

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2008-24697

(P2008-24697A)

(43) 公開日 平成20年2月7日(2008.2.7)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 213/74 (2006.01)	C O 7 D 213/74 C S P	4 C O 5 5
A O 1 N 43/40 (2006.01)	A O 1 N 43/40 I O 1 J	4 H O 1 1
A O 1 N 43/42 (2006.01)	A O 1 N 43/42 I O 1	
A O 1 N 43/54 (2006.01)	A O 1 N 43/54 B	
A O 1 N 43/78 (2006.01)	A O 1 N 43/78 A	
審査請求 未請求 請求項の数 10 O L (全 68 頁) 最終頁に続く		

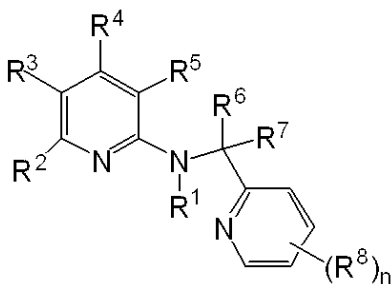
(21) 出願番号	特願2007-159676 (P2007-159676)	(71) 出願人	000000354
(22) 出願日	平成19年6月18日 (2007.6.18)		石原産業株式会社
(31) 優先権主張番号	特願2006-170283 (P2006-170283)		大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号
(32) 優先日	平成18年6月20日 (2006.6.20)	(72) 発明者	木村 博彦
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)		滋賀県草津市西淀川二丁目3番1号 石原産業株式会社中央研究所内
		(72) 発明者	森田 雅之
			滋賀県草津市西淀川二丁目3番1号 石原産業株式会社中央研究所内
		(72) 発明者	山元 一浩
			滋賀県草津市西淀川二丁目3番1号 石原産業株式会社中央研究所内
		(72) 発明者	植木 寿彦
			滋賀県草津市西淀川二丁目3番1号 石原産業株式会社中央研究所内
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 新規なピリジルーメタナミン誘導体又はその塩を含有する有害生物防除剤

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 新規な有害生物防除剤を提供する。

【解決手段】 下記式：



〔式中、 R^1 は水素原子、アルキル、複素環基等であり； R^2 及び R^3 は各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、複素環基等であり； R^4 はトリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルであり； R^5 は水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル等であり； R^6 及び R^7 は各々独立に、水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル等であり； R^8 はアルキル、シクロアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ等であり； n は0～4の整数である〕で表されるピリジルーメタナミン誘導体又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤を提供する。

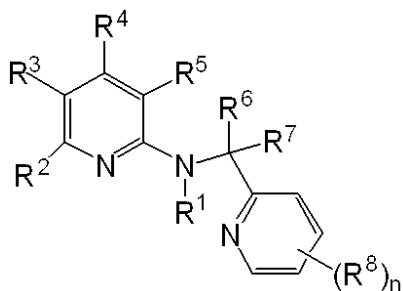
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



10

〔式中、R¹は水素原子、R^bで置換されてもよいアルキル、R^bで置換されてもよいアルケニル、R^bで置換されてもよいアルキニル、アリール、シアノ、N=CHR^c、OR^c、S(O)_pR^c、COSR^c、COOR^c又はCOR^cであるか、R¹はアルキル若しくはハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり；R²及びR³は各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、R⁸で置換されてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、NR^aR^c、OR^a、SR^a、COR^a、COOR^a、CONR^aR^c、CH=NR^a、SO₂R^a又はSOR^aであり；R⁴はトリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルであり；R⁵は水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、R⁸で置換されてもよいアルキル、R⁸で置換されてもよいアルケニル、R⁸で置換されてもよいアルキニル、OR^a、SR^a、NR^aR^c、COOR^a又はCOR^aであり；R⁶及びR⁷は各々独立に、水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル又はシクロアルキルであるか、R⁶とR⁷が一緒になってハロゲンで置換されてもよい炭素数3～6のシクロアルキルを形成してもよく；R⁸はアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、ハロゲンで置換されてもよいアリール、ハロゲンで置換されてもよい複素環基、ハロゲンで置換されてもよい複素環オキシ、CONR^aR^c、COR^c、COOR^c、NR^aR^c又はOR^aであり；R^aは水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル又は複素環アルキルであり；R^bはハロゲン、R⁸で置換されてもよいアリール、R⁸で置換されてもよい複素環基、R⁸で置換されてもよい複素環オキシ、R⁸で置換されてもよい複素環チオ、シアノ、NR^aR^c、NHCOOR^a、COR^c、COOR^c、CONR^aR^c、アルコキシアルコキシ、OR^a又はS(O)_pR^aであり；R^cは水素原子、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲンで置換されてもよいアリール又はハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり；nは0～4の整数であり、pは0～2の整数であり、前述した各置換基中のNR^aR^c部分は、R^aとR^cが一緒になって、両者が結合する窒素原子とともに5員又は6員の複素環を形成してもよい。但し、N-(2-ピリジルメチル)-3,5,6-トリクロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジリアミンを除く〕で表されるピリジルーメタナミン誘導体又はその塩。

20

30

【請求項 2】

40

R¹が水素原子、R^bで置換されてもよいアルキル、R^bで置換されてもよいアルケニル、R^bで置換されてもよいアルキニル、アリール、ハロアルキルで置換されてもよい複素環基、N=CHR^c、OR^c、COSR^c又はCOR^cであり；R²及びR³が各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、R⁸で置換されてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、NR^aR^c、OR^a、SR^a、COR^a、COOR^a、CONR^aR^c、SO₂R^a又はSOR^aであり；R⁵が水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、R⁸で置換されてもよいアルキル、COOR^a又はCOR^aであり；R⁶及びR⁷が各々独立に、水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル又はシクロアルキルであり；R⁸がアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、NR^aR^c又はO

50

R^a であり； R^a が水素原子、アルキル、シクロアルキル又はハロアルキルであり； R^b がハロゲン、 R^8 で置換されてもよいアリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、シアノ、 NR^aR^c 、 $NHCOOR^a$ 、 OR^a 又は SR^a であり； R^c が水素原子、アルキル、シクロアルキル、アリール又はハロアルキルで置換されてもよい複素環基である請求項1に記載のピリジルーメタナミン誘導体又はその塩。

【請求項3】

R^2 及び R^3 が各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、 NR^aR^c 、 OR^a 、 SR^a 、 COR^a 又は SOR^a であり； R^5 が水素原子、ハロゲン又は COR^a であり； R^8 がアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、シアノ、 NR^aR^c 又は OR^a であり； R^a が水素原子、アルキル又はハロアルキルであり； R^b がハロゲン、アリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、シアノ、 NR^aR^c 、 OR^a 又は SR^a であり； R^c が水素原子、アルキル、アリール又は複素環基である請求項2に記載のピリジルーメタナミン誘導体又はその塩。

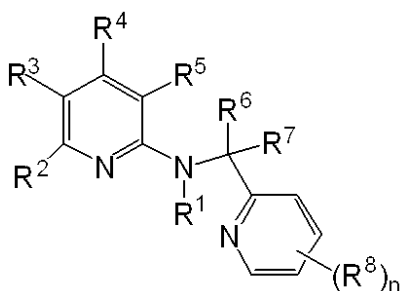
【請求項4】

R^1 が水素原子、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、アルキニル、アリール、ハロアルキルで置換されてもよい複素環基、 OR^c 又は COR^c であり； R^2 が水素原子、ハロゲン、シアノ、アルキル、ハロアルキル、アルキニル、アリール、 NR^aR^c 、 OR^a 又は SR^a であり； R^3 が水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、アリール、 NR^aR^c 、 SR^a 又は COR^a であり； R^4 がトリフルオロメチルであり； R^5 が水素原子、ハロゲン又は COR^a であり； R^6 及び R^7 が各々独立に、水素原子、アルキル又はシクロアルキルであり； R^8 がアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、シアノ又は OR^a であり； R^a が水素原子又はアルキルであり； R^b がハロゲン、アリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、 OR^a 又は NR^aR^c であり； R^c が水素原子、アルキル、アリール又は複素環基である請求項2に記載のピリジルーメタナミン誘導体又はその塩。

【請求項5】

式(I)：

【化2】

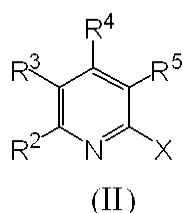


〔式中、 R^1 は水素原子、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、 R^b で置換されてもよいアルキニル、アリール、シアノ、 $N=CHR^c$ 、 OR^c 、 $S(O)_pR^c$ 、 $COSR^c$ 、 $COOR^c$ 又は COR^c であるか、 R^1 はアルキル若しくはハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり； R^2 及び R^3 は各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、 NR^aR^c 、 OR^a 、 SR^a 、 COR^a 、 $COOR^a$ 、 $CONR^aR^c$ 、 $CH=NOR^a$ 、 SO_2R^a 又は SOR^a であり； R^4 はトリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルであり； R^5 は水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、 R^8 で置換されてもよいアルケニル、 R^8 で置換されてもよいアルキニル、 OR^a 、 SR^a 、 NR^aR^c 、 $COOR^a$ 又は COR^a であり； R^6 及び R^7 は各々独立に、水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル又はシクロアルキルであるか、 R^6 と R^7 が一緒になってハロゲンで置換されてもよい炭素数3～6のシクロアルキルを形成してもよく； R^8 はアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシアルコキシア

ルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、ハロゲンで置換されてもよいアリール、ハロゲンで置換されてもよい複素環基、ハロゲンで置換されてもよい複素環オキシ、 CONR^aR^c 、 COR^c 、 COOR^c 、 NR^aR^c 又は OR^a であり； R^a は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル又は複素環アルキルであり； R^b はハロゲン、 R^8 で置換されてもよいアリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、 R^8 で置換されてもよい複素環オキシ、 R^8 で置換されてもよい複素環チオ、シアノ、 NR^aR^c 、 NHCOOR^a 、 COR^c 、 COOR^c 、 CONR^aR^c 、アルコキシアルコキシ、 OR^a 又は $\text{S}(\text{O})_p\text{R}^a$ であり； R^c は水素原子、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲンで置換されてもよいアリール又はハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり； n は0～4の整数であり、 p は0～2の整数であり、前述した各置換基中の NR^aR^c 部分は、 R^a と R^c が一緒になって、両者が結合する窒素原子とともに5員又は6員の複素環を形成してもよい。但し、N-(2-ピリジルメチル)-3,5,6-トリクロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミンを除く〕で表されるピリジルーメタナミン誘導体又はその塩の製造方法であって、(1)式(II)：

10

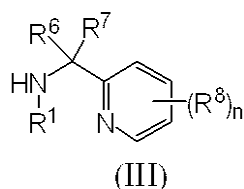
【化3】



20

(式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は前述の通りであり、 X はハロゲンである)で表される化合物と、式(III)：

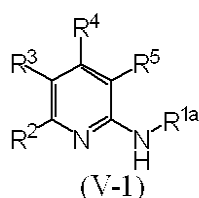
【化4】



30

(式中、 R^1 、 R^6 、 R^7 、 R^8 及び n は前述の通りである)で表される化合物とを反応させるか、(2)式(V-1)：

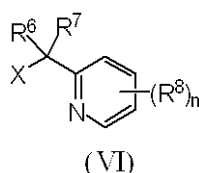
【化5】



40

(式中、 R^{1a} は、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、 R^b で置換されてもよいアルキニル、アリール、アルキル若しくはハロアルキルで置換されてもよい複素環基、 $\text{N}=\text{CHR}^c$ 、 OR^c 、 $\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 COSR^c 、 COOR^c 又は COR^c であり、 R^b 、 R^c 、 p 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は前述の通りである)で表される化合物と、式(VI)：

【化6】

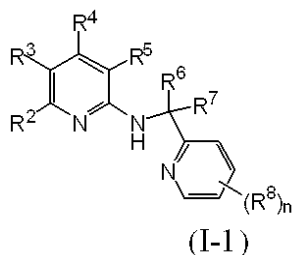


50

(式中、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 X 及び n は前述の通りである)で表される化合物とを反応させ

るか、或は(3)式(I-1)：

【化7】



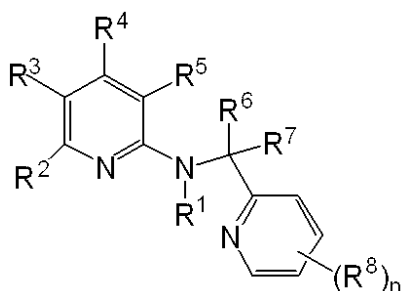
(式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 及び n は前述の通りである)で表される化合物と、式(VII)： $R^{1a}-X$ (式中、 R^{1a} 及び X は前述の通りである)で表される化合物とを反応させることを特徴とする前記方法。

10

【請求項6】

式(I)：

【化8】



20

〔式中、 R^1 は水素原子、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、 R^b で置換されてもよいアルキニル、アリール、シアノ、 $N=CHR^c$ 、 OR^c 、 $S(O)_pR^c$ 、 $COSR^c$ 、 $COOR^c$ 又は COR^c であるか、 R^1 はアルキル若しくはハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり； R^2 及び R^3 は各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、 NR^aR^c 、 OR^a 、 SR^a 、 COR^a 、 $COOR^a$ 、 $CONR^aR^c$ 、 $CH=NR^a$ 、 SO_2R^a 又は SOR^a であり； R^4 はトリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルであり； R^5 は水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、 R^8 で置換されてもよいアルケニル、 R^8 で置換されてもよいアルキニル、 OR^a 、 SR^a 、 NR^aR^c 、 $COOR^a$ 又は COR^a であり； R^6 及び R^7 は各々独立に、水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル又はシクロアルキルであるか、 R^6 と R^7 が一緒になってハロゲンで置換されてもよい炭素数3～6のシクロアルキルを形成してもよく； R^8 はアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、ハロゲンで置換されてもよいアリール、ハロゲンで置換されてもよい複素環基、ハロゲンで置換されてもよい複素環オキシ、 $CONR^aR^c$ 、 COR^c 、 $COOR^c$ 、 NR^aR^c 又は OR^a であり； R^a は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル又は複素環アルキルであり； R^b はハロゲン、 R^8 で置換されてもよいアリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、 R^8 で置換されてもよい複素環オキシ、 R^8 で置換されてもよい複素環チオ、シアノ、 NR^aR^c 、 $NHCOOR^a$ 、 COR^c 、 $COOR^c$ 、 $CONR^aR^c$ 、アルコキシアルコキシ、 OR^a 又は $S(O)_pR^a$ であり； R^c は水素原子、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲンで置換されてもよいアリール又はハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり； n は0～4の整数であり、 p は0～2の整数であり、前述した各置換基中の NR^aR^c 部分は、 R^a と R^c が一緒になって、両者が結合する窒素原子とともに5員又は6員の複素環を形成してもよい〕で表されるピリジルーメタナミン誘導体又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤。

30

40

【請求項7】

50

R^1 が水素原子、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、 R^b で置換されてもよいアルキニル、アリール、ハロアルキルで置換されてもよい複素環基、 $N=CHR^c$ 、 OR^c 、 $COSR^c$ 又は COR^c であり； R^2 及び R^3 が各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、 NR^aR^c 、 OR^a 、 SR^a 、 COR^a 、 $COOR^a$ 、 $CONR^aR^c$ 、 SO_2R^a 又は SOR^a であり； R^5 が水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、 $COOR^a$ 又は COR^a であり； R^6 及び R^7 が各々独立に、水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル又はシクロアルキルであり； R^8 がアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^aR^c 又は OR^a であり； R^b がハロゲン、 R^8 で置換されてもよいアリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、シアノ、 NR^aR^c 、 $NHCOOR^a$ 、 OR^a 又は SR^a であり； R^c が水素原子、アルキル、シクロアルキル、アリール又はハロアルキルで置換されてもよい複素環基である請求項6に記載の有害生物防除剤。

10

【請求項8】

請求項6に記載の式(I)で表されるピリジルーメタナミン誘導体又はその塩を有効成分として含有する農園芸用有害生物防除剤。

【請求項9】

請求項6に記載の式(I)で表されるピリジルーメタナミン誘導体又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤、殺ダニ剤又は殺線虫剤。

20

【請求項10】

請求項6に記載の式(I)で表されるピリジルーメタナミン誘導体又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規なピリジルーメタナミン誘導体又はその塩、及びこれを有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

【背景技術】

【0002】

特許文献1～3には、それぞれ一定の化学構造を有するピリジン誘導体が開示されている。しかしながら、特許文献1に記載の化合物及び特許文献2に記載の化合物は、それぞれ後記式(I)中の R^4 部分及び R^5 部分が本発明のピリジルーメタナミン誘導体とは異なる。また、特許文献3は、本発明のピリジルーメタナミン誘導体を具体的に開示していない。さらに、特許文献1～3に記載の化合物は全て医薬用途の化合物であり、有害生物防除剤用途の化合物ではない。

30

非特許文献1には、後記した式(I)に包含される化合物であるN-(2-ピリジルメチル)-3,5,6-トリクロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミンが記載されているが、この化合物を有効成分とする有害生物防除剤は記載されていない。

【0003】

40

【特許文献1】国際公開公報 WO 01/62233

【特許文献2】国際公開公報 WO 02/66470

【特許文献3】国際公開公報 WO 04/91518

【非特許文献1】Chemistry Express, 7, 473-476(1992)

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

長年にわたり、多数の有害生物防除剤が使用されているが、効力が不十分、有害生物が抵抗性を獲得しその使用が制限される等、種々の課題を有するものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない新規な有害生物防除剤、例えば、農園芸分野で問題となる各種有害

50

生物や、動物に寄生する有害生物を防除できる有害生物防除剤の開発が望まれている。

【課題を解決するための手段】

【0005】

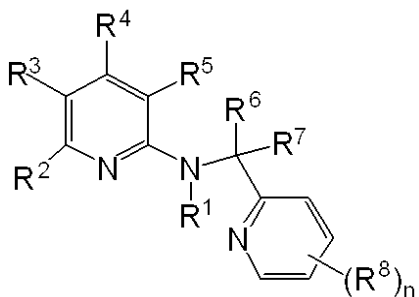
本発明者らは、より優れた有害生物防除剤を見出すべくピリジルーメタナミン誘導体につき種々検討した。その結果、新規なピリジルーメタナミン誘導体が、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有し、且つ、作物、有害生物の天敵或は哺乳動物に対する安全性を併せ持つことを見出し、本発明を完成した。

【0006】

すなわち本発明は、式（I）：

【0007】

【化1】



【0008】

〔式中、 R^1 は水素原子、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、 R^b で置換されてもよいアルキニル、アリール、シアノ、 $N=CHR^c$ 、 OR^c 、 $S(O)_pR^c$ 、 $COSR^c$ 、 $COOR^c$ 又は COR^c であるか、 R^1 はアルキル若しくはハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり； R^2 及び R^3 は各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、 NR^aR^c 、 OR^a 、 SR^a 、 COR^a 、 $COOR^a$ 、 $CONR^aR^c$ 、 $CH=NR^a$ 、 SO_2R^a 又は SOR^a であり； R^4 はトリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルであり； R^5 は水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、 R^8 で置換されてもよいアルケニル、 R^8 で置換されてもよいアルキニル、 OR^a 、 SR^a 、 NR^aR^c 、 $COOR^a$ 又は COR^a であり； R^6 及び R^7 は各々独立に、水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル又はシクロアルキルであるか、 R^6 と R^7 が一緒になってハロゲンで置換されてもよい炭素数3～6のシクロアルキルを形成してもよく； R^8 はアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、ハロゲンで置換されてもよいアリール、ハロゲンで置換されてもよい複素環基、ハロゲンで置換されてもよい複素環オキシ、 $CONR^aR^c$ 、 COR^c 、 $COOR^c$ 、 NR^aR^c 又は OR^a であり； R^a は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル又は複素環アルキルであり； R^b はハロゲン、 R^8 で置換されてもよいアリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、 R^8 で置換されてもよい複素環オキシ、 R^8 で置換されてもよい複素環チオ、シアノ、 NR^aR^c 、 $NHCOOR^a$ 、 COR^c 、 $COOR^c$ 、 $CONR^aR^c$ 、アルコキシアルコキシ、 OR^a 又は $S(O)_pR^a$ であり； R^c は水素原子、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲンで置換されてもよいアリール又はハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり； n は0～4の整数であり、 p は0～2の整数であり、前述した各置換基中の NR^aR^c 部分は、 R^a と R^c が一緒になって、両者が結合する窒素原子とともに5員又は6員の複素環を形成してもよい〕で表されるピリジルーメタナミン誘導体又はその塩、並びにそれらを有効成分とする有害生物防除剤に関する。

【発明の効果】

【0009】

前記式（I）で表されるピリジルーメタナミン誘導体を有効成分とする有害生物防除剤は、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有する。

【発明を実施するための最良の形態】

【0010】

前記式(I)中のハロゲン又は置換基としてのハロゲンとしては、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲンの数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、各ハロゲンは同一でも相異なってもよい。また、ハロゲンの置換位置はいずれの位置でもよい。

式(I)中のアルキル又はアルコキシ中のアルキル部分としては、直鎖状又は分枝状のいずれでもよく、その具体例としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシルのような C_{1-6} のものなどが挙げられる。

式(I)中のシクロアルキルとしては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルのような C_{3-6} のシクロアルキルが挙げられる。

10

【0011】

式(I)中のアルケニルとしては、直鎖状又は分枝状のいずれでもよく、その具体例としては、ビニル、1-プロペニル、アリル、イソプロペニル、1-ブテニル、1,3-ブタジエニル、1-ヘキセニルのような C_{2-6} のものなどが挙げられる。

式(I)中のアルキニルとしては、直鎖状又は分枝状のいずれでもよく、その具体例としては、エチニル、2-ブチニル、2-ペンチニル、3-メチル-1-ブチニル、2-ペンテン-4-イニル、3-ヘキシニルのような C_{2-6} のものなどが挙げられる。

式(I)中のアリールとしては、例えばフェニル、ナフチル等の C_{6-10} のアリールが挙げられる。

20

【0012】

式(I)中の複素環基、複素環アルキル、複素環オキシ或いは複素環チオ中の複素環基部分としては、単環式複素環基の他、縮合複素環基が含まれる。単環式複素環基としては、例えばオキシラニルのような3員複素環基；フリル、テトラヒドロフリル、チエニル、ピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、ジオキサラニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ジヒドロイソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、ピラゾリル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、1,3-ジオキサラニル、1,3-オキサチオラニル、1,3-オキサチオラニル-3-オキシドなどの5員複素環基；ピラニル、ピリジル、ピペリジニル、ジオキサニル、オキサジニル、モルホリニル、チアジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピペラジニル、トリアジニル、1,3-ジオキサニル、テトラヒドロピラニル、2H-1,4-オキサチイニル、1,3-ジチオラニルなどの6員複素環基が挙げられる。これら単環式複素環基の中では、O、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~4含有する5若しくは6員複素環基が望ましい。縮合複素環基としては、例えばベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロイソベンゾフラニル、ベンゾチエニル、イソベンゾチエニル、ジヒドロベンゾチエニル、ジヒドロイソベンゾチエニル、テトラヒドロベンゾチエニル、インドリル、イソインドリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾジオキサラニル、ベンゾジオキサニル、クロメニル、クロマニル、イソクロマニル、クロモニル、クロマノニル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、インドリジニル、キノリジニル、イミダゾピリジニル、ナフチリジニル、プテリジニル、ジヒドロベンゾオキサジニル、ジヒドロベンゾオキサゾリノニル、ジヒドロベンゾオキサジノニル、ベンゾチオキサニル、イミダゾピリジニルなどが挙げられる。これら縮合複素環基の中では、O、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~4含有する8~10員縮合複素環基が望ましい。

