 12 December 1989 (12.12.1989), claims 1 to 2 (Family: none)	1-4
A	JP 04-261147 A (BASF AG.), 17 September 1992 (17.09.1992), claim 1; tables I, II & EP 463488 A & US 5194662 A & US 5292759 A & US 5387607 A & EP 669319 A2 & EP 669319 A3 & US 5563168 A & EP 463488 B1 & EP 669319 B1 & JP 3009505 B2 & US 6316459 B1 & US 6326399 B1 & US 37839 E & EP 463488 B2	1-4
A	JP 48-061635 A (Farbenfabriken Bayer AG.), 29 August 1973 (29.08.1973) claim 1; preparation example 6 & US 3818029 A	1-4

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2011/001964

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

*C07D249/08(2006.01)i, A01N43/647(2006.01)i, A01N43/653(2006.01)i,
A01N43/78(2006.01)i, A01N43/80(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i,
C07D401/14(2006.01)i, C07D403/06(2006.01)i, C07D403/14(2006.01)i,
C07D405/14(2006.01)i, C07D409/14(2006.01)i, C07D413/14(2006.01)i,
C07D417/14(2006.01)i*

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national
classification and IPC)

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

Int.Cl. 特別ページ参照

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

Int.Cl. C07D249/08, A01N43/647, A01N43/653, A01N43/78, A01N43/80, A01P7/04, C07D401/14, C07D403/06, C07D403/14, C07D405/14, C07D409/14, C07D413/14, C07D417/14

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2011年
日本国実用新案登録公報	1996-2011年
日本国登録実用新案公報	1994-2011年

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAPLUS/REGISTRY(STN), JSTPlus/JMEDPlus/JST7580(JDreamII)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
Y	JP 07-173155 A (クミアイ化学工業株式会社) 1995.07.11, & JP 3462247 B2 請求項1-2、試験例1-2	1-4
Y	WO 2009/130193 A1 (Bayer Cropscience SA) 2009.10.29, (ファミリーなし) 請求項1-21	1-4

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日 20.05.2011	国際調査報告の発送日 31.05.2011
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁（ISA/JP） 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官（権限のある職員） 瀬下 浩一 電話番号 03-3581-1101 内線 3492 4P 4669

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
Y	CN 1188764 A (化学工業部瀋陽化工研究院) 1998.07.29, & CN 1072211 C 請求項 1-4、化合物 10, 21, 32 等	1-4
A	JP 2001-055387 A (財団法人相模中央化学研究所) 2001.02.27, & WO 2000/75138 A1 & EP 1184382 A1 請求項 1	1-4
A	JP 01-308260 A (クミアイ化学工業株式会社) 1989.12.12, (ファミリーなし) 請求項 1-2	1-4
A	JP 04-261147 A (ビーエーエスエフ アクチエンゲゼルシヤフト) 1992.09.17, & EP 463488 A & US 5194662 A & US 5292759 A & US 5387607 A & EP 669319 A2 & EP 669319 A3 & US 5563168 A & EP 463488 B1 & EP 669319 B1 & JP 3009505 B2 & US 6316459 B1 & US 6326399 B1 & US 37839 E & EP 463488 B2 請求項 1、表 I 及び II	1-4
A	JP 48-061635 A (フルベンフアブリケン・バイエル・アクチエンゲゼル シヤフト) 1973.8.29, & US 3818029 A 請求項 1、製造例 6	1-4

発明の属する分野の分類

C07D249/08(2006.01)i, A01N43/647(2006.01)i, A01N43/653(2006.01)i,
A01N43/78(2006.01)i, A01N43/80(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, C07D401/14(2006.01)i,
C07D403/06(2006.01)i, C07D403/14(2006.01)i, C07D405/14(2006.01)i,
C07D409/14(2006.01)i, C07D413/14(2006.01)i, C07D417/14(2006.01)i