30

40

【0013】

式(I)中の各置換基に含まれる NR^aR^c 部分は、 R^a と R^c が一緒になって、両者が結合する窒素原子とともに5員又は6員の複素環を形成してもよい。この5員又は6員の複素環は、さらに、 R^a と R^c が結合する窒素原子の他に、さらに1個以上のヘテロ原子を包含しているものであってもよい。こういった複素環としては、ピロリジニル、ピラゾリジ

50

ニル、ピペラジニル、モルホリニルなどが挙げられる。また、式 (I) 中の R^6 と R^7 が一緒になって形成する炭素数 3～6 のシクロアルキルとしては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどのシクロアルキルが挙げられ、これらはハロゲン原子で置換されたものであってもよい。

【0014】

前記式 (I) で表されるピリジルーメタナミン誘導体の塩としては、農業上許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩のようなアルカリ金属塩；マグネシウム塩、カルシウム塩のようなアルカリ土類金属塩；ジメチルアンモニウム塩、トリエチルアンモニウム塩のようなアンモニウム塩；塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。

10

【0015】

前記式 (I) で表されるピリジルーメタナミン誘導体には、光学異性体、幾何異性体のような異性体が存在する場合があるが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。本願明細書においては、特に言及しない限り、異性体は混合物として記載する。尚、本発明には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記したもの以外の各種異性体も含まれる。また、異性体の種類によっては、前記式 (I) とは異なる化学構造となる場合があるが、当業者であればそれらが異性体の関係にあることが十分認識できる為、本発明の範囲内であることは明らかである。

20

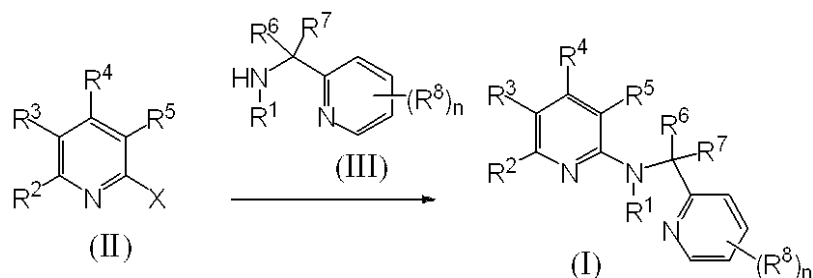
【0016】

前記式 (I) で表されるピリジルーメタナミン誘導体又その塩は、以下の製法〔1〕～〔10〕並びに、通常の塩の製造方法に従って製造することができる。

製法〔1〕

【0017】

【化2】



30

【0018】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 及び n は前述の通りであり； X はハロゲンであり、ハロゲンとしては弗素、塩素、臭素、沃素の各原子が挙げられる。

製法〔1〕の反応は、溶媒の存在下で行うことができる。

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；これらの混合溶媒を挙げることができる。

40

【0019】

製法〔1〕の反応において、反応を効率的に行うために、必要に応じ塩基の存在下で反応を行うことができる。塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジンなどの有機塩

50

基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ金属の水酸化物；炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ金属の炭酸塩；炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなどのアルカリ金属の炭酸水素塩；水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムなどのアルカリ金属の水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドなどのアルカリ金属アルコキシド；などを挙げることができる。

【0020】

製法〔1〕の反応において、前記式（II）の化合物1モルに対して式（III）の化合物は、0.8～5当量、望ましくは1～2.5当量の割合で使用することができる。

製法〔1〕の反応は、通常0～150℃、望ましくは0～100℃の反応温度で行われる。反応時間は、通常0.5～100時間である。

10

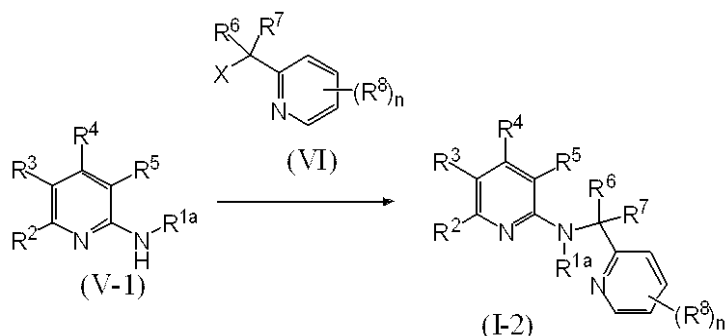
【0021】

製法〔1〕における反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

製法〔2〕

【0022】

【化3】



20

【0023】

R^{1a} は、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、 R^b で置換されてもよいアルキニル、アリール、アルキル若しくはハロアルキルで置換されてもよい複素環基、 $\text{N}=\text{CHR}^c$ 、 OR^c 、 $\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 COSR^c 、 COOR^c 又は COR^c であり、 R^b 、 R^c 、 p 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 n 及び X は前述の通りである。

30

製法〔2〕の反応は、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属の水素化物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；ナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；トリエチルアミン、ピリジンなどの有機塩基；などを挙げることができる。塩基は、式（V-1）の化合物に対して1～3当量、望ましくは1～1.5当量使用できる。

40

【0024】

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドな

50

どのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1，2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；これらの混合溶媒を挙げることができる。

【0025】

製法〔2〕の反応において、前記式（V-1）の化合物1モルに対して式（VI）の化合物は、0.8～2当量の割合で使用することができる。

製法〔2〕の反応は、通常0～100℃、望ましくは0～50℃の反応温度で行われる。反応時間は、通常0.5～24時間、望ましくは0.5～5時間である。

【0026】

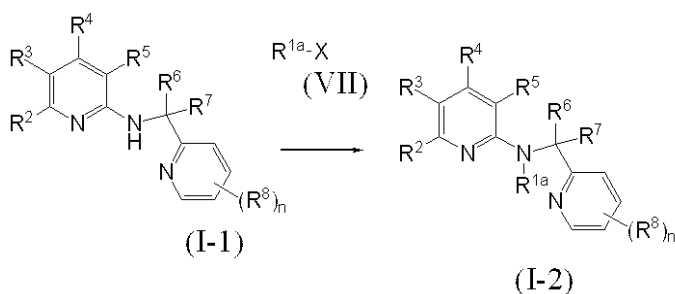
製法〔2〕における反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

10

製法〔3〕

【0027】

【化4】



20

【0028】

R^{1a} 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 n 及び X は前述の通りである。

製法〔3〕の反応は、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属の水素化物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；ナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；トリエチルアミン、ピリジンなどの有機塩基；などを挙げることができる。塩基は、式（I-1）の化合物に対して1～3当量、望ましくは1～1.5当量使用できる。

30

【0029】

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1，2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；これらの混合溶媒を挙げることができる。

40

【0030】

製法〔3〕の反応において、前記式（I-1）の化合物1モルに対して式（VII）の化合物は、0.8～2当量の割合で使用することができる。

製法〔3〕の反応は、通常0～100℃、望ましくは0～50℃の反応温度で行われる。反応時間は、通常0.5～24時間、望ましくは0.5～5時間である。

50

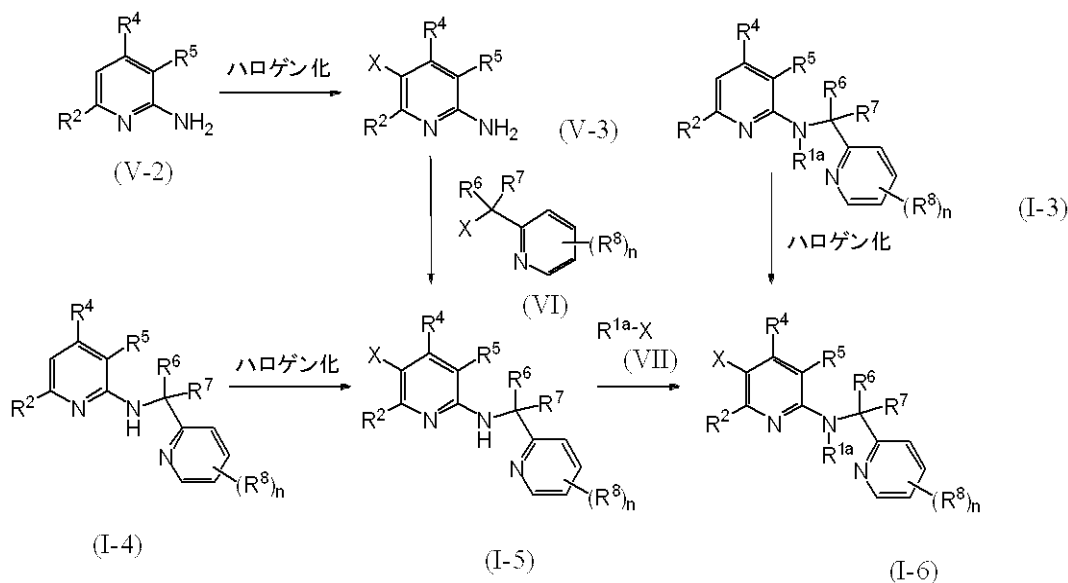
【0031】

製法〔3〕における反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

製法〔4〕

【0032】

【化5】



【0033】

R^{1a} 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 n 及び X は前述の通りである。

製法〔4〕のハロゲン化反応は、溶媒の存在下、ハロゲン化剤を用いて行うことができる。

ハロゲン化剤としては、例えば塩素、臭素、ヨウ素、 N -クロロスクシンイミド、 N -ブロモスクシンイミド、 N -ヨードスクシンイミドなどを挙げることができる。ハロゲン化剤は、式(V-2)、式(I-3)及び式(I-4)それぞれの化合物1モルに対して1~2当量、望ましくは1~1.5当量使用することができる。

30

【0034】

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；酢酸などの有機酸；これらの混合溶媒を挙げることができる。

ハロゲン化反応は、通常0~150℃、望ましくは20~100℃の反応温度で行われる。反応時間は、通常0.5~24時間、望ましくは0.5~12時間である。

40

【0035】

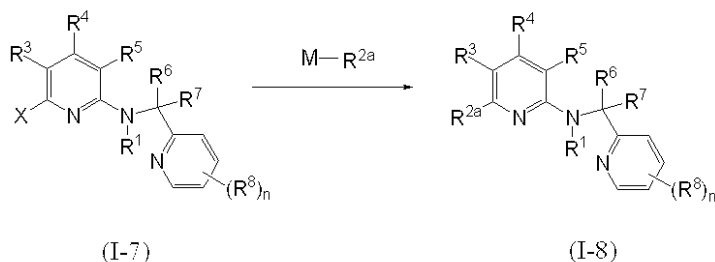
製法〔4〕の式(V-3)の化合物と式(VI)の化合物との反応は、前記の製法〔2〕の方法と同様に行うことができる。

製法〔4〕の式(I-5)の化合物と式(VII)の化合物との反応は、前記の製法〔3〕の方法と同様に行うことができる。

製法〔5〕

【0036】

【化 6】



【 0 0 3 7 】

10

R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 n 及び X は前述の通りであり、 R^{2a} は R^8 で置換されてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール又は複素環基であり、 M は銅、ホウ素、亜鉛、マグネシウム、リチウム、スズ、ケイ素などの R^{2a} を発生する脱離基である。

【 0 0 3 8 】

製法〔5〕の反応は、塩基の存在下、式 $M-R^{2a}$ で表される化合物を用いて行うことができる。

前記式 $M-R^{2a}$ で表される化合物としては、例えば有機銅化合物、有機ホウ素化合物、有機亜鉛化合物、有機マグネシウム化合物、有機リチウム化合物、有機スズ化合物、有機ケイ素化合物などを挙げることができる。当該化合物は、式 (I-7) の化合物 1 モル

20

に対して 1～3 当量、望ましくは 1～1.5 当量使用することができる。

塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属の水素化物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第 3 級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；トリエチルアミン、ピリジンなどの有機塩基；などを挙げることができる。

【 0 0 3 9 】

製法〔5〕の反応は、反応を効率的に行うために、必要に応じパラジウム化合物やニッケル化合物などの触媒を用いることができる。

30

【 0 0 4 0 】

製法〔5〕の反応は、必要に応じ溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン、ジメチルケトン、ジエチルケトン、メチルイソブチルケトンなどのケトン類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；水；これらの混合溶媒を挙げることができる。

40

【 0 0 4 1 】

製法〔5〕の反応は、通常 0～200℃、望ましくは 20～120℃ の反応温度で行われる。反応時間は、通常 0.5～24 時間である。

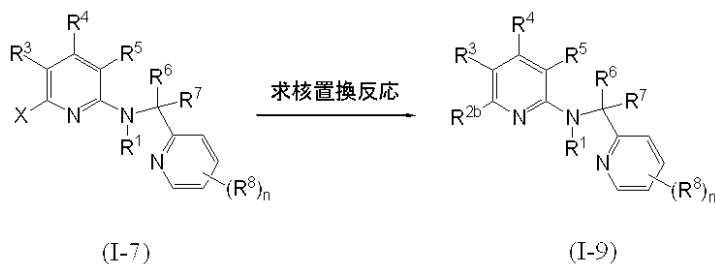
製法〔5〕における反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

製法〔6〕

50

【0042】

【化7】



10

【0043】

R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 n 及び X は前述の通りであり、 R^{2b} は NR^aR^c 、 OR^a 又は SR^a である。

製法〔6〕の求核置換反応は、溶媒の存在下、求核試薬を用いて行うことができる。

求核試薬としては、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；ナトリウムメチルメルカプタンなどのようなアルカリ金属メルカプチド；メチルアミン、ジメチルアミン、ピペリジンなどの1級及び2級アミン類；などを挙げることができる。求核試薬は、式（I-7）の化合物1モルに対してそれぞれ1～5当量、望ましくは1～3当量使用することができる。

【0044】

20

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン、ジメチルケトン、ジエチルケトン、メチルイソブチルケトンなどのケトン類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；水；これらの混合溶媒を挙げることができる。

30

【0045】

製法〔6〕の求核置換反応は、通常0～200℃、望ましくは0～100℃の反応温度で行われる。反応時間は、通常0.5～24時間である。

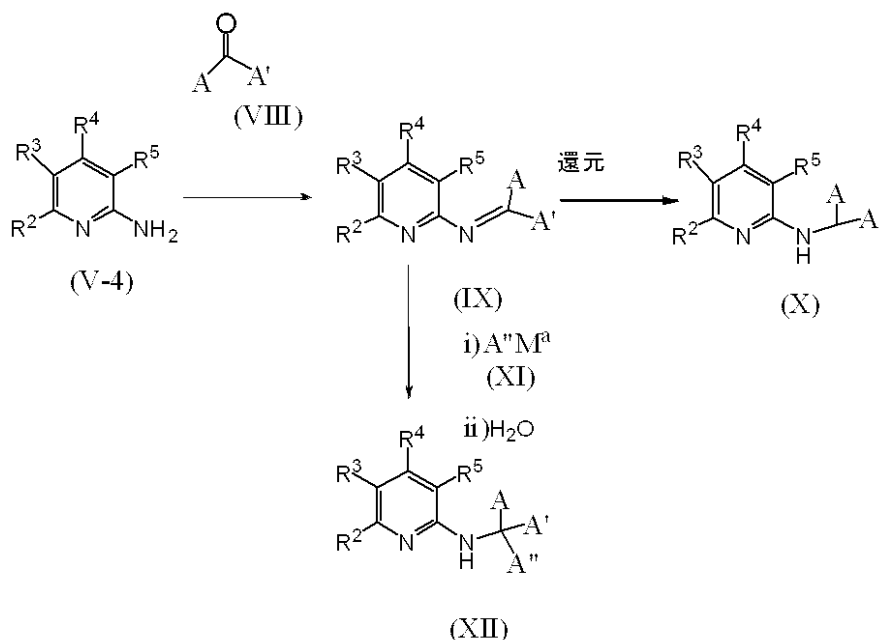
製法〔6〕における反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

製法〔7〕

【0046】

40

【化 8】



10

【0047】

A 及び A' は各々独立に水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アリール又は R⁸ で置換されてもよい複素環基であり、A'' はアルキル、アルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル又はシアノであり、M^a はハロゲン化マグネシウム、金属又は CN⁻ を発生する脱離基であり、R²、R³、R⁴、R⁵ 及び R⁸ は前述の通りである。

20

【0048】

式 (IX) の化合物は、式 (V-4) の化合物と式 (VIII) の化合物とを溶媒中で縮合反応させることにより製造することができる。

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；酢酸エチル、酢酸メチルなどのエステル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；これらの混合溶媒を挙げることができる。

30

【0049】

前記縮合反応を効率的に行うために、必要に応じ酸触媒を用いることができる。酸触媒としては、例えば、塩酸、硫酸のような無機酸；酢酸、カンファースルホン酸、p-トルエンスルホン酸、ピリジニウム p-トルエンスルホナートのような有機酸；などを挙げることができる。

40

縮合反応において、前記式 (V-4) の化合物 1 モルに対して式 (VIII) の化合物は、1 ~ 2 当量、望ましくは 1.2 ~ 1.5 当量の割合で使用することができる。

縮合反応は、通常 0 ~ 150 °C、望ましくは 50 ~ 100 °C の反応温度で行われる。反応時間は、通常 5 ~ 100 時間である。

【0050】

縮合反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

【0051】

50

式 (X) の化合物は式 (IX) の化合物と還元剤とを、溶媒中で反応させることにより製造することができる。

還元剤としては、例えば、水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素ナトリウム、シアン化水素化ホウ素ナトリウムのような金属水素化物；トリエチルシラン、トリクロロシランのようなヒドロシラン類；などを挙げることができる。また、接触還元や、Leuckart-Wallach反応においてギ酸アンモニウムを還元剤として用いる方法なども選択することができる。

【0052】

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；酢酸エチル、酢酸メチルなどのエステル類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；これらの混合溶媒を挙げることができる。

【0053】

前記還元反応は、通常0～100℃、望ましくは0～40℃の反応温度で行われる。反応時間は、通常1～40時間である。

還元反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

【0054】

式 (XII) の化合物は、式 (IX) の化合物と式 (XI) の化合物とを溶媒中で反応させた後、通常の方法で加水分解することにより製造することができる。

式 (XI) の化合物は、A^{''} がアルキル、アルケニル、ハロアルキル又はシクロアルキルである場合、メチルマグネシウムブロミド又はイソプロピルマグネシウムクロライドのようなアルキルマグネシウムハライド、アリルマグネシウムブロミドのようなアルケニルマグネシウムハライド、トリフルオロメチルマグネシウムブロミドのようなハロアルキルマグネシウムハライド、シクロプロピルマグネシウムブロミドのようなシクロアルキルマグネシウムハライドなどのGrignard試薬；メチルリチウム、ブチルリチウムなどのアルキルリチウム類；メチル亜鉛、エチル亜鉛、ジエチル亜鉛などのアルキル亜鉛或いはジアルキル亜鉛類；などを挙げることができる。また、A^{''} がシアノである場合、シアン化水素、シアン化トリメチルシリル、シアン化トリブチルスズなどのシアン化合物類などを挙げることができる。式 (XI) の化合物は、式 (IX) の化合物1モルに対して通常1～4当量、望ましくは1.2～1.5当量の割合で使用することができる。

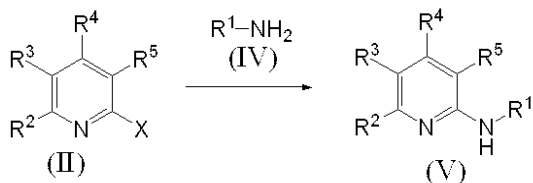
【0055】

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；これらの混合溶媒を挙げることができる。

【0056】

当反応は、通常0～100℃、望ましくは0～40℃の反応温度で行われる。反応時間は、通常1～50時間である。

製法〔8〕
 【0057】
 【化9】



10

【0058】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及びXは前述の通りである。

製法〔8〕の反応は、溶媒の存在下で行うことができる。

溶媒としては、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；これらの混合溶媒を挙げることができる。

20

【0059】

製法〔8〕の反応において、反応を効率的に行うために、必要に応じ塩基の存在下で反応を行うことができる。塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジンなどの有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのアルカリ金属の水酸化物；炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ金属の炭酸塩；炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなどのアルカリ金属の炭酸水素塩；水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムなどのアルカリ金属の水素化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドなどのアルカリ金属アルコキシド；などを挙げることができる。

30

【0060】

製法〔8〕の反応において、前記式(II)の化合物1モルに対して式(IV)の化合物は、0.8～5当量、望ましくは1～2.5当量の割合で使用することができる。

製法〔8〕の反応は、通常0～150℃、望ましくは0～100℃の反応温度で行われる。反応時間は、通常0.5～100時間である。

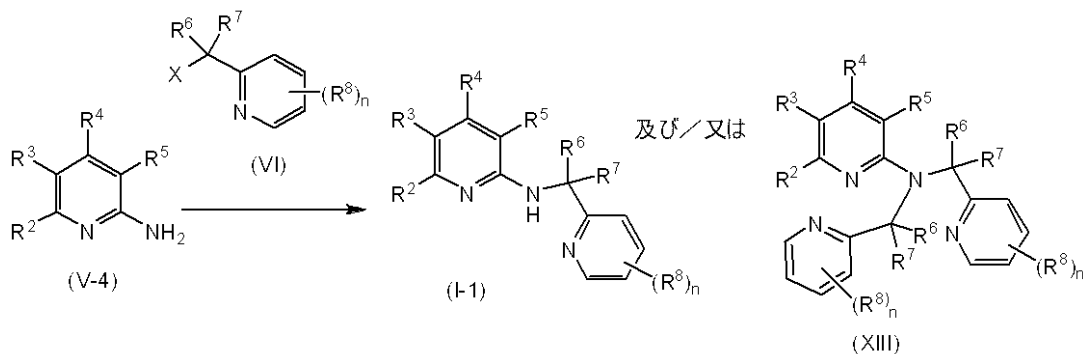
製法〔8〕における反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

40

製法〔9〕

【0061】

【化 10】



10

【0062】

R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 n 及び X は前述の通りである。

製法〔9〕の反応は、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属の水素化物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属の水酸化物；ナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属の炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属の炭酸水素塩；トリエチルアミン、ピリジンなどの有機塩基；などを挙げることができる。塩基は、式（V-4）の化合物 1 モルに対して 1～3 当量使用できる。式（I-1）の化合物を得るためには、塩基を 1～1.5 当量使用するのが望ましく、式（XIII）の化合物を得るためには、塩基を 2～2.5 当量使用するのが望ましい。

20

【0063】

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；これらの混合溶媒を挙げることができる。

30

【0064】

製法〔9〕の反応において、前記式（V-4）の化合物 1 モルに対して式（VI）の化合物は、0.8～2.5 当量の割合で使用することができる。式（I-1）の化合物を得るためには、式（VI）の化合物を 0.8～1.5 当量使用するのが望ましく、式（XIII）の化合物を得るためには、式（VI）の化合物を 2～2.5 当量使用するのが望ましい。

製法〔9〕の反応は、通常 0～100℃、望ましくは 0～50℃ の反応温度で行われる。反応時間は、通常 0.5～24 時間である。

40

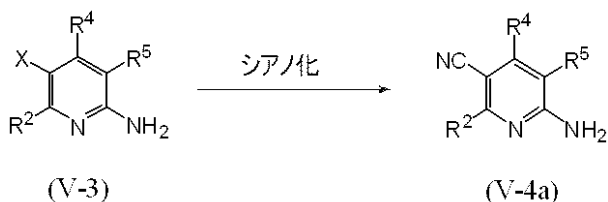
【0065】

製法〔9〕における反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

製法〔10〕

【0066】

【化 1 1】



【0067】

R^2 、 R^4 、 R^5 及びXは前述の通りである。

製法〔10〕の反応は、溶媒の存在下、シアノ化剤を用いて行うことができる。

10

シアノ化剤としては、シアン化銅、シアン化亜鉛、シアン化ナトリウム、シアン化トリメチルシリル、シアン化トリブチルスズなどを挙げることができるが、シアン化銅が望ましい。

【0068】

溶媒としては、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどのアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、石油ベンジンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなどのエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどの酸アミド類；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド類；スルホランなどのスルホン類；ヘキサメチルホスホルアミドなどのリン酸アミド類；クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素類；これらの混合溶媒を挙げることができる。

20

【0069】

製法〔10〕の反応において、前記式(V-3)の化合物1モルに対して、シアノ化剤は、0.8～5当量、望ましくは1～2.5当量の割合で使用することができる。

製法〔10〕の反応は、通常80～200℃、望ましくは100～150℃の反応温度で行われる。反応時間は、通常1～24時間である。

製法〔10〕における反応諸条件は各々適宜相互に組み合わせることができる。また、これら反応諸条件の中には、通常範囲の反応条件と望ましい範囲の反応条件を有するものがあるが、これらも適宜相互に選択し、組み合わせることができる。

30

【0070】

本発明化合物（以下、本明細書では、特に断りのない限り、式(I)で表される全ての化合物を意味する。）を含有する有害生物防除剤の望ましい態様について以下に記述する。本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、例えば農園芸分野で問題となる各種有害生物の防除剤、即ち農園芸用有害生物防除剤や、動物に寄生する有害生物の防除剤、即ち動物寄生生物防除剤として特に有用である。

【0071】

農園芸用有害生物防除剤としては、例えば、殺虫、殺ダニ、殺線虫、殺土壌害虫剤として有用であるが、具体的には、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、チャノホコリダニ、ミカンサビダニ、ネダニなどのような植物寄生性ダニ類；モモアカアブラムシ、ワタアブラムシのようなアブラムシ類；コナガ、ヨトウムシ、ハスモンヨトウ、コドリング、ボールワーム、タバコバッドワーム、マイマイガ、コブノメイガ、チャノコカクモンハマキ、コロラドハムシ、ウリハムシ、ボールウィービル、ウンカ類、ヨコバイ類、カイガラムシ類、カメムシ類、コナジラミ類、アザミウマ類、バッタ類、ハナバエ類、コガネムシ類、タマナヤガ、カブラヤガ、アリ類などのような農業害虫類；ネコブセンチュウ類、シストセンチュウ類、ネグサレセンチュウ類、イネシソウセンチュウ、イチゴメセンチュウ、マツノザイセンチュウなどのような植物寄生性線虫類；ナメクジ、マイマイなどのような腹足類；ダンゴムシ、ワラジムシのような等脚

40

50

類などのような土壌害虫類；イエダニ、ゴキブリ類、イエバエ、アカイエカなどのような衛生害虫類；バクガ、アズキゾウムシ、コクヌストモドキ、ゴミムシダマシ類などのような貯穀害虫類；イガ、ヒメカツオブシムシ、シロアリ類などのような衣類；家屋害虫類；ケナガコナダニ、コナヒョウダニ、ミナミツメダニなどのような屋内塵性ダニ類などの防除に有効である。なかでも、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類などの防除に特に有効である。また、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、有機リン剤、カーバメート剤、合成ピレスロイド剤などの薬剤に対する各種抵抗性害虫の防除にも有効である。さらに本発明化合物は、優れた浸透移行性を有していることから、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤を土壌に処理することによって土壌有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹脚類、等脚類の防除と同時に茎葉部の害虫類をも防除することができる。

10

【0072】

本発明化合物を含有する有害生物防除剤の別の望ましい態様としては、前記した植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類、腹足類、土壌害虫類などを総合的に防除する農園芸用有害生物防除剤が挙げられる。

【0073】

本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、通常該化合物と各種農業上の補助剤とを混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、水溶剤、乳剤、液剤、ペースト剤、エアゾール剤、微量散布剤などの種々の形態に製剤して使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオリナイト及びセリサイトの混合物、クレー、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉などの固型担体；水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、アルコールなどの溶剤；脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸エステル塩、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アリールリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物の塩のような陰イオン系の界面活性剤や展着剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルアリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、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ソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤や展着剤；オリーブ油、カポック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィンなどの植物油や鉱物油などが挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも該分野で知られたものの中から適宜選んで使用することもでき、例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤など通常使用される各種

20

30

40

50

補助剤も使用することができる。本発明化合物と各種補助剤との配合割合は0.001：99.999～95：5、望ましくは0.005：99.995～90：10である。これら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、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油など）を添加して使用することができる。

【0074】

本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤の施用は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病害虫の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に0.05～800000ppm、望ましくは0.5～500000ppmの有効成分濃度で行ない、その単位面積あたりの施用量は、1ヘクタール当り本発明化合物が0.05～50000g、望ましくは1～30000gである。また、本発明化合物を含有する有害生物防除剤の別の望ましい態様である農園芸用の有害生物防除剤の施用は、前記有害生物防除剤の施用に準じて行われる。本発明には、このような施用方法による有害生物の防除方法、特に植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類の防除方法も含まれる。

【0075】

本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤の種々の製剤、又はその希釈物の施用は、通常一般に行なわれている施用方法すなわち、散布（例えば散布、噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粒、水面施用等）、土壌施用（混入、灌注等）、表面施用（塗布、粉衣、被覆等）、浸漬毒餌等により行うことができる。また、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及び生育を阻害することも可能である。またいわゆる超高濃度少量散布法(ultra low volume)により施用することもできる。この方法においては、活性成分を100%含有することが可能である。

【0076】

また、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤などと混用或は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、抗ウィルス剤、誘引剤、抗生物質、植物ホルモン、植物成長調整剤などが挙げられる。特に、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物の1種又は2種以上とを混用或は併用した混合有害生物防除組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物は各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような混合有害生物防除組成物も含まれる。

【0077】

本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物との混合比は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病害虫の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に1：300～300：1、望ましくは1：100～100：1である。また、施用適量は1ヘクタール当りの総有効成分化合物量として0.1～50000g、望ましくは1～30000gである。本発明には、このような混合有害生物防除組成物の施用方法による有害生物の防除方法も含まれる。

【0078】

上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壌害虫剤の有効成分化合物（一般名；申請中のものも含む）としては、例えばプロフェノホス（profenofos）、ジクロルボス（dichlorvos）、フェナミホス（fenamiphos）、フェニトロチオン（fenitrothion）、E P N、ダイアジノン（diazinon）、クロルピリホスメチル（chlorpyrifos-methyl）、アセフェート（acephate）、プロチオホス（prothiofos）、ホスチアゼート（fosfithiazate）、ホスホカルブ（phosphocarb）、カズサホス（cadusafos）、ジスルホトン（disulfoton）、クロルピリホス（chlorpyrifos）、デメトン-S-メチル（demeton-S-methyl）、ジメトエート（dimethoate）、メタミドホス（methamidophos）、イミシアホス（imicyafos）、イソキサチオン（isoxathion）、イソフェンホス（isofenphos）、エチオン（ethion）、エトリムホス（etrimfos）、キナルホス（quinalphos）、ジメチルビンホス（dimethylvinphos）、スルプロホス（sulprofos）、チオメトン（thiometon）、バミドチオン（vamidotion）、ピラクロホス（pyraclofos）、ピリダフェンチオン（pyridaphenthion）、ピリミホ

スメチル(pirimiphos-methyl)、プロパホス(propaphos)、ホサロン(phosalone)、ホルモチオン(formothion)、マラチオン(malathion)、テトラクロルビンホス(tetrachlovinphos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、シアノホス(cyanophos)、トリクロルホン(trichlorfon)、メチダチオン(methidathion)、フェントエート(phenthoate)、E S P、アジンホスメチル(azinphos-methyl)、フェンチオン(fenthion)、ヘプテノホス(heptenophos)、メトキシクロル(methoxychlor)、パラチオン(paration)、モノクロトホス(monocrotophos)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、テルブホス(terbufos)、ホスファミドン(phosпамidon)、ホスメット(phosmet)、ホレート(phorate)のような有機リン酸エステル系化合物；

【0079】

カルバリル(carbaryl)、プロボキスル(propoxur)、アルジカルブ(aldicarb)、カルボフラン(carbofuran)、チオジカルブ(thiodicarb)、メソミル(methomyl)、オキサミル(oxamyl)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、ピリミカルブ(pirimicarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、カルボスルファン(carbosulfan)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocarb)、メトルカルブ(metolcarb)、キシリルカルブ(xylylcarb)、X M C、フェノチオカルブ(fenothiocarb)のようなカーバメート系化合物；

カルタップ(cartap)、チオシクラム(thiocyclam)、ベンスルタップ(bensultap)、チオスルタップナトリウム(thiosultap-sodium)のようなネライストキシン誘導体；
ジコホル(dicofol)、テトラジホン(tetradifon)、エンドスルファン(endosulfan)、ジエノクロル(dienochlor)、ディルドリン(dieldrin)のような有機塩素系化合物；

酸化フェンブタスズ(fenbutatin Oxide)、シヘキサチン(cyhexatin)のような有機金属系化合物；

【0080】

フェンバレレート(fenvalerate)、ペルメトリン(permethrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、テフルトリン(tefluthrin)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、ビフェントリン(bifenthrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルバリネート(fluvalinate)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、ラムダシハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ピレスリン(pyrethrins)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、テトラメスリン(tetramethrin)、レスメスリン(resmethrin)、プロトリフェンブト(protrifenbute)、ゼータシペルメトリン(zeta-cypermethrin)、アクリナトリン(acrinathrin)、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、アレスリン(allethrin)、ガンマシハロトリン(gamma-cyhalothrin)、シータシペルメトリン(theta-cypermethrin)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、トラロメスリン(tralomethrin)、プロフルスリン(profluthrin)、ベータシペルメトリン(beta-cypermethrin)、ベータシフルトリン(beta-cyfluthrin)、メトフルトリン(metofluthrin)のようなピレスロイド系化合物；

ジフルベンズロン(diflubenzuron)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、ルフエヌロン(Lufenuron)、ノバルロン(Novaluron)、トリフルムロン(triflumuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、ビストリフルロン(bistrifluron)、フルアズロン(fluzuron)のようなベンゾイルウレア系化合物；

メトプレン(methoprene)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、ジオフェノラン(diofenolan)のような幼若ホルモン様化合物；

ピリダベン(pyridaben)のようなピリダジノン系化合物；

【0081】

フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フィプロニル(fipronil)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、エチプロール(ethiprole)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)

10

20

30

40

50

、アセトプロール (acetoprole)、ピラフルプロール (pyrafluprole)、ピリプロール (pyriprole) のようなピラゾール系化合物；

イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyram)、アセタミプリド (acetamiprid)、チアクロプリド (thiacloprid)、チアメトキサム (thiamethoxam)、クロチアニジン (clothianidin)、ジノテフラン (dinotefuran)、ニチアジン (nithiazin e) などのネオニコチノイド；

テブフェノジド (tebufenozide)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、クロマフェノジド (chromafenozide)、ハロフェノジド (halofenozide) などのヒドラジン系化合物；

【0082】

その他の化合物として、フロニカミド (flonicamid)、ブプロフェジン (buprofezin)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、アミトラズ (amitraz)、クロルジメホルム (chlor dimeform)、シラフルオフエン (silaf luofen)、トリアザメイト (triazamate)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリミジフェン (pyrimidifen)、クロルフエナピル (chlorf enapyr)、インドキサカルブ (indoxacarb)、アセキノシル (acequinocyl)、エトキサゾール (etoxazole)、シロマジン (cyromazine)、1,3-ジクロロプロペン (1,3-dichloropropene)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ベンクロチアズ (benclothiaz)、フルフェンリム (flufenerim)、ピリダリル (pyridalyl)、スピロジクロフェン (Spiro diclofen)、ビフェナゼート (bifenazate)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スピロテトラマト (spirotetramat)、プロパルギット (propargite)、クロフェンテジン (clofentezine)、フルアクリピリム (fluacrypyrim)、メタフルミゾン (metaflum izezone)、フルベンジアミド (flubendiamide)、クロルアントラニルプロール (chlorant raniliprole)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、シエノピラフェン (cyenopyrafen)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazone)、フェナザキン (fenazaquin)、ピリダベン (pyridaben)、アミドフルメット (amidoflumet)、クロロベンゾエート (chlorobenzoa te)、スルフルアミド (sulfluramid)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、メタアルデヒド (metaldehyde)、リアノジン (ryanodine) のような化合物などが挙げられる。

【0083】

更に、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis* 又は *Bacillus thuringiensis* が生成する結晶タンパク毒素、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤などのような微生物農薬；アベルメクチン (avermectin)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-Benzoate)、ミルベメクチン (milbemectin)、スピノサッド (spinosad)、イベルメクチン (ivermectin)、レピメクチン (lepimectin)、スピネトラム (spinetoram)、アバメクチン (abamectin)、エマメクチン (emamectin) のような抗生物質或いはその半合成物質；アザディラクチン (Azadirachtin)、ロテノン (Rotenone) のような天然物；ディート (deet) のような忌避剤などが挙げられる。

【0084】

上記他の農薬中の、殺菌性有効成分化合物（一般名；申請中のものも含む、又は日本植物防疫協会供試試験コード）としては、例えば、メパニピリム (mepanipyrim)、ピリメサニル (pyrimethanil)、シプロジニル (cyprodinil) のようなアニリノピリミジン系化合物；

フルアジナム (fluazinam) のようなピリジナミン系化合物；

トリアジメホン (triadimefon)、ビテルタノール (bitertanol)、トリフルミゾール (triflumizole)、エタコナゾール (etaconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、ペンコナゾール (penconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、マイクロブタニル (myclobutanil)、シプロコナゾール (cyproconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ファーコナゾールシス (furconazole - cis

10

20

30

40

50

)、プロクロラズ (prochloraz)、メトコナゾール (metconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、オキスポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、シブコナゾール (sipconazole)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、トリアジメノール (triadimenol)、フルトリアフオール (Flutriafol)、ジフェノコナゾール (Difenoconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、トリシクラゾール (tricyclazole)、プロベナゾール (probenazole)、シメコナゾール (simeconazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、イブコナゾール (ipconazole)、イミベンコナゾール (imibenconazole) のようなアゾール系化合物；

10

【0085】

キノメチオネート (quinomethionate) のようなキノキサリン系化合物；

マンネブ (maneb)、ジネブ (zineb)、マンゼブ (mancozeb)、ポリカーバメート (polycarbamate)、メチラム (metiram)、プロピネブ (propineb)、チラム (thiram) のようなジチオカーバメート系化合物；

フサライド (fthalide)、クロロタロニル (chlorothalonil)、キントゼン (quintozene) のような有機塩素系化合物；

ベノミル (benomyl)、チオファネートメチル (thiophanate - Methyl)、カーベンダジム (carbendazim)、チアベンダゾール (thiabendazole)、フベリアゾール (fuberiazole)、シアゾファミド (cyazofamid) のようなイミダゾール系化合物；

20

シモキサニル (cymoxanil) のようなシアノアセトアミド系化合物；

メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシル-M (metalaxyl-M)、メフェノキサム (mefenoxam)、オキサジキシル (oxadixyl)、オフレース (ofurace)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシル-M (benalaxyl-M、別名キララキシル (kiralaxyl、chiralaxyl))、フララキシル (furalaxyl)、シプロフラム (cyprofuram) のようなフェニルアミド系化合物；

【0086】

ジクロフルアニド (dichlofluanid) のようなスルフェン酸系化合物；

水酸化第二銅 (cupric hydroxide)、有機銅 (oxine Copper) のような銅系化合物；

ヒメキサゾール (hymexazol) のようなイソキサゾール系化合物；

30

ホセチルアルミニウム (fosetyl - Al)、トルコホスメチル (tolcofos - methyl)、S-ベンジル O、O-ジオイソプロピルホスホロチオエート、O-エチル S、S-ジフェニルホスホロジチオエート、アルミニウムエチルヒドロゲンホスホネート、エジフェンホス (edifenphos)、イプロベンホス (iprobenfos) のような有機リン系化合物；

キャプタン (captan)、キャプタホル (captafol)、フォルペット (folpet) のようなN-ハロゲノチオアルキル系化合物；

プロシミドン (procymidone)、イプロジオン (iprodione)、ビンクロゾリン (vinclozolin) のようなジカルボキシイミド系化合物；

【0087】

フルトラニル (flutolanil)、メプロニル (mepronil)、ゾキサミド (zoxamid)、チアジニル (tiadinil) のようなベンズアニリド系化合物；

40

カルボキシシン (carboxin)、オキシカルボキシシン (oxycarboxin)、チフルザミド (thifluza-mide)、ペンチオピラド (penthioopyrad)、ボスカリド (boscalid) のようなアニリド系化合物；

トリホリン (triforine) のようなピペラジン系化合物；

ピリフェノックス (pyrifenox) のようなピリジン系化合物；

フェナリモル (fenarimol)、フルトリアフオール (flutriafol) のようなカルビノール系化合物；

フェンプロピディン (fenpropidine) のようなピペリジン系化合物；

フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、トリデモルフ (tridemorph) のようなモルフォ

50

リン系化合物；

【0088】

フェンチンヒドロキシド (fentin hydroxide)、フェンチンアセテート (fentin acetate) のような有機スズ系化合物；

ペンシキュロン (pencycuron) のような尿素系化合物；

ジメトモルフ (dimethomorph)、フルモルフ (flumorph) のようなシナミック酸系化合物；

ジエトフェンカルブ (diethofencarb) のようなフェニルカーバメート系化合物；

フルジオキシニル (fludioxonil)、フェンピクロニル (fenpiclonil) のようなシアノピロール系化合物；

アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クレソキシムメチル (kresoxim-Methyl)、メトミノフェン (metominofen)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、オリザストロビン (oryzastrobin)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、フルアクリピリム (flucacrypyrin) のようなストロビルリン系化合物；

【0089】

ファミキサドン (famoxadone) のようなオキサゾリジノン系化合物；

エタボキサム (ethaboxam) のようなチアゾールカルボキサミド系化合物；

シルチオフアム (silthiopham) のようなシリルアミド系化合物；

イプロバリカルブ (iprovalicarb)、ベンチアバリカルブーイソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl) のようなアミノアシッドアミドカーバメート系化合物；

フェナミドン (fenamidone) のようなイミダゾリジン系化合物；

フェンヘキサミド (fenhexamid) のようなヒドロキシアニリド系化合物；

フルスルファミド (flusulfamide) のようなベンゼンスルホンアミド系化合物；

シフルフェナミド (cyflufenamid) のようなオキシムエーテル系化合物；

フェノキサニル (fenoxanil) のようなフェノキシアミド系化合物；

バリダマイシン (validamycin)、カスガマイシン (kasugamycin)、ポリオキシン (polyoxins) のような抗生物質；

イミノクタジン (iminocytadine) のようなグアニジン系化合物；

【0090】

また、その他の化合物として、イソプロチオラン (isoprothiolane)、ピロキロン (pyroquilon)、ジクロメジン (diclomezine)、キノキシフェン (quinoxifen)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride)、スピロキサミン (spiroxamine)、クロルピクリン (chloropicrin)、ダゾメット (dazomet)、メタムナトリウム塩 (metam-sodium)、ニコピフェン (nicobifen)、メトラフェノン (metrafenone)、UBF-307、ジクロシメット (diclocymet)、プロキンアジド (proquinazid)、アミスルプロム (amisulbrom；別名アミブロムドール (amibromdole))、KIF-7767 (KUF-1204、pyribencarb methyl、mepyracarb)、Syngenta 446510 (mandipropamid、dipromandamid)、フルオピコリド (fluopicolide)、カルプロバミド (carpropamid)、BCF051、BCM061、BCM062などが挙げられる。

【0091】

その他、本発明化合物と混用或いは併用することが可能な農薬としては、例えば、Farm Chemicals Handbook (2002年版) に記載されているような除草剤の有効成分化合物、特に土壌処理型のものなどがある。

【0092】

動物寄生生物防除剤としては、例えば、宿主動物の体表（背、腋下、下腹部、内股部など）に寄生する外部寄生生物や、宿主動物の体内（胃、腸管、肺、心臓、肝臓、血管、皮下、リンパ組織など）に寄生する内部寄生生物の防除に有効であるが、なかでも、外部寄生生物の防除に有効である。

【0093】

外部寄生生物としては、例えば、動物寄生性のダニやノミなどが挙げられる。これらの種類は非常に多く、全てを列記することが困難であるので、その一例を挙げる。

【0094】

動物寄生性のダニとしては、例えばオウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campulata*)、イスカチマダニ (*Haemaphysalis concinna*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis japonica*)、ヒゲナガチマダニ (*Haemaphysalis kitaokai*)、イヤスチマダニ (*Haemaphysalis ias*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*)、シュルツェマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megaspinosa*)、アミノカクマダニ (*Dermacentor reticulatus*)、タイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanensis*) のようなマダニ類；ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)；トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、ミナミトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*) のようなトリサシダニ類；ナンヨウツツガムシ (*Eutrombicula wichmanni*)、アカツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*)、フトゲツツガムシ (*Leptotrombidium pallidum*)、フジツツガムシ (*Leptotrombidium fuji*)、トサツツガムシ (*Leptotrombidium tosa*)、ヨーロッパアキダニ (*Neotrombicula autumnalis*)、アメリカツツガムシ (*Eutrombicula alfreddugesi*)、ミヤガワタマツツガムシ (*Helenicula miyagawai*) のようなツツガムシ類；イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*)、ウサギツメダニ (*Cheyletiella parasitivorax*)、ネコツメダニ (*Cheyletiella blakei*) のようなツメダニ類；ウサギキュウセンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウシシヨクヒダニ (*Chorioptes bovis*)、イヌミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、ネコショウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*) のようなヒゼンダニ類；イヌニキビダニ (*Demodex canis*) のようなニキビダニ類などが挙げられる。なかでも、本発明化合物を含有する動物寄生生物防除剤は、マダニ類などの防除に特に有効である。

【0095】

ノミとしては、例えば、ノミ目 (*Siphonaptera*) に属する外部寄生性無翅昆虫、より具体的には、ヒトノミ科 (*Pulicidae*)、ナガノミ科 (*Ceratephyllus*) などに属するノミ類が挙げられる。ヒトノミ科に属するノミ類としては、例えば、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、ニワトリフトノミ (*Echidnophaga gallinacea*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)、メクラネズミノミ (*Leptopsylla segnis*)、ヨーロッパネズミノミ (*Nosopsyllus fasciatus*)、ヤマトネズミノミ (*Monopsyllus anisus*) などが挙げられる。なかでも、本発明化合物を含有する動物寄生生物防除剤は、ヒトノミ科に属するノミ類、特にイヌノミ、ネコノミなどの防除に有効である。

【0096】

その他の外部寄生生物としては、例えば、ウシジラミ、ウマジラミ、ヒツジジラミ、ウシホソジラミ、アタマジラミのようなシラミ類；イヌハジラミのようなハジラミ類；ウシアブ、ウアイヌカカ、ツメトゲブユのような吸血性双翅目害虫などが挙げられる。また、内部寄生生物としては、例えば、肺虫、ベンチュウ、結節状ウオーム、胃内寄生虫、回虫、糸状虫類のような線虫類；マンソン裂頭条虫、広節裂頭条虫、瓜実条虫、多頭条虫、単包条虫、多包条虫のような条虫類；日本住血吸虫、肝蛭のような吸虫類；コクシジウム、マラリア原虫、腸内肉胞子虫、トキソプラズマ、クリプトスポリジウムのような原生動物などが挙げられる。

【0097】

宿主動物としては、種々の愛玩動物、家畜、家禽などが挙げられ、より具体的には、イヌ、ネコ、マウス、ラット、ハムスター、モルモット、リス、ウサギ、フェレット、鳥（例えば、ハト、オウム、九官鳥、文鳥、インコ、ジュウシマツ、カナリアなど）、ウシ、

ウマ、ブタ、ヒツジ、アヒル、ニワトリなどが挙げられる。なかでも、本発明化合物を含有する動物寄生生物防除剤は、愛玩動物又は家畜に寄生する有害生物、特に外部寄生生物の防除に有効である。愛玩動物又は家畜の中ではイヌ、ネコ、ウシ又はウマに特に有効である。

【0098】

本発明化合物を動物寄生生物防除剤として使用する際、そのまま使用してもよく、また、適当な補助剤と共に粉剤、粒剤、錠剤、散剤、カプセル剤、液状剤、乳剤、水生懸濁剤、油性懸濁剤などの種々の形態に製剤して使用することもできる。尚、前記製剤形態以外にも、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、前記した農園芸用有害生物防除剤の製剤用補助剤として例示した陰イオン系の界面活性剤や非イオン系の界面活性剤；セチルトリメチルアンモニウムブロミドのような陽イオン系の界面活性剤；水、アセトン、アセトニトリル、モノメチルアセトアミド、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、2-ピロリドン、N-メチル-2-ピロリドン、ケロシン、トリアセチン、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、液体ポリオキシエチレングリコール、ブチルジグリコール、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールノルマルブチルエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジプロピレングリコールノルマルブチルエーテルのような溶剤；ブチルヒドロキシアニソール、ブチルヒドロキシトルエン、アスコルビン酸、メタ亜硫酸水素ナトリウム、プロピル没食子酸塩、チオ硫酸ナトリウムのような酸化防止剤；ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、酢酸ビニルとビニルピロリドンのコポリマーのような被膜形成剤；前記した農園芸用有害生物防除剤の製剤用補助剤として例示した植物油や鉱物油；乳糖、蔗糖、ブドウ糖、澱粉、麦粉、コーン粉、大豆油粕、脱脂米糠、炭酸カルシウム、その他市販の飼料原料のような担体などが挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選択して使用することもでき、更には、前記した農園芸分野で使用される各種補助剤などから適宜選択して使用することもできる。

【0099】

本発明化合物と各種補助剤との配合割合は、通常0.1：99.9～90：10程度である。これら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、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油など）を添加して使用することができる。

宿主動物への本発明化合物の投与は、経口又は非経口によって行われる。経口投与方法としては、例えば本発明化合物を含有する錠剤、液状剤、カプセル剤、ウエハース、ビスケット、ミンチ肉、その他の飼料等を投与する方法などが挙げられる。非経口投与方法としては、例えば本発明化合物を適当な製剤に調製した上で、静注投与、筋肉内投与、皮内投与、皮下投与等により体内に取り込ませる方法；スポットオン（spot-on）処理、ポウオン（pour-on）処理、スプレー処理等により体表面に投与する方法；宿主動物の皮下に本発明化合物を含有する樹脂片等を埋め込む方法などが挙げられる。

【0100】

宿主動物への本発明化合物の投与量は、投与方法、投与目的、疾病症状等によって異なるが、通常、宿主動物の体重1Kgに対して0.01mg～100g、望ましくは0.1mg～10gの割合で投与するのが適当である。

本発明には、前記したような投与方法又は投与量による有害生物の防除方法、特に外部寄生生物又は内部寄生生物の防除方法も含まれる。

また、本発明においては、前述のようにして動物寄生性の有害生物を防除することにより、それらに起因する宿主動物の各種疾患を予防又は治療できる場合がある。このように、本発明には、本発明化合物を有効成分として含有する寄生生物起因動物疾患の予防又は

治療剤並びに、寄生生物起因動物疾患を予防又は治療する方法も含まれる。

【0101】

本発明化合物を動物寄生生物防除剤として使用する際、補助剤と共に各種ビタミン類、ミネラル類、アミノ酸類、栄養剤、酵素製剤、解熱剤、鎮静剤、消炎剤、殺菌剤、着色剤、芳香剤、保存剤等と混用又は併用することができる。また、必要に応じて他の各種動物薬や農薬、例えば駆虫剤、抗コクシジウム剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺ノミ剤、殺線虫剤、殺菌剤、抗菌剤などと混用又は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。本発明には、前記したような各種成分を混用又は併用した混合有害生物防除組成物が含まれ、また、それを使用した有害生物の防除方法、特に外部寄生生物又は内部寄生生物の防除方法も含まれる。

10

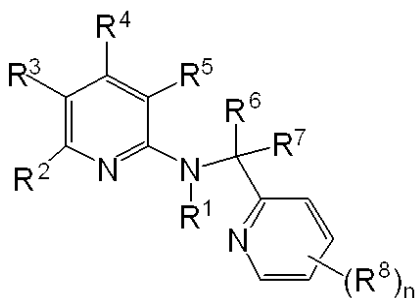
【0102】

前記式(I)で表される化合物の望ましい態様は以下の通りである。但し、本発明はこれらに限定されるものではない。

(1) 式(I)：

【0103】

【化12】



20

〔式中、 R^1 は水素原子、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、 R^b で置換されてもよいアルキニル、アリール、シアノ、 $N=CHR^c$ 、 OR^c 、 $S(O)_pR^c$ 、 $COSR^c$ 、 $COOR^c$ 又は COR^c であるか、 R^1 はアルキル若しくはハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり； R^2 及び R^3 は各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、 NR^aR^c 、 OR^a 、 SR^a 、 COR^a 、 $COOR^a$ 、 $CONR^aR^c$ 、 $CH=NOR^a$ 、 SO_2R^a 又は SOR^a であり； R^4 はトリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルであり； R^5 は水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、 R^8 で置換されてもよいアルケニル、 R^8 で置換されてもよいアルキニル、 OR^a 、 SR^a 、 NR^aR^c 、 $COOR^a$ 又は COR^a であり； R^6 及び R^7 は各々独立に、水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル又はシクロアルキルであるか、 R^6 と R^7 が一緒になってハロゲンで置換されてもよい炭素数3～6のシクロアルキルを形成してもよく； R^8 はアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、ハロゲンで置換されてもよいアリール、ハロゲンで置換されてもよい複素環基、ハロゲンで置換されてもよい複素環オキシ、 $CONR^aR^c$ 、 COR^c 、 $COOR^c$ 、 NR^aR^c 又は OR^a であり； R^a は水素原子、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル又は複素環アルキルであり； R^b はハロゲン、 R^8 で置換されてもよいアリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、 R^8 で置換されてもよい複素環オキシ、 R^8 で置換されてもよい複素環チオ、シアノ、 NR^aR^c 、 $NHCOOR^a$ 、 COR^c 、 $COOR^c$ 、 $CONR^aR^c$ 、アルコキシアルコキシ、 OR^a 又は $S(O)_pR^a$ であり； R^c は水素原子、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲンで置換されてもよいアリール又はハロアルキルで置換されてもよい複素環基であり； n は0～4の整数であり、 p は0～2の整数であり、前述した各置換基中の NR^aR^c 部分は、 R^a と R^c が一緒になって、両者が結合する窒素原子とともに5員又は6員の複素環を形成してもよい。但し、N-(2-ピリジルメチル)-3,5,6-トリクロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミンを除く〕で表され

30

40

50

るピリジルーメタナミン誘導体又はその塩。

【0104】

(2) R^1 が水素原子、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、 R^b で置換されてもよいアルキニル、アリール、ハロアルキルで置換されてもよい複素環基、 $N=CHR^c$ 、 OR^c 、 $COSR^c$ 又は COR^c であり； R^2 及び R^3 が各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、 NR^aR^c 、 OR^a 、 SR^a 、 COR^a 、 $COOR^a$ 、 $CONR^aR^c$ 、 SO_2R^a 又は SOR^a であり； R^5 が水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 R^8 で置換されてもよいアルキル、 $COOR^a$ 又は COR^a であり； R^6 及び R^7 が各々独立に、水素原子、シアノ、アルキル、ハロアルキル又はシクロアルキルであり； R^8 がアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 NR^aR^c 又は OR^a であり； R^a が水素原子、アルキル、シクロアルキル又はハロアルキルであり； R^b がハロゲン、 R^8 で置換されてもよいアリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、シアノ、 NR^aR^c 、 $NHCOOR^a$ 、 OR^a 又は SR^a であり； R^c が水素原子、アルキル、シクロアルキル、アリール又はハロアルキルで置換されてもよい複素環基である(1)に記載のピリジルーメタナミン誘導体又はその塩。

10

【0105】

(3) R^2 及び R^3 が各々独立に、水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環基、 NR^aR^c 、 OR^a 、 SR^a 、 COR^a 又は SOR^a であり； R^5 が水素原子、ハロゲン又は COR^a であり； R^8 がアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、シアノ、 NR^aR^c 又は OR^a であり； R^a が水素原子、アルキル又はハロアルキルであり； R^b がハロゲン、アリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、シアノ、 NR^aR^c 、 OR^a 又は SR^a であり； R^c が水素原子、アルキル、アリール又は複素環基である(2)に記載のピリジルーメタナミン誘導体又はその塩。

20

【0106】

(4) R^1 が水素原子、 R^b で置換されてもよいアルキル、 R^b で置換されてもよいアルケニル、アルキニル、アリール、ハロアルキルで置換されてもよい複素環基、 OR^c 又は COR^c であり； R^2 が水素原子、ハロゲン、シアノ、アルキル、ハロアルキル、アルキニル、アリール、 NR^aR^c 、 OR^a 又は SR^a であり； R^3 が水素原子、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、アリール、 NR^aR^c 、 SR^a 又は COR^a であり； R^4 がトリフルオロメチルであり； R^5 が水素原子、ハロゲン又は COR^a であり； R^6 及び R^7 が各々独立に、水素原子、アルキル又はシクロアルキルであり； R^8 がアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、シアノ又は OR^a であり； R^a が水素原子又はアルキルであり； R^b がハロゲン、アリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、 OR^a 又は NR^aR^c であり； R^c が水素原子、アルキル、アリール又は複素環基である(2)に記載のピリジルーメタナミン誘導体又はその塩。

30

【0107】

(5) R^1 が水素原子、 $R^{b'}$ で置換されてもよいアルキル、 $R^{b''}$ で置換されてもよいアルケニル、 R^b で置換されてもよいアルキニル、アリール、 OR^c 又は COR^c であり； $R^{b'}$ がハロゲン、 R^8 で置換されてもよいアリール、シアノ、 OR^a 又は SR^a であり； $R^{b''}$ がハロゲン、 R^8 で置換されてもよいアリール、 R^8 で置換されてもよい複素環基、シアノ、 OR^a 又は SR^a である(2)に記載のピリジルーメタナミン誘導体又はその塩。

40

【0108】

前記した(1)のピリジルーメタナミン誘導体又はその塩は新規化合物であり、前記製法〔1〕、製法〔2〕、製法〔3〕、製法〔4〕、製法〔5〕、製法〔6〕、製法〔7〕、製法〔8〕、製法〔9〕及び製法〔10〕に示したピリジルーメタナミン誘導体の製造方法のうち、少なくとも1つの方法を含む製造方法で製造することができる。例えば、前記製法〔1〕、製法〔2〕及び製法〔3〕のうち、少なくとも1つの方法を含む製造方法

50

で製造することができる。

【実施例】

【0109】

次に本発明の実施例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。まず本発明化合物の合成例を記載する。

合成例1 N-(2-ピリジルメチル)-6-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミン(化合物No.128)の合成

2,6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)ピリジン10gのエタノール50ml溶液中に2-ピコリルアミン10gを加え、室温で24時間攪拌後、60℃で16時間、80℃で24時間反応させた。反応終了後、エタノールを減圧下留去し、残渣に酢酸エチルを加え、酢酸エチル溶液を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下酢酸エチルを留去した。得られた固体状残渣をヘキサンで再結晶して、目的物9.55gを得た。

10

【0110】

合成例2 N-(2-ピリジルメチル)-5,6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミン(化合物No.118)の合成

N-(2-ピリジルメチル)-6-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミン5.0gのジメチルホルムアミド50ml溶液に、N-クロロスクシンイミド2.4gを室温に加え、50℃まで徐々に加温した。3時間後、N-クロロスクシンイミド0.2gを追加し1時間反応させた後、さらに0.2gを加え45分間反応させた。放冷後、反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、抽出液を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶離液:n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、目的物2.8gを得た。

20

【0111】

合成例3 N-アリル-N-(2-ピリジルメチル)-5,6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミン(化合物No.55)の合成

N-(2-ピリジルメチル)-5,6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミン300mgのジメチルホルムアミド4ml溶液に、水素化ナトリウム40mgを加え、室温で攪拌した。10分後、アリルブロマイド110mgを滴下し、室温で2.5時間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、抽出液を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶離液:n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1)で精製し、目的物150mgを得た。

30

【0112】

合成例4 N,N-ビス(2-ピリジルメチル)-5-ニトロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミン(化合物No.9)の合成

(1)氷冷下97%硫酸5mlに2-アミノ-4-(トリフルオロメチル)ピリジン1.0gを少しずつ加え、溶解するまで室温で攪拌した。反応液を-10℃まで冷却し、冷却した69%硝酸0.8ml及び97%硫酸0.6mlの混合溶液を滴下し、-10℃で30分間反応させた。氷40gに反応液を注ぎ、28%アンモニア水を加えて中和し、攪拌後、析出した結晶をろ取し、乾燥した。得られた無色パウダーを、氷冷下97%硫酸5.5mlに加え、30分間攪拌した。さらに室温で1時間攪拌した後、50℃で1時間反応させた。冷却後、氷40gに反応液を注ぎ、28%アンモニア水を加えて中和し、氷冷下攪拌した。析出した結晶をろ取し、冷水で洗浄後、乾燥して、融点138-140℃の2-アミノ-5-ニトロ-4-(トリフルオロメチル)ピリジン0.41gを得た。

40

【0113】

(2)2-アミノ-5-ニトロ-4-(トリフルオロメチル)ピリジン260mg及び(2-ブロモメチル)ピリジン臭化水素酸塩350mgのジメチルスルホキシド6ml溶液に、10M水酸化ナトリウム水溶液0.38mlを滴下し、室温で16時間反応させた。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、抽出液を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウム

50

ムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／2）で精製し、目的物130mgを得た。

【0114】

合成例5 N, N-ビス(2-ピリジルメチル)-6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジリアミン（化合物No. 90）の合成

(1) 2, 6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)ピリジン5.0gに臭化水素飽和酢酸溶液（約30%）25mlを加え、還流下反応させた。3時間後、臭化水素飽和酢酸溶液（約30%）10mlを追加し、2時間還流した。さらに臭化水素飽和酢酸溶液（約30%）10mlを追加し、2時間還流後、臭化水素飽和酢酸溶液（約30%）10mlを追加し1時間還流した。反応液を室温まで冷却後、氷冷下の10%水酸化ナトリウム水溶液200mlに加え、得られた溶液に水酸化ナトリウム（固体）を加えて塩基性にした。ジエチルエーテルで2回抽出し、抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去して、油状の2, 6-ジブロモ-4-(トリフルオロメチル)ピリジン6.9gを得た。

10

【0115】

(2) 2, 6-ジブロモ-4-(トリフルオロメチル)ピリジン1.0gのジメチルホルムアミド10ml溶液に、2, 2'-ジピコリルアミン0.72g及び炭酸水素ナトリウム0.33gを加え、90℃で19時間反応させた。放冷後、反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、抽出液を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／3）で精製し、目的物1.1gを得た。

20

【0116】

合成例6 N, N-ビス(2-ピリジルメチル)-6-ブロモ-5-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジリアミン（化合物No. 92）の合成

N, N-ビス(2-ピリジルメチル)-6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジリアミン500mgのジメチルホルムアミド5ml溶液に、N-クロロスクシンイミド170mgを加え、60℃で7時間反応させた。放冷後、反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、抽出液を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／3）で精製し、目的物500mgを得た。

30

【0117】

合成例7 N, N-ビス(2-ピリジルメチル)-5-クロロ-6-エチニル-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジリアミン（化合物No. 94）の合成

N, N-ビス(2-ピリジルメチル)-6-ブロモ-5-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジリアミン370mg、トリメチルシリルアセチレン95mg、trans-ジクロロビストリフェニルホスフィンパラジウム20mg、ヨウ化銅10mg及びトリエチルアミン4mlを4時間還流した。減圧下トリエチルアミンを留去した後、水を加え、セライトろ過した。ろ液をジエチルエーテルで2回抽出し、減圧下抽出溶媒を留去した。残渣にメタノール2ml及び1N水酸化ナトリウム水溶液4mlを加え、室温で2時間攪拌後、10%塩酸を加えて酸性にした。減圧下メタノールを留去し、炭酸ナトリウムを加えて塩基性にした後、ジエチルエーテルで2回抽出し、抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／3）で精製し、目的物250mgを得た。

40

【0118】

合成例8 N-(1-(3-ピリジル)エチル)-N-(2-ピリジルメチル)-5, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-2-ピリジリアミン（化合物No. 97）の合成

(1) 2-アミノ-6-クロロ-4-トリフルオロメチルピリジン4.56g及びジメチルホルムアミド30mlの混合溶液にN-クロロスクシンイミド3.4gを加えた後、混合溶液を80℃に加熱し、2時間反応させた。反応終了後、混合溶液を氷冷し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えた。酢酸エチルで2回抽出した後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥させた。有機層の溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリ

50

カゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝3／1）で精製し、融点118-121℃の6-アミノ-2, 3-ジクロロ-4-トリフルオロメチルピリジン3.8 gを得た。

【0119】

(2) 6-アミノ-2, 3-ジクロロ-4-トリフルオロメチルピリジン800 mg及びエタノール20 mlの混合溶液に3-ピリジンアルデヒド557 mg、モレキュラーシーブ3 g及び酢酸0.5 mlを加え、還流下3日間反応させた。反応終了後、溶媒を減圧下に留去した。残渣をエーテル50 mlに溶解させ、氷冷下にメチルマグネシウムブロマイド溶液4.6 ml（3M、エーテル溶液）を滴下した。滴下終了後、室温で1晩攪拌した。混合溶液を氷冷し、水20 mlを加えた。酢酸エチルで2回抽出した後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥させた。有機層の溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で精製し、得られた粗結晶を酢酸エチル-ヘキサンより再結晶を行うことで融点159-161℃のN-(1-(3-ピリジル)エチル)-5, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-2-ピリジルアミン308 mgを得た。

10

【0120】

(3) 水素化ナトリウム19 mg及びジメチルホルムアミド10 mlの懸濁液に、氷冷下でN-(1-(3-ピリジル)エチル)-5, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-2-ピリジルアミン133 mg及びジメチルホルムアミド1 mlの混合溶液を徐々に滴下した後、0℃で30分間攪拌した。次いで2-ブロモメチルピリジン136 mg及びジメチルホルムアミド2 mlの混合溶液を徐々に滴下した。滴下終了後、混合溶液を室温で2時間反応させた。反応終了後、混合溶液を氷冷し、水10 mlを加え、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥させた。有機層の溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で精製して、目的物111 mgを無色のオイルとして得た。

20

【0121】

合成例9 N, N-ビス(2-ピリジルメチル)-5-クロロ-4, 6-ビス(トリフルオロメチル)-2-ピリジルアミン（化合物No. 103）の合成

(1) 2-アミノ-4, 6-ビス(トリフルオロメチル)ピリジン1.5 gのジメチルホルムアミド5 ml溶液にN-クロロスクシンイミド870 mgを加えた後、混合溶液を40℃に加熱し、1時間反応させた。放冷後、水を加えて攪拌し、酢酸エチルで2回抽出した後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥させた。有機層の溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝7／3）で精製し、融点97℃の2-アミノ-5-クロロ-4, 6-ビス(トリフルオロメチル)ピリジン1.1 gを得た。

30

【0122】

(2) 2-アミノ-5-クロロ-4, 6-ビス(トリフルオロメチル)ピリジン150 mg及び2-ブロモメチルピリジン臭化水素酸塩260 mgのジメチルスルホキシド4 ml溶液に、10M水酸化ナトリウム水溶液0.2 mlを滴下し、室温で2.5時間反応させた。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、抽出液を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／3）で精製し、目的物110 mgを得た。

40

【0123】

合成例10 N-(1-(2-ピリジル)-2-メチル)プロピル-5, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-2-ピリジルアミン（化合物No. 75）の合成

6-アミノ-2, 3-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)ピリジン313 mg、2-ピリジンアルデヒド160 mg及びメタノール10 mlの混合溶液に触媒量の酢酸を加え還流下反応させた。6時間後、溶媒を減圧下に留去し、得られた油状の残渣にエーテル30 mlを加えた。この溶液にイソプロピルマグネシウムクロリドのエーテル溶液（2M）2.7 mlを氷冷下に滴下し、滴下終了後室温に昇温し、一晩攪拌した。反応溶液に水を加

50

え、酢酸エチルで2回抽出し、抽出液を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／4）で精製し、融点165－168℃の目的物182mgを得た。

【0124】

合成例11 N-(2-ピリジルメチル)-5-シアノ-4,6-ビス(トリフルオロメチル)-2-ピリジリアミン（化合物No. 286）の合成

(1) 6-アミノ-3-ブロモ-2,4-ビス(トリフルオロメチル)ピリジン1.4gのヘキサメチルリン酸トリアミド3ml溶液に、シアン化銅1.0gを加え、マイクロウェーブ照射下、140℃で4時間反応させた。放冷後、反応液に水及び酢酸エチルを加え、不溶の固形物をセライトろ過した。有機層を分離し、水層をさらに酢酸エチルで2回抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／2）で精製し、融点158－160℃の6-アミノ-3-シアノ-2,4-ビス(トリフルオロメチル)ピリジン690mgを得た。

10

【0125】

(2) 6-アミノ-3-シアノ-2,4-ビス(トリフルオロメチル)ピリジン350mg及びエタノール4mlの混合溶液に、2-ピリジナルデヒド150mg、モレキュラーシーブ0.4g及び酢酸0.1mlを加え、還流下40時間反応させた。反応終了後、ろ過し、溶媒を減圧下に留去した。残渣をエタノール4mlに溶解させ、氷冷下に水素化ホウ素ナトリウム52mgを加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水20mlを加え、酢酸エチルで2回抽出した後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムを加えて乾燥させた。有機層の溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィーで精製し、融点122－123℃の目的物82mgを得た。

20

【0126】

合成例12 N,N-ビス(2-ピリジルメチル)-6-クロロ-5-シアノ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジリアミン塩酸塩（化合物No. 330）の合成

N,N-ビス(2-ピリジルメチル)-6-クロロ-5-シアノ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジリアミン（化合物No. 24）350mgのエタノール7ml溶液に、濃塩酸1.5mlを滴下した。室温で1時間攪拌後、溶媒を減圧下留去し、得られた白色固体をエタノールでリバルブ洗浄して、融点144－146℃の目的物410mgを得た。

30

【0127】

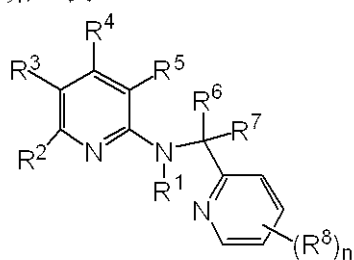
次に、前記式(I)で表される化合物の代表例を第1表に挙げる。これら化合物は前記合成例1～12或は前記した式(I)で表される化合物の種々の製造方法に基づいて合成することができる。第1表中、No.は化合物No.を示し、Meはメチル、Etはエチル、Pr(i)はイソプロピル、Bu(t)はターシャリーブチル、COはカルボニル、COOはカルボキシル、Phはフェニル、pyridylはピリジル、pyridyloxyはピリジルオキシ、piperidinoはピペリジノ、morpholinylはモルホリニルを各々示す。また、物性として示した温度は融点であり、oilは油状物を、amorphousは非結晶を、gummy oilは粘着性油状物を各々示す。又、nDは屈折率を示す。これら融点又は屈折率が示されていないものについては、¹H-NMRを第2表に示した。

40

【0128】

【表 1】

第 1 表



No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
1	H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	99-100°C
2	H	H	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	76.5°C
3	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	74-75°C
4		Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	oil
5	H	H	Br	CF ₃	Br	H	H	n=0	110-111°C
6		H	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	62-68°C
7		H	H	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
8	H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	6-CN	108-112°C
9		H	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
10	Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	nD _{20,2} =1.5618
11	H	H	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	137-138°C
12	H	H	NH ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	85-86°C
13	H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	H	n=0	92-93°C
14	H	H	H	CF ₃	NO ₂	H	H	n=0	121-123°C
15	H	H	Ph	CF ₃	H	H	H	n=0	amorphous
16	H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	H	n=0	52°C
17		H	CF ₃	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
18		H	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
19		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	76-77°C
20	H	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	156-157°C
21	H	Cl	H	CF ₃	CN	H	H	n=0	81-82°C
22	H	H	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	93-95°C
23	CH ₂ Ph	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	oil
24		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	80-81°C
25	H	Cl	CN	CF ₃	CH(OH)Me	H	H	n=0	131-132°C

10

20

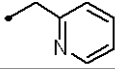
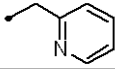
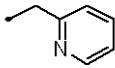
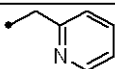
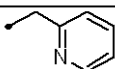
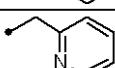
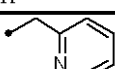
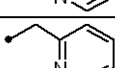
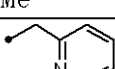
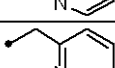
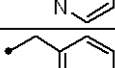
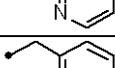
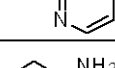
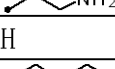
30

40

【 0 1 2 9 】

【表 2】

第 1 表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
26	H	Cl	H	CF ₃	COMe	H	H	n=0	87-88°C
27	H	Cl	COMe	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
28	H	H	NO ₂	CF ₃	NO ₂	H	H	n=0	176-179°C
29		Cl	COMe	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
30	H	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H	H	n=0	117-118°C
31	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	154-155°C
32		Cl	H	CF ₃	COMe	H	H	n=0	oil
33	H	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H	H	n=0	150-152°C
34	H	Cl	NO ₂	CF ₃	Cl	H	H	n=0	137-138°C
35		Cl	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
36		Cl	H	CF ₃	NO ₂	H	H	n=0	oil
37	H	Cl	COOMe	CF ₃	COOMe	H	H	n=0	100-101°C
38		Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	n=0	oil
39		Cl	NO ₂	CF ₃	Cl	H	H	n=0	oil
40	H	Cl	Cl	CF ₂ Cl	Cl	H	H	n=0	105-106°C
41	H	Cl	Cl	CF ₂ Cl	H	H	H	n=0	119-120°C
42		Cl	H	CF ₂ Cl	H	H	H	n=0	oil
43		Cl	Cl	CF ₂ Cl	H	H	H	n=0	oil
44	H	Cl	CONMe ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	146-147°C
45	Me	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	82-86°C
46		CN	H	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
47		Cl	CONH ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	158-159°C
48		CN	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
49		Cl	CONMe ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	amorphous
50		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
51	H	CN	H	CF ₃	H	H	H	n=0	94-96°C
52		Cl	CH(OH)Pr(i)	CF ₃	H	H	H	n=0	oil

10

20

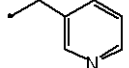
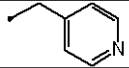
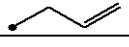
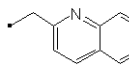
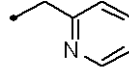
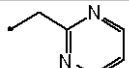
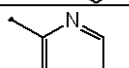
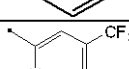
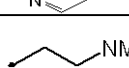
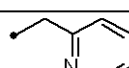
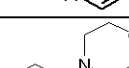
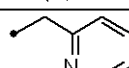
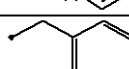
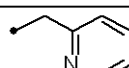
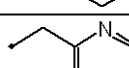
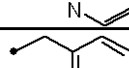
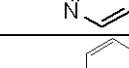
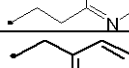
30

40

【 0 1 3 0 】

【表 3】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
53		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
54		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
55		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
56	H	CN	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	116-118°C
57		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
58		F	H	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
59		Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	amorphous
60		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	159-160°C
61		Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	138-140°C
62		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
63		F	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
64		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
65	Bu(t)	Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
66	Bu(t)	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	82°C
67		Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	H	n=0	oil
68		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	100-101°C
69	H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	3-Me	165-167°C
70		Cl	Cl	CF ₃	H	Me	H	n=0	oil
71		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	amorphous
72		F	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	58-59°C
73		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	56-57°C
74		OMe	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	71-73°C
75	H	Cl	Cl	CF ₃	H	Pr(i)	H	n=0	165-168°C

10

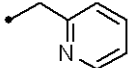
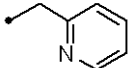
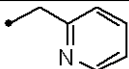
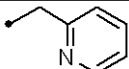
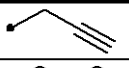
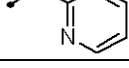
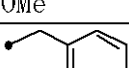
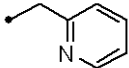
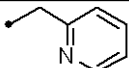
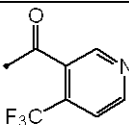
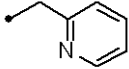
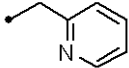
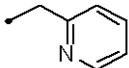
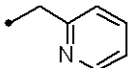
20

30

40

【表 4】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
76		Cl	Cl	CF ₃	H	Pr(i)	H	n=0	oil
77		Cl	Br	CF ₃	H	H	H	n=0	85-87°C
78		Cl	I	CF ₃	H	H	H	n=0	102-103°C
79		Cl	Cl	CF ₃	H	Et	H	n=0	oil
80		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
81		NMe ₂	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
82	OMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
83		H	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
84	H	H	CN	CF ₃	Cl	H	H	n=0	112-114°C
85	H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	3-OMe	163-165°C
86		Cl	Cl	CF ₃	H		H	H	gummy oil
87	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	92-93°C
88	H	H	CF ₃	CF ₃	Cl	H	H	n=0	100-102°C
89	COMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	81-82°C
90		Br	H	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
91		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
92		Br	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	77-78°C
93		Br	Br	CF ₃	H	H	H	n=0	71-73°C
94		- C≡CH	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
95		Me	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil

10

20

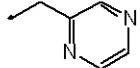
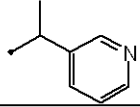
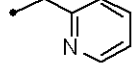
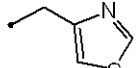
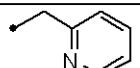
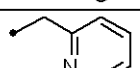
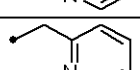
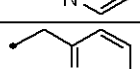
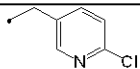
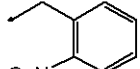
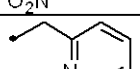
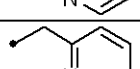
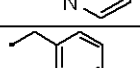
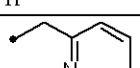
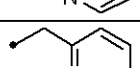
30

40

【 0 1 3 2 】

【表 5】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
96		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
97		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
98	H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	85-87°C
99		SMe	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	103-105°C
100		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	68-70°C
101	H	Me	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	94-96°C
102		Me	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
103		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	58-59°C
104		F	F	CF ₃	F	H	H	n=0	oil
105		Ph	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	158-160°C
106	H	Cl	CN	CF ₃	F	H	H	n=0	72-73°C
107		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	gummy oil
108		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	gummy oil
109		Cl	CN	CF ₃	F	H	H	n=0	87-88°C
110		CF ₃	H	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
111		Cl	Cl	CF ₃	H	Me	H	n=0	oil
112	H	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	3-Me	123-126°C
113	H	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	3-CF ₃	149-151°C
114		OMe	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
115		F	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil

10

20

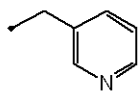
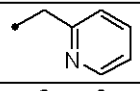
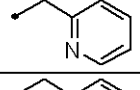
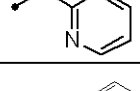
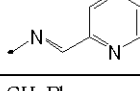
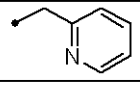
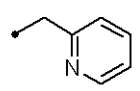
30

40

【 0 1 3 3 】

【表 6】

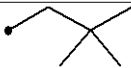
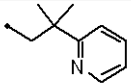
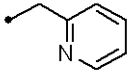
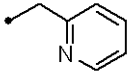
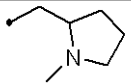
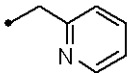
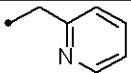
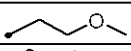
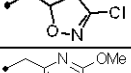
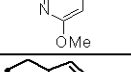
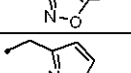
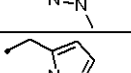
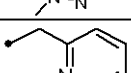
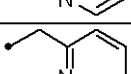
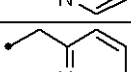
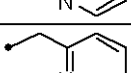
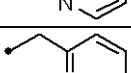
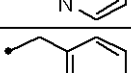
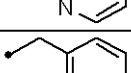
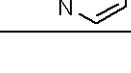
第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
116		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
117	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	n=0	110.6°C
118	H	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	112.7°C
119	H	H	H	CF ₃	H	H	H	n=0	nD _{31.2} =1.5245
120	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	H	n=0	113.2°C
121	H	F	F	CF ₃	F	H	H	n=0	87.7°C
122	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	160.7
123	H	OE _t	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	112.3°C
124	H	SMe	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	nD _{30.2} =1.5426
125	H	SMe	SMe	CF ₃	Cl	H	H	n=0	116.5°C
126	H	SO ₂ Me	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	175.1°C
127	H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	5-CF ₃	141.4°C
128	H	Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	78.6°C
129	H	Cl	H	CF ₃	COOMe	H	H	n=0	99.5°C
130	H	Cl	COOMe	CF ₃	H	H	H	n=0	101.6°C
131	H	H	H	CF ₃	COOMe	H	H	n=0	nD _{29.0} =1.5229
132	H	H	COOMe	CF ₃	H	H	H	n=0	90.1°C
133		CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	n=0	57-58°C
134		CF ₃	SMe	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
135		CF ₃	SOMe	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
136		H	CF ₃	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
137	CH ₂ Ph	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
138	COSEt	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	amorphous
139		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-CH ₂ OCH ₂ OCH ₃	oil
140		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-CH ₂ OH	oil

【 0 1 3 4 】

【表 7】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
141		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
142		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
143		Cl	Cl	CF ₃	H	CN	H	n=0	
144		Cl	Cl	CF ₃	H	Me	Me	n=0	
145		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
146		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	3-OMe	oil
147		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	3-Me	oil
148		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
149		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
150		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	
151		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
152		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
153		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	
154		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	6-Me	oil
155		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-Me	oil
156		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	4-OMe	
157		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	4-OMe	oil
158		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	4-NMe ₂	
159		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	4-NMe ₂	
160		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	4-Me	

10

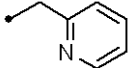
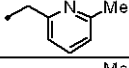
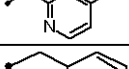
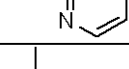
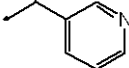
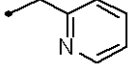
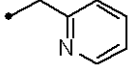
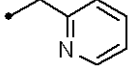
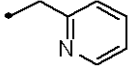
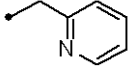
20

30

40

【表 8】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
161		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	4-Me	oil
162		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	6-Me	oil
163		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	4-Me	
164		CF ₃	Cl	CF ₃	H	Me	H	n=0	oil
165		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
166	Et	CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
167		Cl	CF ₂ H	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
168		CF ₂ H	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
169		COMe	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	
170		CF ₂ Me	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
171		CF ₃	Me	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
172	CH ₂ CH ₂ NHCOOBu (t)	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	127-131°C
173	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil

10

20

【 0 1 3 6 】

30

【表 9】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
174	H	Cl	Cl	CF ₃	Me	H	H	n=0	125-127°C
175	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	n=0	60-61°C
176	H	Cl	Cl	CF ₃	NH ₂	H	H	n=0	119-121°C
177	H	H	CN	CF ₃	Me	H	H	n=0	100-101°C
178	H	Cl	CN	CF ₃	Me	H	H	n=0	139-141°C
179	H	Cl	Me	CF ₃	CN	H	H	n=0	93-95°C
180	H	CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	145-146°C
181	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	n=0	90-95°C
182	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Me	H	H	n=0	106-107°C
183	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Me	Me	H	n=0	76-78°C
184	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Et	H	H	n=0	91-92°C
185	H	CF ₃	Cl	CF ₃	SMe	H	H	n=0	98-99°C
186	H	CF ₃	Cl	CF ₃	OMe	H	H	n=0	84-86°C
187	H	Cl	H	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	n=0	59°C
188	H	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
189	H	Cl	H	CF ₃	CH ₂ C(Me)=CH ₂	H	H	n=0	68-70°C
190	H	Cl	CH ₂ C(Me)=CH ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil

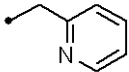
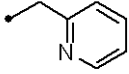
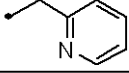
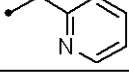
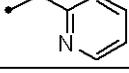
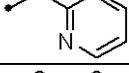
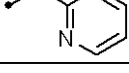
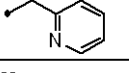
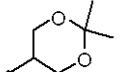
10

20

【 0 1 3 7 】

【表 10】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
191	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Br	H	H	n=0	88-89°C
192		Br	CHF ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
193		Cl	COCF ₃	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
194		Cl	CH(NH ₂)CF ₃	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
195		Cl	COOMe	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
196		Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
197		Cl	CH ₂ C(Me)=CH ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
198		Cl	CH=N-OMe	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
199	CH ₂ CF ₃	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	74-78°C
200	CH(Me)CH ₂ OMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
201	CH ₂ CH(Me)OCH ₂ OMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
202	CH ₂ CH ₂ OH	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	95-97°C
203	CH ₂ CH(Me)OH	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	104°C
204	CH ₂ SMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
205	CH ₂ CH ₂ SEt	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
206	CH ₂ CH ₂ SOEt	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
207	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	117°C
208		CF ₃	Cl	CF ₃	Me	H	H	n=0	oil
209	H	Cl	Cl	CF ₃	Br	H	H	n=0	102-103°C
210	CH ₂ CH(OMe) ₂	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
211		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
212	CH(CH ₂ OH) ₂	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	133-135°C
213	CH(CH ₂ OCH ₂ OMe) ₂	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
214	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
215	CH ₂ CH ₂ CH(OMe) ₂	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	47°C

10

20

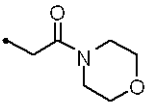
30

40

【0138】

【表 1 1】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
216	CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	131-134°C
217	CH ₂ CH(SEt)OMe	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
218	CH ₂ CH(SEt) ₂	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
219	CH ₂ CH(SEt) ₂	CF ₃	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
220	CH ₂ CH(SOEt) ₂	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
221	CH ₂ CH=CCl ₂	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	amorphous
222	CH ₂ COOEt	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	69°C
223	CH ₂ COOEt	CF ₃	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	67-69°C
224	CH ₂ COOEt	C1	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	97°C
225	CH(Me)COOMe	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
226	CH(COOMe)CHMe ₂	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
227	-C(COOMe)=CH ₂	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
228	CH ₂ COOCH ₂ CH ₂ OMe	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
229	CH ₂ COOCH ₂ CH ₂ OH	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
230	CH ₂ COOBu(t)	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	57-60°C
231	CH ₂ COOH	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	164°C
232	CH ₂ CONH ₂	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	165-166°C
233	CH ₂ CONHCH ₂ CH ₂ OMe	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
234	CH ₂ CONEt ₂	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	79-81°C
235		C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
236	CH ₂ CHO	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
237	CH ₂ COMe	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	80-81°C
238	CH ₂ CN	C1	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	85-86°C
239	CH ₂ CH ₂ COOH	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	104°C
240	CH ₂ CH ₂ COOMe	C1	C1	CF ₃	H	H	H	n=0	oil

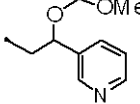
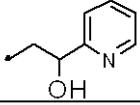
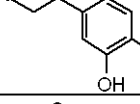
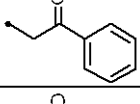
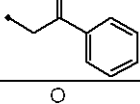
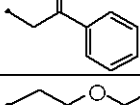
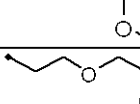
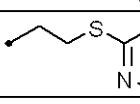
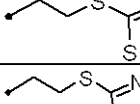
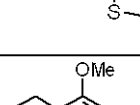
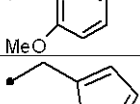
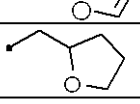
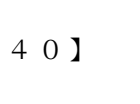
10

20

30

【表 1 2】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
241	CN	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	166-167°C
242		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
243		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	139°C
244		Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	130-133°C
245		Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	112-116°C
246		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	125°C
247		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	131°C
248		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
249		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
250		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	91-93
251		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	97°C
252		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	102°C
253		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	113-116°C
254		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
255		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil

【 0 1 4 0 】

10

20

30

40

【表 1 3】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
256		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
257		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
258		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
259		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	108°C
260		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
261		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
262		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
263		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
264		Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
265		Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
266		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	127-128°C
267		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
268		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
269		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	amorphous
270		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil

10

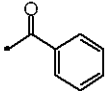
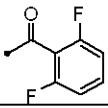
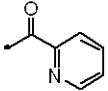
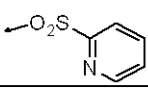
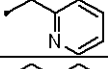
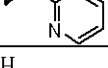
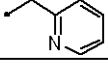
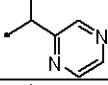
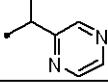
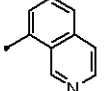
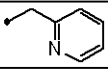
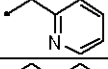
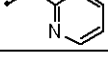
20

30

40

【表 1 4】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
271	COCHCl ₂	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
272		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
273		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
274		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	48-49°C
275	SO ₂ Et	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	71-75°C
276	SO ₂ Ph	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	106-108°C
277		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	124-126°C
278	H	CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	n=0	158-159°C
279		Cl	Cl	CF ₃	H	Me	H	n=0	oil
280		Cl	CN	CF ₃	H	Me	H	n=0	oil
281	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	Me	H	n=0	63-64°C
282	H	CF ₃	Cl	CF ₃	H	Me	H	n=0	125-127°C
283	Me	CF ₃	Cl	CF ₃	H	Me	H	n=0	oil
284	H	Cl	CN	CF ₃	H	Me	Me	n=0	98-102°C
285		Cl	CN	CF ₃	H	Me	Me	n=0	99-101°C
286	H	CF ₃	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	122-123°C
287		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
288		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
289		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	amorphous
290		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	5-Me	88-89°C
291		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	5-F	oil
292		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	5-F	amorphous

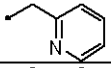
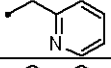
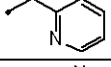
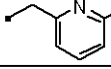
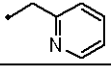
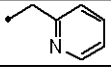
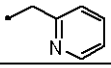
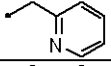
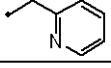
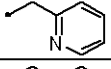
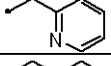
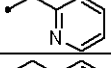
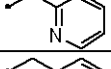
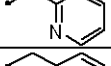
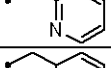
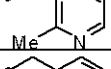
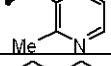
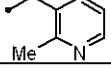
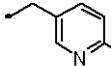
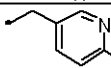
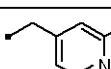
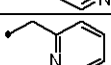
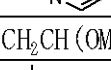
10

20

30

40

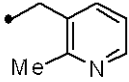
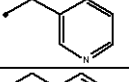
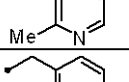
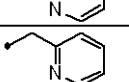
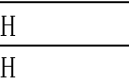
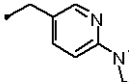
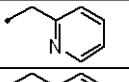
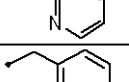
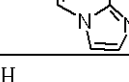
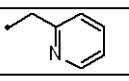
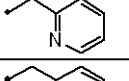
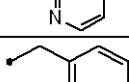
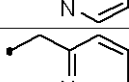
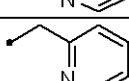
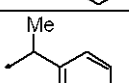
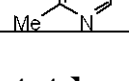
第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
293		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	6-Me	oil
294		OMe	Cl	CF ₃	H	H	H	6-OMe	oil
295		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-OMe	oil
296		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-OMe	oil
297		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-Br	oil
298		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-F	oil
299		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	6-F	oil
300		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-(2-pyridyl)	97-99°C
301		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-Ph	oil
302		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-(2-pyridyloxy)	oil
303		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-NH ₂	82-85°C
304		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-COOMe	oil
305		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-COOH	oil
306		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-CN	oil
307		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	3,5-Me,4-OMe	73-75°C
308		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
309		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	126°C
310		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
311		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
312		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
313		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
314		CF ₃	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	70-71°C
315	CH ₂ CH(OMe) ₂	CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	n=0	
316		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	89-90°C

【 0 1 4 3 】

【表 16】

第1表 (続き)

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	物性
317		CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	n=0	104-105°C
318		CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
319		CF ₃	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	84-85°C
320		CF ₃	CN	CF ₃	H	Me	H	n=0	oil
321		NMe ₂	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
322	H	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	6-piperidino	90-92°C
323	H	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	6-morpholinyl	150-152°C
324		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	oil
325		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	6-piperidino	91°C
326		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	6-morpholinyl	94°C
327		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	123-124°C
328	H	Cl	CN	CF ₃	H	Me	H	6-Me	118-119°C
329		Cl	CN	CF ₃	H	Me	H	6-Me	oil
330	化合物No. 24の塩酸塩								144-146°C
331	化合物No. 103の塩酸塩								132-134°C
332	化合物No. 314の塩酸塩								142-145°C
333	COOMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	
334	COOEt	CF ₃	Br	CF ₃	H	Me	H	n=0	
335		Cl	CN	CF ₃	H	-(CH ₂) ₃ -		n=0	
336		Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	
337		CN	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	
338		CF ₃	CN	CF ₃	H	Et	H	n=0	
339		CF ₃	CHF ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	
340		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	

【0144】

【表 17】

第2表

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
4	4.83(4H, s), 7.18(2H, dd, J = 5.2, 6.8Hz), 7.47(2H, d, J = 8.0Hz), 7.66(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.54(2H, d, J = 5.2Hz)
7	5.01(4H, s), 6.73(1H, s), 6.79(1H, s), 6.78(1H, d, J = 5.6Hz), 7.18(2H, dd, J = 8.0, 5.2Hz), 7.22(2H, d, J = 8.0Hz), 7.62(2H, ddd, J = 8.0, 7.2, 2.0Hz), 8.30(1H, d, J = 5.6Hz), 8.57(2H, d, J = 5.2Hz)
9	(Solvent : DMSO-d ₆) 5.12(4H, brs), 7.24(1H, s), 7.29(4H, brs), 7.75(2H, brs), 8.51(2H, brs), 8.95(1H, s)
15	4.74(2H, d, J = 5.2Hz), 6.06(1H, s), 6.82(1H, s), 7.19-7.24(1H, m), 7.30-7.45(6H, m), 7.69(1H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 8.11(1H, s), 8.60(1H, d, J = 5.2Hz)
17	5.06(4H, s), 6.96(1H, s), 7.17-7.24(4H, m), 7.64(2H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 8.56(1H, s), 8.57-8.58(2H, m)
18	4.98(4H, s), 6.83(1H, s), 7.18-7.20(2H, m), 7.21(2H, d, J = 8.0Hz), 7.63(2H, td, J = 7.7, 1.5Hz), 8.23(1H, s), 8.57(2H, d, J = 4.8Hz)
23	4.66(2H, s), 4.70(2H, s), 7.18(1H, dd, J = 8.0, 5.2Hz), 7.24-7.31(5H, m), 7.40(1H, d, J = 7.6Hz), 7.67(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.55(1H, d, J = 8.0Hz)
27	2.58(3H, s), 4.69(2H, d, J = 4.8Hz), 6.61(1H, brs), 6.67(1H, s), 7.23-7.26(1H, m), 7.32(1H, d, J = 8.0Hz), 7.70(1H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.56(1H, d, J = 4.8Hz)
29	2.56(3H, s), 4.99(4H, s), 6.71(1H, s), 7.20-7.24(4H, m), 7.65(2H, td, J = 7.7, 1.7Hz), 8.56(2H, d, J = 4.4Hz)
32	2.58(3H, s), 4.71(4H, s), 7.05(1H, s), 7.17(2H, dd, J = 7.2, 4.8Hz), 7.26(2H, d, J = 5.2Hz), 7.63(2H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.53(2H, d, J = 5.2Hz)
35	5.02(4H, brs), 6.83(1H, s), 7.22-7.34(4H, m), 7.68(2H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.57(2H, d, J = 4.4Hz)
36	4.84(4H, s), 6.95(1H, s), 7.20(2H, ddd, J = 7.2, 4.8, 0.9Hz), 7.30(2H, d, J = 7.6Hz), 7.67(2H, td, J = 7.7, 1.6Hz), 8.53(2H, dt, J = 4.8, 1.0Hz)
38	4.90(4H, s), 7.08(1H, s), 7.17(2H, dd, J = 7.2, 5.2Hz), 7.47(2H, d, J = 7.2Hz), 7.66(2H, td, J = 7.7, 1.7Hz), 8.54(2H, d, J = 4.8Hz)

10

20

30

【 0 1 4 5 】

【表 18】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
39	5.02(4H, s), 7.21(2H, ddd, J = 7.4, 5.0, 1.0Hz), 7.41(2H, d, J = 8.0Hz), 7.69(2H, td, J = 7.5, 1.7Hz), 8.55(2H, dt, J = 5.2, 1.0Hz)
42	4.99(4H, s), 6.60(1H, s), 6.78(1H, s), 7.20(2H, dd, J = 7.2, 4.8Hz), 7.26-7.28(2H, m), 7.64(2H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.56(2H, dd, J = 5.0, 1.0Hz)
43	4.96(4H, s), 6.75(1H, s), 7.20(2H, dd, J = 7.2, 4.8Hz), 7.26(2H, d, J = 7.6Hz), 7.65(2H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.56(2H, dt, J = 4.8, 1.0Hz)
46	5.01(4H, s), 7.02(1H, s), 7.12(1H, s), 7.21(2H, dd, J = 7.8, 5.0Hz), 7.26(2H, d, J = 8.0Hz), 7.65(2H, td, J = 7.6, 1.9Hz), 8.56(2H, dt, J = 4.8, 1.0Hz)
48	4.98(4H, s), 7.17(1H, s), 7.20-7.25(4H, m), 7.66(2H, td, J = 7.8, 1.7Hz), 8.56(2H, d, J = 4.8Hz)
49	2.89(3H, s), 3.12(3H, s), 4.92-5.06(4H, m), 6.73(1H, s), 7.19-7.25(4H, m), 7.65(2H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.56(2H, dt, J = 5.2, 1.1Hz)
50	1.57(2H, brs), 2.96(2H, t, J = 6.4Hz), 3.69(2H, t, J = 6.4Hz), 4.79(2H, s), 6.70(1H, s), 8.16(1H, brt, J = 5.0Hz), 8.20(1H, d, J = 8.0Hz), 8.61(1H, td, J = 7.6, 1.5Hz), 8.51(1H, d, J = 4.4Hz)
52	0.67(3H, d, J = 6.4Hz), 1.18(3H, d, J = 6.4Hz), 1.26(1H, t, J = 7.2Hz), 2.53(1H, d, J = 8.8Hz), 4.98(4H, d, J = 3.6Hz), 6.73(1H, s), 7.20(2H, dd, J = 7.2, 4.8Hz), 7.25-7.26(2H, m), 7.64(2H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 8.56(2H, d, J = 4.8Hz)
53	4.80(2H, s), 4.94(2H, s), 6.72(1H, s), 7.18(1H, d, J = 8.0Hz), 7.22(2H, dd, J = 7.4, 5.0Hz), 7.26-7.29(1H, m), 7.63-7.68(2H, m), 8.54-8.58(3H, m)
54	4.83(2H, s), 4.93(2H, s), 6.69(1H, s), 7.17(2H, d, J = 6.0Hz), 7.21-7.24(2H, m), 7.66(1H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.56(1H, d, J = 5.2Hz), 8.56(1H, d, J = 6.4Hz)
55	4.22(2H, d, J = 4.8Hz), 4.84(2H, s), 5.20(1H, dd, J = 28.6, 1.4Hz), 5.21(1H, s), 5.79-5.86(1H, m), 6.69(1H, s), 7.19-7.26(2H, m), 7.65(1H, t, J = 6.8Hz), 8.56(1H, d, J = 4.0Hz)
57	5.01(2H, s), 5.15(2H, s), 6.93(1H, s), 7.17-7.20(1H, m), 7.22-7.29(1H, m), 7.39(1H, d, J = 8.0Hz), 7.51(1H, dd, J = 7.6, 6.4Hz), 7.60-7.70(2H, m), 7.79(1H, d, J = 7.6Hz), 8.02(1H, d, J = 8.8Hz), 8.10(1H, d, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.4Hz)

10

20

30

40

【 0 1 4 6 】

【表 19】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
58	4.97(4H, s), 6.35(1H, d, J = 2.0Hz), 6.57(1H, s), 7.19(2H, dd, J = 8.0, 4.8Hz), 7.24(2H, d, J = 7.6Hz), 7.64(2H, td, J = 7.7, 1.7Hz), 8.56(2H, dd, J = 4.8, 0.8Hz)
59	4.96(2H, s), 5.04(2H, s), 7.14-7.25(2H, m), 7.61(1H, d, J = 7.6Hz), 7.69(1H, td, J = 7.2, 1.2Hz), 8.56(1H, dd, J = 4.8, 1.0Hz), 8.67(2H, d, J = 4.8Hz)
62	2.67(6H, s), 2.53(2H, t, J = 6.8Hz), 3.75(2H, t, J = 6.8Hz), 4.83(2H, s), 6.70(1H, s), 7.19-7.23(2H, m), 7.64(1H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 8.57(1H, d, J = 4.8Hz)
63	4.96(4H, s), 6.72(1H, s), 7.20(2H, dd, J = 7.8, 5.0Hz), 7.24(2H, d, J = 7.6Hz), 7.64(2H, td, J = 7.8, 2.0Hz), 8.56(2H, d, J = 4.8Hz)
64	2.51(4H, brs), 2.59(2H, t, J = 6.4Hz), 3.67(4H, brs), 3.79(2H, t, J = 6.4Hz), 4.82(2H, s), 6.70(1H, s), 7.19-7.24(2H, m), 7.64(1H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 8.57(1H, d, J = 4.8Hz)
65	1.58(9H, s), 4.79(2H, s), 6.49(1H, s), 6.77(1H, s), 7.19(1H, dd, J = 7.6, 5.2Hz), 7.24(1H, d, J = 7.6Hz), 7.66(1H, td, J = 7.6, 2.0Hz), 8.59(1H, dd, J = 4.8, 1.2Hz)
67	1.78(3H, d, J = 6.8Hz), 4.62(2H, s), 5.29(1H, q, J = 6.8Hz), 7.10(1H, dd, J = 6.8, 4.8Hz), 7.21(1H, dd, J = 8.4, 2.8Hz), 7.28(1H, d, J = 2.8Hz), 7.51-7.56(2H, m), 7.65(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.47(1H, dd, J = 4.0, 1.2Hz), 8.55(1H, dd, J = 4.0, 2.0Hz)
70	1.68(3H, d, J = 6.8Hz), 4.11(1H, d, J = 6.8Hz), 4.14(1H, d, J = 6.8Hz), 6.12-6.13(1H, m), 6.61(1H, s), 7.02(1H, d, J = 8.0Hz), 7.12-7.17(2H, m), 7.34(1H, d, J = 7.6Hz), 7.53-7.57(1H, m), 7.59-7.63(1H, m), 8.51-8.55(2H, m)
71	5.03(2H, s), 5.04(2H, s), 6.84(1H, s), 7.18-7.22(2H, m), 7.36(1H, d, J = 4.8Hz), 7.66(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.56(1H, dd, J = 4.8, 1.0Hz), 8.69(2H, d, J = 4.8Hz)
76	0.87(3H, d, J = 6.8Hz), 0.99(3H, d, J = 6.8Hz), 2.85-2.91(1H, m), 4.72(1H, d, J = 17.6Hz), 5.25(1H, d, J = 17.6Hz), 5.75-5.85(1H, m), 6.16(1H, d, J = 7.6Hz), 6.61(1H, s), 7.00(1H, dd, J = 6.8, 5.6Hz), 7.09-7.12(1H, m), 7.22-7.28(1H, m), 7.46(1H, d, J = 7.6Hz), 7.60-7.64(1H, m), 8.40(1H, dd, J = 4.8, 0.8Hz), 8.44(1H, dd, J = 2.0, 1.2Hz)

10

20

30

【表 20】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
79	0.91(3H, t, J = 7.2Hz), 2.04-2.11(1H, m), 2.25-2.34(1H, m), 4.82(1H, d, J = 17.6Hz), 4.92(1H, d, J = 17.6Hz), 5.89-5.95(1H, m), 6.65(1H, s), 6.80(1H, d, J = 7.6Hz), 7.08-7.16(2H, m), 7.41(1H, d, J = 8.0Hz), 7.44-7.48(1H, m), 7.61(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.50(2H, ddd, J = 2.8, 2.0, 0.8Hz)
80	2.25(1H, t, J = 2.6Hz), 4.43(2H, d, J = 2.4Hz), 4.91(2H, s), 6.84(1H, s), 7.21(1H, dd, J = 6.8, 5.2Hz), 7.29(1H, d, J = 8.0Hz), 7.66(1H, td, J = 7.8, 2.0Hz), 8.56-8.58(1H, m)
81	2.85(6H, s), 4.95(4H, s), 6.36(1H, s), 7.16-7.19(2H, m), 7.21(2H, d, J = 8.0Hz), 7.62(2H, td, J = 7.7, 1.6Hz), 8.55-8.57(2H, m)
82	3.71(3H, s), 5.09(2H, s), 7.21(2H, dd, J = 7.6, 5.4Hz), 7.24(1H, s), 7.28-7.32(1H, m), 7.65(1H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 8.58(1H, d, J = 3.6Hz)
83	5.05(4H, brs), 6.95(1H, s), 7.20-7.23(4H, m), 7.65(2H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 8.54(1H, s), 8.57(2H, d, J = 4.4Hz)
86	0.46-0.52(3H, m), 0.71-0.75(1H, m), 1.59-1.64(1H, m), 4.84(1H, d, J = 17.2Hz), 5.10-5.14(1H, m), 5.12(1H, d, J = 17.2Hz), 6.61(1H, s), 7.13-7.20(3H, s), 7.45(1H, d, J = 8.0Hz), 7.56(1H, dd, J = 8.0, 1.6Hz), 7.64(1H, td, J = 7.6, 2.0Hz), 8.54(2H, dd, J = 4.8, 1.4Hz)
90	4.98(4H, s), 6.64(1H, s), 6.92(1H, s), 7.17-7.20(2H, m), 7.25-7.27(2H, m), 7.63(2H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.55-8.57(2H, m)
91	5.32(2H, brs), 7.20-7.23(2H, m), 7.34(1H, brs), 7.60(1H, d, J = 4.8Hz), 7.67(1H, t, J = 7.4Hz), 8.54(1H, d, J = 4.4Hz), 8.80(2H, d, J = 5.2Hz)
94	4.98(4H, s), 6.87(1H, s), 7.17-7.20(2H, m), 7.23-7.25(2H, m), 7.63(2H, td, J = 7.6, 2.0Hz), 8.56(2H, dd, J = 4.8, 1.0Hz)
95	5.04(4H, s), 6.71(1H, s), 7.19-7.23(4H, m), 7.65(2H, td, J = 7.8, 1.6Hz), 8.56(2H, d, J = 4.0Hz)
96	4.96(2H, s), 5.03(2H, s), 6.85(1H, s), 7.19-7.22(1H, m), 7.24-7.29(1H, m), 7.63-7.69(1H, m), 8.49-8.57(3H, m), 8.62(1H, s)
97	1.66(3H, d, J = 6.8Hz), 4.58(2H, s), 6.25(1H, q, J = 6.8Hz), 6.60(1H, s), 6.99(1H, d, J = 8.4Hz), 7.14-7.17(1H, m), 7.23(1H, dd, J = 8.0, 4.8Hz), 7.27-7.59(1H, m), 7.65(1H, d, J = 8.0Hz), 8.52(2H, dd, J = 4.8, 1.2Hz), 8.63(1H, brs)
102	2.51(3H, s), 4.98(4H, s), 6.66(1H, s), 7.16-7.23(4H, m), 7.59-7.64(2H, m), 8.56(2H, dd, J = 4.8, 1.2Hz)

10

20

30

40

【 0 1 4 8 】

【表 2 1】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
104	4.92(4H, s), 7.16-7.19(2H, m), 7.29(2H, d, J = 8.0Hz), 7.63-7.67(2H, m), 8.53-8.57(2H, m)
107	4.77(2H, s), 4.91(2H, s), 6.73(1H, s), 7.17(1H, d, J = 7.6Hz), 7.21-7.26(1H, m), 7.28(1H, d, J = 7.6Hz), 7.60-7.68(2H, m), 8.32(1H, d, J = 2.0 Hz), 8.56(1H, ddd, J = 4.8, 2.0, 1.2Hz)
108	4.85(2H, s), 5.27(2H, s), 6.72(1H, s), 7.19-7.23(1H, m), 7.26-7.28(1H, m), 7.34(1H, d, J = 8.0Hz), 7.43-7.49(1H, m), 7.56-7.60(1H, m), 7.64-7.68(1H, m), 8.13(1H, dd, J = 8.0, 0.8Hz), 8.54(1H, dd, J = 8.0, 0.8Hz)
110	5.04(4H, s), 6.93(1H, s), 7.09(1H, s), 7.18-7.21(2H, m), 7.30(2H, d, J = 7.6Hz), 7.63(2H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.56(2H, dt, J = 4.0, 1.0Hz)
111	1.68(3H, d, J = 6.8Hz), 4.73(1H, d, J = 17.2Hz), 4.79(1H, d, J = 17.2Hz), 5.81-5.83(1H, m), 6.62(1H, s), 7.16-7.21(2H, m), 7.30(1H, d, J = 8.0 Hz), 7.42(1H, dd, J = 8.0, 2.4Hz), 7.61-7.65(1H, m), 8.15(1H, d, J = 2.4 Hz), 8.54(1H, d, J = 4.8Hz)
114	3.81(3H, s), 5.01(4H, s), 6.41(1H, s), 7.20-7.23(4H, m), 7.66(2H, td, J = 7.7, 1.5Hz), 8.57-8.58(2H, m)
115	5.01(4H, brs), 6.82(1H, s), 7.22-7.25(4H, m), 7.67(2H, td, J = 7.7, 1.9 Hz), 8.57(2H, d, J = 3.6Hz)
116	4.84(2H, s), 4.99(2H, s), 6.98(1H, s), 7.19-7.28(3H, m), 7.65(2H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.54-8.57(3H, m)
134	2.29(3H, s), 5.04(4H, s), 7.06(1H, s), 7.18-7.22(2H, m), 7.30(2H, d, J = 7.2Hz), 7.61-7.67(2H, m), 8.56(2H, d, J = 4.0Hz)
135	2.97(3H, s), 5.07(4H, brs), 7.18(1H, s), 7.21-7.24(2H, m), 7.30-7.52(2H, m), 7.66(2H, td, J = 7.7, 1.7Hz), 8.56(2H, d, J = 4.4Hz)
136	5.55(2H, s), 7.17-7.21(2H, m), 7.29(1H, d, J = 6.0Hz), 7.62-7.72(2H, m), 7.73(1H, s), 7.98(1H, d, J = 8.0Hz), 8.50(1H, dd, J = 2.4, 1.2Hz), 8.60(1H, dd, J = 2.0, 1.2Hz)
137	4.85(2H, s), 4.89(2H, s), 6.70(1H, s), 7.18-7.37(7H, m), 7.63(1H, td, J = 7.6, 2.0Hz), 8.56(1H, d, J = 2.0Hz)
138	1.31(3H, t, J = 7.6Hz), 2.97(2H, q, J = 7.6Hz), 5.41(2H, s), 7.16-7.21(2H, m), 7.64(1H, td, J = 7.6, 2.0Hz), 8.37(1H, s), 8.54(1H, d, J = 4.8Hz)
139	3.42(3H, s), 4.67(2H, s), 4.76(2H, s), 4.93(2H, s), 4.97(2H, s), 6.84(1H, s), 7.14(1H, d, J = 8.0Hz), 7.20(1H, dd, J = 8.0, 4.8Hz), 7.25(1H, d, J = 7.2Hz), 7.34(1H, d, J = 8.0Hz), 7.61-7.67(2H, m), 8.56(1H, dd, J = 4.8, 0.8Hz)

10

20

30

40

【表 2 2】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δppm (Solvent : CDCl ₃ /400MHz)
140	3.66(1H, t, J = 4.8Hz), 4.73(2H, s), 4.96(4H, s), 6.80(1H, s), 7.13-7.25(4H, m), 7.62-7.67(2H, m), 8.56(1H, d, J = 4.0Hz)
141	1.03(9H, s), 3.59(2H, s), 4.87(2H, s), 6.71(1H, s), 7.09(1H, d, J = 7.6 Hz), 7.17(1H, dd, J = 8.8, 6.0Hz), 7.60(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.55(1H, dd, J = 2.0, 0.8Hz)
142	1.49(6H, s), 4.10(2H, s), 4.11(2H, s), 6.44(1H, s), 6.95(1H, d, J = 8.0 Hz), 7.07-7.13(2H, m), 7.28(1H, d, J = 8.0Hz), 7.51-7.57(2H, m), 8.48(1H, dd, J = 4.0, 0.8Hz), 8.57(1H, dd, J = 3.2, 0.8Hz)
145	1.62-1.64(1H, m), 1.71-1.80(1H, m), 1.93-1.98(1H, m), 2.20-2.26(1H, m), 2.42(3H, s), 2.60-2.62(1H, m), 3.06-3.10(1H, m), 3.49(dd, 1H, J = 7.2, 14.8Hz), 3.85-3.86(1H, m), 4.85(1H, d, J = 17.2Hz), 4.95(1H, d, J = 17.2 Hz), 6.78(1H, s), 7.14-7.20(2H, m), 7.62(dt, 1H, J = 5.2, 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 1.2, 4.8Hz)
146	3.81(3H, s), 4.89(2H, s), 5.08(2H, s), 7.01(1H, s), 7.11-7.19(3H, m), 7.25(1H, d, J = 8.4Hz), 7.62(1H, dt, J = 1.6, 0.8Hz), 8.09(1H, dd, J = 4.4, 1.6Hz), 8.53(1H, d, J = 4.8Hz)
147	2.36(3H, s), 4.96(4H, d, J = 5.6Hz), 6.79(1H, s), 7.10(1H, dd, J = 8.0, 4.8Hz), 7.17(1H, m), 7.23(1H, d, J = 8.0Hz), 7.45(1H, d, J = 8.0Hz), 7.61(1H, dt, J = 8.0, 2.0Hz), 8.35(1H, d, 3.6Hz), 8.54(1H, dd, J = 4.8, 0.8Hz)
148	3.28(3H, s), 3.60(2H, t, J = 5.2Hz), 3.83(2H, t, J = 5.2Hz), 4.89(2H, s), 6.78(1H, s), 7.21-7.27(2H, m), 7.67(1H, t, J = 2.0Hz), 8.55 (1H, d, J = 0.8Hz)
149	3.00(1H, dd, J=17.6, 8.0Hz), 3.29(1H, dd, 17.6, 10.8Hz), 3.84-3.89(1H, m), 4.07-4.13(1H, m), 4.87(2H, s), 5.09-5.16(1H, m), 6.75(1H, s), 7.21-7.27(2H, m), 7.69(1H, dt, J=8.0, 1.2Hz), 8.54(1H, d, 4.8Hz)
151	2.37(3H, s), 4.80(2H, s), 4.86(2H, s), 5.94(1H, s), 6.82(1H, s), 7.19-7.24(2H, m), 7.65(1H, dt, J=7.6, 1.6Hz), 7.55(1H, d, J=4Hz)
152	3.88(3H, s), 4.72(2H, s), 5.08(2H, s), 6.67(1H, s), 6.79(1H, s), 6.96(1H, d, J=7.6Hz), 7.16(1H, dd, J=5.2, 2Hz), 7.32(1H, s), 7.58(1H, dd, J=5.6, 8.0), 8.51(1H, d, J=5.2Hz)
154	2.52(3H, s), 4.94(2H, s), 5.02(2H, s), 7.04(1H, d, J = 8.0Hz), 7.05(1H, d, J = 8.0Hz), 7.14(1H, s), 7.20(1H, dd, J = 7.2, 4.8Hz), 7.29(1H, d, J = 7.6Hz), 7.51(1H, t, J = 7.6Hz), 7.64(1H, td, J = 7.6, 1.2Hz), 8.56(1H, d, J = 4.8Hz)

10

20

30

40

【 0 1 5 0 】

【表 2 3】

第2表 (続き)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3 / 400MHz)
155	2.52(3H, s), 4.89(2H, s), 4.98(2H, s), 6.85(1H, s), 7.01(1H, d, J = 7.2 Hz), 7.05(1H, d, J = 7.6Hz), 7.20(1H, t, J = 6.4Hz), 7.25(1H, d, J = 6.4Hz), 7.51(1H, t, J = 7.6Hz), 7.64(1H, t, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.8Hz)
157	3.82(3H, s), 4.90(2H, s), 4.96(2H, s), 6.72(1H, dd, J = 5.2, 2.4Hz), 6.79(1H, s), 6.82(1H, d, J = 2.0Hz), 7.20(1H, dd, J = 7.6, 5.2Hz), 7.64(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 7.64(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.37(1H, d, J = 5.6Hz), 8.56(1H, d, J = 5.2Hz)
161	2.31(3H, s), 4.91(2H, s), 4.96(2H, s), 6.80(1H, s), 7.01(1H, d, J = 5.2 Hz), 7.05(1H, s), 7.20(1H, ddd, J = 5.2, 4.8, 0.8Hz), 7.25(1H, d, J = 8.0Hz), 7.64(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.40(1H, d, J = 5.2Hz), 8.56(1H, d dd, J = 4.8, 1.6, 0.8Hz)
162	2.52(6H, s), 4.91(4H, s), 6.87(1H, s), 7.02(2H, d, J = 8.0Hz), 7.04(2H, d, J = 8.0Hz), 7.51(2H, t, J = 8.0Hz)
164	1.69(3H, d, J = 7.6Hz), 4.79(1H, d, J = 17.6Hz), 4.99(1H, d, J = 17.2Hz), 6.14(1H, brs), 6.89(1H, s), 7.05(1H, d, J = 7.6Hz), 7.14-7.17(2H, m), 7.35(1H, d, J = 8.0Hz), 7.54-7.63(2H, m), 8.54(2H, t, J = 2.4Hz)
165	1.68(3H, d, J = 7.2Hz), 4.65(2H, s), 6.26(1H, q, J = 6.8Hz), 6.88(1H, s), 6.99(1H, d, J = 7.6Hz), 7.17(1H, dd, J = 7.4, 5.0Hz), 7.21-7.24(1H, m), 7.58(1H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 7.66(1H, d, J = 7.4Hz), 8.50(1H, dd, J = 4.6, 1.8Hz), 8.52-8.54(1H, m), 8.68(1H, d, J = 2.4Hz)
166	1.24(3H, t, J = 7.2Hz), 3.71(2H, q, J = 7.2Hz), 4.84(2H, s), 6.92(2H, s), 7.20(1H, dd, J = 7.0, 4.8Hz), 7.25(1H, d, J = 7.6Hz), 7.64(1H, td, J = 7.6, 1.6Hz), 8.56(1H, d, J = 4.4Hz)
167	5.00(4H, s), 6.83(1H, s), 6.98(1H, t, J = 53.4Hz), 7.19-7.26(4H, m), 7.65(2H, td, J = 7.6, 1.6Hz), 8.56(2H, d, J = 4.8Hz)
168	5.02(4H, s), 6.84(1H, t, J = 14.4Hz), 6.99(1H, s), 7.17-7.21(2H, m), 7.29(2H, d, J = 7.2Hz), 7.61-7.66(2H, m), 8.55-8.56(2H, m)
170	2.36(3H, s), 5.01(4H, s), 6.95(1H, s), 7.16-7.21(2H, m), 7.28(2H, d, J = 8.0Hz), 7.60-7.65(2H, m), 8.54-8.56(2H, m), 1.86(3H, t, J = 19.2Hz), 4.98(4H, s), 6.99(1H, s), 7.18-7.23(4H, m), 7.63(2H, td, J = 7.7, 1.6Hz), 8.57(2H, d, J = 4.8Hz)
171	2.36(3H, s), 5.01(4H, s), 6.95(1H, s), 7.16-7.21(2H, m), 7.28(2H, d, J = 8.0Hz), 7.60-7.65(2H, m), 8.54-8.56(2H, m)
173	3.30(3H, s), 3.63(2H, t, J=5.6Hz), 3.87(2H, t, J=4.8Hz), 4.89(2H, s), 7.06(1H, s), 7.17-7.27(2H, m), 7.63(1H, dt, 7.2, 2.0Hz), 8.53(1H, d, J=4.8Hz)

10

20

30

40

【表 2 4】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
188	3.48(2H, d, J = 6.4Hz), 4.66(2H, d, J = 4.8Hz), 4.99-5.08(2H, m), 5.86(1H, m), 6.11(1H, br.s), 6.69(1H, s), 7.20-7.24(1H, m), 7.32(1H, d, J = 8.0Hz), 7.68(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.0Hz)
190	1.83(3H, s), 3.39(2H, s), 4.22(1H, s), 4.67(2H, s), 4.78(1H, s), 6.13(1H, br.s), 6.71(1H, s), 7.21(1H, m), 7.32(1H, d, J = 8.0Hz), 7.69(1H, t, J = 7.6Hz), 8.57(1H, d, J = 5.2Hz)
192	5.00(4H, s), 6.85(1H, s), 6.99(1H, t, J = 13.2Hz), 7.21(2H, dd, J = 7.0, 5.8Hz), 7.26(2H, d, J = 2.4Hz), 7.65(2H, td, J = 7.7, 1.9Hz), 8.56(2H, d, J = 4.4Hz)
193	5.02(4H, s), 6.84(1H, s), 7.23(2H, dd, J = 7.2, 4.8Hz), 7.25-7.30(2H, m), 7.67(2H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 8.57(2H, d, J = 5.2Hz)
194	4.99(4H, s), 5.35(1H, brs), 6.85(1H, s), 7.21(2H, dd, J = 7.6, 4.8Hz), 7.25-7.30(2H, m), 7.66(2H, td, J = 7.6, 1.7Hz), 8.56(2H, d, J = 4.0Hz)
195	3.90(3H, s), 5.00(4H, s), 6.71(1H, s), 7.16-7.26(4H, m), 7.62-7.69(2H, m), 8.52-8.56(2H, m)
196	3.48(2H, d, J = 6.0Hz), 4.96(2H, s), 4.98(2H, s), 5.00-5.06(2H, m), 5.86(1H, m), 6.71(1H, s), 7.17-7.20(2H, m), 7.25-7.27(2H, m), 7.63(2H, m), 8.55(2H, d, J = 5.2Hz)
197	1.82(3H, s), 3.38(2H, s), 4.22(1H, s), 4.78(1H, s), 4.97(2H, s), 4.98(2H, s), 6.73(1H, s), 7.19(2H, t, J = 6.0Hz), 7.25-7.28(2H, m), 7.63(2H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.56(2H, d, J = 4.8Hz)
198	3.74(3H, s), 4.87(4H, s), 6.73(1H, s), 7.11-7.18(4H, m), 7.64(dt, 2H, J = 4.4Hz, J = 8.0Hz), 8.08(1H, s), 8.53(2H, d, J = 4.4Hz)
200	1.25(3H, s), 3.23(3H, s), 3.39-3.54(3H, m), 4.73(2H, s), 6.61(1H, s), 7.16-7.27(2H, m), 7.62(1H, dt, J = 8, 2Hz), 8.57(1H, d, J = 4.8Hz)
201	1.23(3H, s, J = 6.4Hz), 3.29(3H, s), 3.64(1H, dd, J = 7.6, 14.8Hz), 3.71-3.74(1H, m), 4.07-4.11(1H, m), 4.57(1H, d, J = 6.8Hz), 4.65(1H, d, J = 6.8Hz), 4.85(1H, d, J = 16.8Hz), 4.97(1H, d, J = 16.8Hz), 6.81(1H, s), 7.18-7.20(2H, m), 7.59(1H, dt, J = 5.2, 8.0Hz), 8.56(1H, dd, J = 2.0, 5.6Hz)
204	2.18(3H, s), 4.89(2H, s), 4.90(2H, s), 6.83(1H, s), 7.20-7.23(1H, m), 7.26-7.27(1H, m), 7.66(1H, dt, J = 4.0Hz, J = 8.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.0Hz)

10

20

30

【表 2 5】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
205	1.30(3H, t, J = 8.4Hz), 2.63(2H, q, J = 8.4Hz), 2.77(2H, t, J = 7.6Hz), 3.82-3.86(2H, m), 4.81(2H, s), 6.69(1H, s), 7.20-7.23(2H, m), 7.65(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.8Hz)
206	1.37(3H, t, J = 8.4Hz), 2.77-2.89(2H, m), 2.94-3.01(1H, m), 3.19-3.26(1H, m), 4.03-4.15(1H, m), 4.19-4.26(1H, m), 4.85(2H, s), 6.85(1H, s), 7.20-7.26(2H, m), 7.67(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 8.55(1H, d, J = 4.8Hz)
208	2.52(3H, s), 4.67(4H, s), 7.17(2H, dd, J = 6.8, 4.4Hz), 7.45(2H, d, J = 8.0Hz), 7.65(2H, td, J = 7.7, 1.7Hz), 8.55(2H, d, J = 4.4Hz)
210	3.42(6H, s), 3.77(2H, d, J = 4.8Hz), 4.57(1H, t, J = 4.8Hz), 4.86(2H, s), 6.78(1H, s), 7.18-7.21(2H, m), 7.64(1H, dt, J = 2.0Hz, J = 9.2Hz), 8.56(1H, d, J = 6.0Hz)
211	1.42(3H, s), 1.46(3H, s), 4.06-4.13(2H, m), 4.15-4.21(2H, m), 4.60-4.68(1H, m), 5.11(2H, s), 6.66(1H, s), 7.18-7.30(2H, m), 7.65(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.8Hz)
213	3.30(6H, s), 3.79-3.87(4H, m), 4.51(2H, d, J = 6.8Hz), 4.56(2H, d, J = 6.8Hz), 4.85(2H, s), 5.07(1H, bs), 6.66(1H, s), 7.16-7.19(1H, m), 7.29(1H, d, J = 8.4Hz), 7.61(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.4Hz), 8.56(1H, d, J = 4.8Hz)
214	1.84-1.87(1H, m), 3.33(1H, s), 3.40(1H, t, J=6.4Hz), 3.49(1H, t, J=6.0Hz), 6.58(1H, s), 7.18-7.30(2H, m), 7.60(1H, dt, 7.2, 2.0Hz), 8.55(1H, d, J=4.8Hz)
217	1.32(3H, t, J = 7.8Hz), 2.61-2.71(2H, m), 3.35(3H, s), 3.73-3.81(1H, m), 4.15-4.20(1H, m), 4.67-4.70(1H, m), 4.88(2H, s), 6.78(1H, s), 7.18-7.21(2H, m), 7.64(1H, dt, J = 4.0Hz, J = 8.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.0Hz)
218	1.20-1.33(6H, m), 2.68-2.79(4H, m), 4.00(2H, d, J = 7.2Hz), 4.29(1H, t, J = 6.8Hz), 4.89(2H, s), 6.71(1H, s), 7.18-7.22(2H, m), 7.64(1H, dt, J = 4.4Hz, J = 8.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.4Hz)
219	1.26(6H, t, J = 7.8Hz), 2.65-2.78(4H, m), 4.05(2H, d, J = 7.6Hz), 4.35(1H, t, J = 7.2Hz), 4.90(2H, s), 6.98(1H, s), 7.20-7.22(2H, m), 7.65(1H, dt, J = 5.2Hz, J = 8.0Hz), 8.57(1H, d, J = 5.2Hz)
220	1.41(6H, t, J = 7.8Hz), 3.18-3.21(4H, m), 4.30(2H, d, J = 6.0Hz), 4.44(1H, t, J = 6.4Hz), 4.84(2H, s), 6.85(1H, s), 7.20-7.25(2H, m), 7.68(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 8.54(1H, d, J = 4.8Hz)
221	4.27(2H, d, J = 6.0Hz), 4.80(2H, s), 6.00(1H, t, J = 6.8Hz), 6.73(1H, s), 7.23-7.27(2H, m), 7.69(1H, dt, J = 4.0Hz, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.0Hz)

10

20

30

40

【表 2 6】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
225	1.55(3H, d, J = 7.6Hz), 3.70(3H, s), 4.72(2H, d, J = 6.8Hz), 5.20(1H, dd, J = 7.2Hz, J = 14.8Hz), 6.64(1H, s), 7.19-7.23(1H, m), 7.32(1H, d, J = 7.6Hz), 7.65(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 8.59(1H, d, J = 4.8Hz)
226	0.87(3H, d, J = 6.0Hz), 1.06(3H, d, J = 6.0Hz), 2.41-2.50(1H, m), 3.61(3H, s), 4.71(1H, d, J = 17.6Hz), 4.92(1H, d, J = 17.6Hz), 5.10(1H, d, J = 10.4Hz), 6.67(1H, s), 7.15-7.19(2H, m), 7.61(1H, dt, J = 5.2Hz, J = 8.0Hz), 8.55(1H, d, J = 5.2Hz)
227	3.80(3H, s), 5.06(2H, s), 5.77(1H, s), 6.21(1H, s), 6.71(1H, s), 7.18-7.22(1H, m), 7.41(1H, d, J = 8.0Hz), 7.66(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.8Hz)
228	3.38(3H, s), 3.60-3.62(2H, m), 4.31-4.32(2H, m), 4.44(2H, s), 4.82(2H, s), 6.74(1H, s), 7.21-7.24(1H, m), 7.34(1H, d, J = 8.0Hz), 7.67(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 8.58(1H, d, J = 4.8Hz)
229	3.07(1H, bs), 3.83-3.86(2H, m), 4.29-4.32(2H, m), 4.41(2H, s), 4.83(2H, s), 6.78(1H, s), 7.23-7.28(1H, m), 7.48(1H, d, J = 8.0Hz), 7.69(1H, dt, J = 4.4Hz, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.4Hz)
233	3.24(3H, s), 3.42-3.45(2H, m), 3.47-3.51(2H, m), 4.25(2H, s), 4.86(2H, s), 6.63(1H, s), 7.21-7.25(1H, m), 7.38(1H, d), 7.74(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 7.6Hz), 8.48(1H, d, J = 4.8Hz), 9.67(1H, bs)
235	3.59-3.65(4H, m), 3.71-3.77(4H, m), 4.96(2H, s), 4.85(2H, s), 6.77(1H, s), 7.21-7.23(1H, m), 7.36(1H, d, J = 7.6Hz), 7.68(1H, dt, J = 4.0Hz, J = 8.0Hz), 8.58(1H, d, J = 4.0Hz)
236	4.50(2H, s), 4.79(2H, s), 6.76(1H, s), 7.22-7.25(1H, m), 7.31(1H, d, J = 8.0Hz), 7.71(1H, dt, J = 4.4Hz, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.4Hz), 9.71(1H, s)
240	2.73(2H, dd, J = 6.8Hz, J = 13.6Hz), 3.65(3H, s), 3.97(2H, t, J = 6.8Hz), 4.83(2H, s), 6.72(1H, s), 7.19-7.27(2H, m), 7.65(1H, dt, J = 5.2Hz, J = 8.0Hz), 8.56(1H, dd, J = 0.8Hz, J = 4.8Hz)
242	3.29(3H, s), 4.00-4.15(2H, m), 4.60(1H, d, J = 6.8Hz), 4.69(1H, d, J = 6.8Hz), 4.81(1H, d, J = 16.8Hz), 4.87(1H, d, J = 16.8Hz), 5.13(1H, dd, J = 4.8Hz, J = 6.8Hz), 6.85(1H, s), 7.16(1H, dd, J = 5.6Hz, J = 6.4Hz), 7.19-7.23(2H, m), 7.41(1H, d, J = 8.0Hz), 7.60(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 7.68(1H, dt, J = 5.2Hz, J = 8.0Hz), 8.53(1H, d, J = 4.8Hz), 8.61(1H, d, J = 5.2Hz)
248	1.48-1.71(6H, m), 3.47-3.50(1H, m), 3.65-3.69(1H, m), 3.74-3.88(3H, m), 3.95-4.00(1H, m), 4.57(1H, bs), 4.91(2H, s), 6.90(1H, s), 7.18-7.25(2H, m), 7.63(1H, dt, J = 4.4Hz, J = 8.0Hz), 8.55(1H, d, J = 4.4Hz)

10

20

30

40

【 0 1 5 4 】

【表 2 7】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
249	3.82-3.85(2H, m), 3.92-3.94(2H, m), 4.61(2H, s), 4.91(2H, s), 6.84(1H, s), 7.16-7.30(4H, m), 7.59-7.72(2H, m), 8.52-8.58(2H, m)
254	4.82(2H, s), 4.92(2H, s), 6.08(1H, d, J=3.2Hz), 6.31(1H, d, J=3.2Hz), 6.68(1H, s), 6.83(1H, s), 7.21-7.29(2H, m), 7.67(1H, dt, J=8, 2Hz), 8.59(1H, d, J=4.8Hz)
255	1.53-1.62(2H, m), 1.89-1.97(2H, m), 3.58-3.64(1H, m), 3.73-3.78(1H, m), 3.85-3.90(2H, m), 4.21-4.25(1H, m), 4.92(2H, s), 6.79(1H, s), 7.17-7.23(2H, m), 7.63(1H, dt, J = 4.0Hz, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.0Hz)
256	3.84-3.85(2H, m), 3.88-3.94(2H, m), 3.97-3.98(2H, m), 4.94(2H, s), 5.17(1H, t, J = 4.0Hz), 6.85(1H, s), 7.17-7.25(2H, m), 7.63(1H, dt, J = 4.0 Hz, J = 9.2Hz), 8.56(1H, d, J = 4.0Hz)
257	1.65-1.70(1H, m), 2.00-2.04(1H, m), 2.72-2.75(1H, m), 3.56-3.65(2H, m), 3.72-3.81(3H, m), 3.92-3.98(1H, m), 4.82(2H, s), 6.70(1H, s), 7.15-7.22(2H, m), 7.64(1H, dt, J = 4.4Hz, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.4Hz)
258	1.28-1.35(1H, m), 1.48-1.65(4H, m), 1.85-1.88(1H, m), 3.29-3.34(1H, m), 3.55-3.64(2H, m), 3.74-3.77(1H, m), 3.90-3.93(1H, m), 4.95(2H, s), 6.79(1H, s), 7.16-7.21(2H, m), 7.62(1H, dt, J = 4.0Hz, J = 8.0Hz), 8.55(1H, d, J = 4.0Hz)
260	3.05-3.07(2H, m), 3.71-3.76(2H, m), 3.88-3.98(2H, m), 4.29-4.33(1H, m), 4.91(2H, s), 6.77(1H, s), 7.19-7.25(2H, m), 7.63(1H, dt, J = 4.4Hz, J = 8.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.4Hz)
261	2.84-2.89(1H, m), 3.06-3.12(1H, m), 3.31-3.37(1H, m), 4.10-4.16(2H, m), 4.38-4.42(1H, m), 4.59-4.62(1H, m), 4.86(2H, s), 6.78(1H, s), 7.20-7.25(2H, m), 7.67(1H, dt, J = 4.0Hz, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.0Hz)
262	1.89(3H, s), 2.92-2.95(2H, m), 4.20-4.22(2H, m), 4.39(2H, s), 4.83(2H, s), 6.78(1H, s), 7.17-7.24(1H, m), 7.43-7.47(1H, m), 7.63(1H, dt, J = 4.0Hz, J = 8.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.0Hz)
263	1.99-2.05(2H, m), 2.75-2.82(2H, m), 2.95-3.01(2H, m), 4.10(2H, d, J = 7.2Hz), 4.39(1H, t, J = 7.2Hz), 4.86(2H, s), 6.72(1H, s), 7.19-7.22(2H, m), 7.65(1H, dt, J = 4.4Hz, J = 8.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.4Hz)
264	3.56(3H, s), 4.71(2H, s), 4.95(2H, s), 6.04(1H, dd, J = 2.8Hz, J = 3.2Hz), 6.09(1H, s), 6.60(1H, d, J = 2.0Hz), 6.67(1H, s), 6.75(1H, s), 6.90(1H, d, J = 7.6Hz), 7.16(1H, dd, J = 5.2Hz, J = 7.2Hz), 7.58(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 8.54(1H, d, J = 4.8Hz)

10

20

30

40

【 0 1 5 5 】

【表 2 8】

第2表 (続き)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3 / 400MHz)
265	3.46(3H, s), 4.68(2H, s), 4.94(2H, s), 5.97(1H, d, $J = 3.2\text{Hz}$), 6.04(1H, d, $J = 3.2\text{Hz}$), 6.78(1H, s), 6.83(1H, s), 6.91(1H, d, $J = 7.2\text{Hz}$), 7.17(1H, dd, $J = 5.2\text{Hz}$, $J = 7.6\text{Hz}$), 7.58(1H, dt, $J = 5.2\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.54(1H, d, $J = 4.8\text{Hz}$)
267	4.61(2H, s), 4.90(2H, s), 6.29(1H, s), 6.59(1H, s), 6.91(1H, d, $J = 1.6\text{Hz}$), 7.08(1H, d, $J = 7.6\text{Hz}$), 7.16-7.21(2H, m), 7.60(1H, dt, $J = 4.8\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.76(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.30(1H, d, $J = 5.2\text{Hz}$), 8.50(1H, d, $J = 4.8\text{Hz}$)
268	2.13(3H, s), 3.80(3H, s), 4.71(2H, s), 5.03(2H, s), 6.64(1H, s), 6.77(1H, s), 6.96(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.14(1H, dd, $J = 6.8$, 5.6Hz), 7.58(1H, dd, $J = 7.2$, 6.8Hz), 6.50(1H, d, $J = 4.4\text{Hz}$)
269	3.06(1H, dd, $J = 8.0\text{Hz}$, $J = 16.8\text{Hz}$), 3.44-3.52(1H, m), 3.95(1H, dd, $J = 8.0\text{Hz}$, $J = 15.2\text{Hz}$), 4.08-4.14(1H, m), 4.96(2H, s), 5.23-5.29(1H, m), 6.83(1H, s), 7.19-7.22(1H, m), 7.28-7.32(2H, m), 7.36-7.38(2H, m), 7.66(1H, dt, $J = 4.4\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.56(1H, d, $J = 4.4\text{Hz}$)
270	1.19-1.33(2H, m), 1.35-1.39(1H, m), 1.56-1.61(2H, m), 1.74-1.77(2H, m), 2.13-2.20(1H, m), 2.40(3H, s), 2.85-2.88(1H, m), 3.47-3.52(1H, m), 4.09-4.16(1H, m), 4.77(1H, d, $J = 16.8\text{Hz}$), 4.93(1H, d, $J = 16.8\text{Hz}$), 6.75(1H, s), 7.15-7.20(2H, m), 7.63(1H, dt, $J = 5.2\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.55(1H, d, $J = 5.2\text{Hz}$)
271	5.29(2H, s), 7.09(1H, s), 7.24-7.26(1H, m), 7.45(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.72(1H, dt, $J = 4.8\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.32(1H, s), 8.54(1H, d, $J = 4.8\text{Hz}$)
272	7.16(1H, dd, $J = 4.8\text{Hz}$, $J = 7.2\text{Hz}$), 7.30-7.36(3H, m), 7.42-7.45(1H, m), 7.50-7.54(3H, m), 7.64(1H, dt, $J = 4.8\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.49(1H, d, $J = 4.8\text{Hz}$)
273	5.35(2H, s), 6.86-6.90(2H, m), 7.00-7.05(1H, m), 7.15-7.18(1H, m), 7.31-7.38(1H, m), 7.51-7.57(1H, m), 7.64(1H, dt, $J = 4.0\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.47(1H, d, $J = 4.0\text{Hz}$)
279	1.67(3H, d, $J = 6.8\text{Hz}$), 4.77(1H, d, $J = 17.2\text{Hz}$), 4.82(1H, d, $J = 17.2\text{Hz}$), 5.97(1H, d, $J = 6.8\text{Hz}$), 6.57(1H, s), 7.16-7.20(2H, m), 7.31(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.43(1H, d, $J = 7.6\text{Hz}$), 7.62(1H, dt, $J = 4.4\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.39(1H, s), 8.47(1H, d, $J = 4.4\text{Hz}$), 8.55(1H, d, $J = 4.0\text{Hz}$)

10

20

30

【表 2 9】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δ ppm (Solvent : CDCl ₃ / 400MHz)
280	1.69(3H, t, J = 6.8Hz), 4.77-4.97(2H, m), 6.67(1H, brs), 6.95-7.00(2H, m), 7.15-7.20(2H, m), 7.34(1H, brs), 7.57(1H, d, J = 7.8Hz), 7.62(1H, t d, J = 7.6, 1.7Hz), 8.51(1H, d, J = 4.8Hz), 8.54(1H, d, J = 4.4Hz)
283	1.65(3H, d, J = 7.2Hz), 2.96(3H, s), 6.07(1H, q, J = 6.9Hz), 6.93(1H, s), 7.18(1H, dd, J = 7.6, 4.8Hz), 7.28(1H, d, J = 8.0Hz), 7.63(1H, td, J = 7.8, 2.0Hz), 8.58(1H, dt, J = 4.0, 0.9Hz)
287	1.71(3H, t, J = 6.8Hz), 4.72(1H, d, J = 17.8Hz), 5.05(1H, d, J = 17.8Hz), 6.26(1H, q, J = 7.2Hz), 6.88(1H, s), 7.10(1H, d, J = 8.0Hz), 7.18(1H, dd, J = 6.8, 4.8Hz), 7.61(1H, td, J = 8.0, 1.9Hz), 8.44(1H, d, J = 2.4Hz), 8.48(1H, t, J = 2.2Hz), 8.54-8.69(1H, m), 8.69(1H, s)
288	1.69(3H, t, J = 7.2Hz), 4.70(1H, d, J = 17.8Hz), 4.93(1H, d, J = 17.8Hz), 6.23(1H, q, J = 7.2Hz), 6.60(1H, s), 7.06(1H, d, J = 8.0Hz), 7.17(1H, dd, J = 6.8, 4.8Hz), 7.59(1H, td, J = 7.8, 1.6Hz), 8.44(1H, d, J = 3.2Hz), 8.48(1H, t, J = 2.0Hz), 8.52(1H, d, J = 4.0Hz), 8.70(1H, d, J = 1.6Hz)
289	4.98(1H, brs), 5.98(1H, brs), 6.13(1H, brs), 7.16(1H, dd, J = 7.4, 5.0Hz), 7.49-7.53(2H, m), 7.57-7.66(2H, m), 7.74(1H, dd, J = 7.2, 0.8Hz), 7.92(1H, dd, J = 8.4, 0.8Hz), 8.26(1H, dd, J = 8.4, 2.0Hz), 8.48(1H, d, J = 4.4Hz), 8.89(1H, dd, J = 4.2, 1.8Hz)
291	4.93(2H, s), 4.95(2H, s), 7.19-7.38(4H, m), 7.26(1H, s), 7.65(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.40(1H, d, J = 2.4Hz), 8.56(1H, m)
292	4.99(4H, s), 7.07(1H, s), 7.19-7.36(4H, m), 7.65(1H, td, J = 7.6, 2.0Hz), 8.40(1H, d, J = 2.0Hz), 8.56(1H, d, J = 4.4Hz)
293	2.51(3H, s), 4.75-4.91(2H, m), 5.15(2H, br. s), 6.95(1H, br. s), 7.08(1H, d, J = 8.0Hz), 7.20-7.33(3H, m), 7.54(1H, t, J = 8.0Hz), 7.67(1H, td, J = 8.0, 1.6Hz), 8.56(1H, br. s)
294	3.79(3H, s), 3.83(3H, s), 4.78(2H, s), 5.01(2H, s), 6.55(1H, s), 6.62(1H, d, J = 8.0Hz), 6.78(1H, d, J = 7.2Hz), 7.17-7.22(2H, m), 7.48-7.53(1H, m), 7.61(1H, dt, J = 5.2Hz, J = 9.2Hz), 8.57(1H, d, J = 5.2Hz)
295	3.83(3H, s), 4.77(2H, s), 5.01(2H, s), 6.63(1H, d, J = 8.4Hz), 6.80(1H, d, J = 6.8Hz), 7.00(1H, s), 7.18-7.25(2H, m), 7.51(1H, d, J = 8.0Hz), 7.63(1H, dt, J = 4.8Hz, J = 8.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.8Hz)

10

20

30

【 0 1 5 7 】

【表 3 0】

第2表 (続き)

No.	$^1\text{H-NMR}$ δ ppm (Solvent : CDCl_3 / 400MHz)
296	3.86(6H, s), 4.83(4H, s), 6.63(2H, d, $J = 7.6\text{Hz}$), 6.81(2H, d, $J = 7.2\text{Hz}$), 7.04(1H, s), 7.49-7.54(2H, m)
297	4.93(2H, s), 4.94(2H, s), 6.79(1H, s), 7.19-7.36(3H, m), 7.39(1H, d, $J = 7.2\text{Hz}$), 7.50(1H, d, $J = 7.2\text{Hz}$), 7.66(1H, dt, $J = 5.2\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.55(1H, d, $J = 4.8\text{Hz}$)
298	4.91(2H, s), 4.95(2H, s), 6.77(1H, s), 6.84(1H, dd, $J = 8.4$, 2.4Hz), 7.14-7.32(3H, m), 7.63-7.77(2H, m), 8.56(1H, m)
299	4.95(2H, s), 5.00(2H, s), 6.84(1H, dd, $J = 8.4$, 2.4Hz), 7.05(1H, s), 7.19-7.33(3H, m), 7.64-7.77(2H, m), 8.56(1H, m)
301	5.05(2H, s), 5.10(2H, s), 7.03(1H, s), 7.17-7.20(2H, m), 7.37-7.48(4H, m), 7.57-7.67(3H, m), 7.94-7.99(2H, m), 8.58(1H, d, $J = 4.8\text{Hz}$)
302	4.96(2H, s), 4.98(2H, s), 6.26(1H, t, $J = 6.4\text{Hz}$), 6.63(1H, d, $J = 9.2\text{Hz}$), 6.89(1H, s), 7.22-7.31(3H, m), 7.36-7.41(1H, m), 7.64(1H, t, $J = 7.2\text{Hz}$), 7.74-7.81(2H, m), 7.89(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.58(1H, d, $J = 4.8\text{Hz}$)
304	4.00(3H, s), 4.95(2H, s), 5.08(2H, s), 6.85(1H, s), 7.19-7.22(1H, m), 7.26-7.29(1H, m), 7.44(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.64(1H, dt, $J = 4.4\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.80(1H, t, $J = 7.6\text{Hz}$), 8.04(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.55(1H, d, $J = 4.4\text{Hz}$)
305	5.04(2H, s), 5.06(2H, s), 6.79(1H, s), 7.27-7.35(2H, m), 7.56(1H, d, $J = 7.6\text{Hz}$), 7.73(1H, dt, $J = 3.6\text{Hz}$, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.89(1H, t, $J = 8.0\text{Hz}$), 8.10(1H, d, $J = 7.6\text{Hz}$), 8.41(1H, bs), 8.62(1H, d, $J = 3.6\text{Hz}$)
306	4.93(2H, s), 5.01(2H, s), 6.81(1H, s), 7.21-7.24(1H, m), 7.27-7.30(1H, m), 7.56-7.61(2H, m), 7.65-7.70(1H, m), 7.79(1H, t, $J = 7.6\text{Hz}$), 8.55(1H, d, $J = 3.6\text{Hz}$)
308	2.54(3H, s), 4.81(2H, s), 4.88(2H, s), 7.09(1H, dd, $J = 8.0$, 4.8Hz), 7.21(1H, d, $J = 7.6\text{Hz}$), 7.22(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.26(1H, s), 7.36(1H, d, $J = 7.6\text{Hz}$), 7.65(1H, td, $J = 8.0$, 2.0Hz), 8.42(1H, dd, $J = 4.8$, 1.6Hz), 8.55(1H, dd, $J = 5.2$, 2.4Hz)
310	2.55(3H, s), 4.83(2H, s), 4.96(2H, s), 6.91(1H, s), 7.09(1H, dd, $J = 8.0$, 4.8Hz), 7.20-7.24(2H, m), 7.36(1H, d, $J = 8.0\text{Hz}$), 7.65(1H, td, $J = 7.6$, 1.6Hz), 8.43(1H, dd, $J = 5.2$, 1.6Hz), 8.55(1H, m)

10

20

30

【 0 1 5 8 】

【表 3 1】

第2表 (続き)

No.	¹ H-NMR δppm (Solvent : CDCl ₃ /400MHz)
311	2.53(3H, s), 4.83(2H, s), 4.87(2H, s), 6.71(1H, s), 7.12(1H, d, J = 8.0 Hz), 7.17-7.23(2H, m), 7.51(1H, dd, J = 8.0, 2.0Hz), 7.65(1H, td, J = 7.6, 1.2Hz), 8.42(1H, d, J = 2.4Hz), 8.57(1H, d, J = 4.0Hz)
312	2.54(3H, s), 4.83(2H, s), 4.94(2H, s), 6.96(1H, s), 7.12(1H, d, J = 8.4 Hz), 7.19-7.24(2H, m), 7.53(1H, dd, J = 7.6, 2.4Hz), 7.65(1H, td, J = 8.0, 1.6Hz), 8.44(1H, d, J = 2.0Hz), 8.57(1H, d, J = 4.8Hz)
313	2.54(3H, s), 4.79(2H, s), 4.88(2H, s), 6.69(1H, s), 6.96(1H, d, J = 4.8 Hz), 7.00(1H, s), 7.21(1H, d, J = 7.6Hz), 7.23(1H, d, J = 7.6Hz), 7.66(1H, td, J = 8.0, 2.0Hz), 8.43(1H, d, J = 5.6Hz), 8.56(1H, td, J = 4.8, 1.2Hz)
318	4.84(2H, s), 4.99(2H, s), 6.97(1H, s), 7.19-7.28(3H, m), 7.63-7.68(2H, m), 8.54-8.58(3H, m)
320	1.70(3H, brs), 4.77-5.11(2H, m), 6.46(1H, brs), 6.95(2H, brs), 7.17-7.20(2H, m), 7.35(1H, s), 7.57-7.70(2H, m), 8.51-8.55(2H, m)
321	3.14(6H, s), 4.97(4H, brs), 6.32(1H, s), 7.18-7.22(4H, m), 7.65(2H, td, J = 7.8, 1.9Hz), 8.56(2H, d, J = 4.4Hz)
324	(solvent : DMSO-d ₆) 1.83(4H, br. s), 3.40-3.50(4H, m), 4.91(2H, br. s), 4.99(2H, br. s), 6.66(1H, br. s), 7.03(1H, s), 7.20-7.32(2H, m), 7.34(1H, d, J=7.6Hz), 7.76(1H, t, 8.0Hz), 8.02(1H, br. s), 8.50(1H, d, J = 4.4Hz)
329	1.68(3H, d, J= 6.8Hz), 2.47(3H, s), 4.78(2H, br. s), 4.98-5.03(1H, m), 7.01(1H, d, J = 3.8Hz), 6.43(1H, br. s), 6.60(1H, br. s), 6.95-7.11(1H, m), 7.17(1H, dd, J = 6.8, 4.8Hz), 7.50(1H, t, J = 8.0Hz), 7.57(1H, m), 8.52(1H, m)

10

20

【0159】

次に試験例を記載する。

試験例1 モモアカアブラムシに対する効果試験

ダイコン葉を水の入った試験管に挿し、その葉上にモモアカアブラムシ1齢幼虫を約20頭放飼した。翌日、ダイコン葉上に寄生している幼虫数を数えた後、寄生したダイコン葉を本発明化合物の濃度が800ppmとなるように調整した薬液に約10秒間浸漬処理した。薬液が風乾した後に、25℃の照明付恒温室内に放置した。処理5日後にモモアカアブラムシの生死を判定し、下記の計算式により死虫率を求めた。尚、離脱虫及び異常虫は死亡虫とみなした。前記化合物No. 1、2、4、6、9、10、13、16、17、18、19、20、22、24、27、32、34、35、38、40、42、43、45、48、53-55、57、62-64、68、70、71、73、74、77-81、83、86-107、112、114、116-118、121、123、124、128、133、134、136、137、139-142、145-149、151、152、154、155、157、161、162、164、165、167、168、173-175、177、178、182-186、191、192、200-206、208、210、211、213-215、217-220、222、223、225-230、231、233-235、239、240、242、248、255-264、270、271、280、284、287、288、290-293、295、297-300、303、304、306-314、316-321、329、331及び332を供試したところ、全ての化合物が90%以上の死虫率を示した。

40

$$\text{死虫率}(\%) = (1 - (\text{生存虫数} / \text{処理虫数})) \times 100$$

50

【0160】

試験例2 ハスモンヨトウに対する効果試験

本発明化合物の濃度が800ppmとなるよう調製した薬液に、キャベツの葉片を約10秒間浸漬し、風乾した。直径9cmのペトリ皿に湿った濾紙を敷き、その上に風乾したキャベツの葉片を置いた。そこへ、2~3令のハスモンヨトウ幼虫10頭を放ち、ふたをして25℃の照明付恒温室内に放置した。放虫後5日目に生死を判定し、下記計算式により死虫率を求めた。尚、異常虫は死亡とみなした。前記化合物No. 1、2、4、6、9-11、16、17、19、20、22-24、42、43、45、48、50、53-57、59、63、64、67-71、73、74、76、77、79、80、83、86、89、92、93、95-100、102、103、105、106、109、112、114、116-118、121、124、125、133、135、137、139、140、142、145-149、151、154、155、157、161、162、164-168、173-180、182-186、191、192、194、198、201、202、204-208、210、211、213、214、217-225、228、229、231-235、238-240、242、248、250、251、252、255-257、259-263、266、270、277、280、285、287-293、295、297-300、303-306、308-314、316-321、326、327、329、331及び332を供試したところ、全ての化合物が90%以上の死虫率を示した。

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

【0161】

試験例3 ナミハダニ殺成虫試験

本発明化合物の濃度が800ppmとなるよう調製した薬液を準備した。インゲンマメの初生葉1枚のみを残してポット（直径8cm、高さ7cm）に移植し、これにナミハダニの成虫20頭を放虫した。このものをインゲン葉とともに前記薬液に浸漬し、風乾後25℃の照明付恒温室内に放置した。処理後2日目又は3日目に生死を判定し、下記計算式により殺成虫率を求めた。尚、離脱した成虫及び異常虫は死亡とみなした。前記化合物No. 1-4、6、9、10、13、16-19、24、27、35、42、43、45、48、53-55、57、62-64、68、70-74、77-80、83、86-90、92-107、109、110、112、114、116、118、121、133-135、137、139、140、141、142、146-149、151、152、154、155、157、161、162、164-168、171、173-176、180-187、191-193、196、198、199-201、204-206、208、210、211、213-215、217-223、225-228、230、231、234-236、240-242、248、255-263、270、271、272、279、280、284、285、287-293、295、297-300、303-306、308-314、316-321、324-326、329、331及び332を供試したところ、全ての化合物が90%以上の殺成虫率を示した。

$$\text{殺成虫率}(\%) = (\text{死亡したハダニ数} / \text{処理したハダニ数}) \times 100$$

【0162】

試験例4 フタトゲチマダニに対する薬効試験

9cm径シャーレ内面に、本発明化合物のアセトン溶液1ml（濃度：10μg/ml）をマイクロピペットで滴下処理する。シャーレ内面が乾燥した後、60~180匹の幼ダニを入れ、ポリエチレンシートで被って輪ゴムで密封する。薬剤接触後の横転（ノックダウン）ダニ数を観察すると、本発明化合物は大部分のフタトゲチマダニを横転させる。

【0163】

試験例5 フタトゲチマダニに対するイヌを用いた薬効試験

フタトゲチマダニの若ダニ50頭をイヌ（ビーグル、8ヶ月齢）の耳介に放ち、人工寄生させる。寄生2日後に定着したダニを計数した後、頸背部に製剤化した本発明化合物を10mg/kgの用量でスポットオンする。薬剤投与後5日目まで観察を行い、寄生数、

落下数及び落下したフタトゲチマダニの生死を観察する。尚、イヌはケージに入れて個別に飼育し、水道水を自由に摂取させ、イヌ用飼料の所定量を1日1回与える。その結果、本発明化合物は、寄生させたフタトゲチマダニを落下又は致死させる。

【0164】

試験例6 ネコノミに対するイヌを用いた薬効試験

羽化後3日以内のネコノミ未吸血成虫100頭をイヌ（ビーグル、8ヶ月齢）の背部被毛上に放ち人工寄生させ、頸背部に製剤化した本発明化合物を10mg/kgの用量でスポットオンする。薬剤投与後3日目にノミ取り櫛を用いてネコノミを回収し、その定着数を調べる。尚、イヌはケージに入れて個別に飼育し、水道水を自由に摂取させ、イヌ用飼料の所定量を1日1回与える。その結果、本発明化合物は、ネコノミの定着を抑制する。

10

【0165】

次に製剤例を記載する。

製剤例1

- (1) 本発明化合物 20重量部
- (2) クレー 70重量部
- (3) ホワイトカーボン 5重量部
- (4) ポリカルボン酸ナトリウム 3重量部
- (5) アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム 2重量部

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

製剤例2

20

- (1) 本発明化合物 5重量部
- (2) タルク 60重量部
- (3) 炭酸カルシウム 34.5重量部
- (4) 流動パラフィン 0.5重量部

以上のものを均一に混合して粉剤とする。

製剤例3

- (1) 本発明化合物 20重量部
- (2) N,N-ジメチルアセトアミド 20重量部
- (3) ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテル 10重量部
- (4) ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 2重量部
- (5) キシレン 48重量部

30

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

【0166】

製剤例4

- (1) クレー 68重量部
- (2) リグニンスルホン酸ナトリウム 2重量部
- (3) ポリオキシエチレンアルキルアリアルサルフェート 5重量部
- (4) ホワイトカーボン 25重量部

以上の各成分の混合物と、本発明化合物とを4:1の重量割合で混合し、水和剤とする。

製剤例5

40

- (1) 本発明化合物 50重量部
- (2) アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウムホルムアルデヒド縮合物 2重量部
- (3) シリコンオイル 0.2重量部
- (4) 水 47.8重量部

以上のものを均一に混合、粉碎した原液に更に

- (5) ポリカルボン酸ナトリウム 5重量部
- (6) 無水硫酸ナトリウム 42.8重量部

を加え均一に混合、造粒、乾燥して顆粒水和剤とする。

【0167】

製剤例6

50

(1) 本発明化合物 5 重量部

(2) ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル 1 重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸エステル 0.1 重量部

(4) 粒状炭酸カルシウム 93.9 重量部

(1) ~ (3) を予め均一に混合し、適量のアセトンで希釈した後、(4) に吹付け、アセトンを除去して粒剤とする。

製剤例 7

(1) 本発明化合物 2.5 重量部

(2) N, N-ジメチルアセトアミド 2.5 重量部

(3) 大豆油 95.0 重量部

10

以上のものを均一に混合、溶解して微量散布剤(ultra low volume formulation)とする。

【0168】

製剤例 8

(1) 本発明化合物 40 重量部

(2) ポリオキシエチレントリスチリルフェニルエーテルリン酸カリウム 4 重量部

(3) シリコンオイル 0.2 重量部

(4) キサンタンガム 0.1 重量部

(5) エチレングリコール 5 重量部

(6) 水 50.7 重量部

以上のものを均一に混合、粉碎して水性懸濁剤とする。

20

製剤例 9

(1) 本発明化合物 10 重量部

(2) ジエチレングリコールモノエチルエーテル 80 重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルエーテル 10 重量部

以上の成分を均一に混合し、水溶性液剤とする。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	テーマコード (参考)
A 0 1 N 43/80	(2006.01)	A 0 1 N 43/80	1 0 1
A 0 1 N 43/56	(2006.01)	A 0 1 N 43/56	C
A 0 1 N 43/84	(2006.01)	A 0 1 N 43/84	1 0 1
A 0 1 N 43/824	(2006.01)	A 0 1 N 43/54	C
A 0 1 N 43/60	(2006.01)	A 0 1 N 43/78	C
A 0 1 N 43/90	(2006.01)	A 0 1 N 43/82	1 0 1 B
A 0 1 P 7/04	(2006.01)	A 0 1 N 43/42	1 0 2
A 0 1 P 7/02	(2006.01)	A 0 1 N 43/60	
A 0 1 P 5/00	(2006.01)	A 0 1 N 43/90	1 0 3
		A 0 1 P 7/04	
		A 0 1 P 7/02	
		A 0 1 P 5/00	

(72)発明者 東 久美子

滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社中央研究所内

(72)発明者 ▲濱▼本 卓

滋賀県草津市西渋川二丁目3番1号 石原産業株式会社中央研究所内

Fターム(参考) 4C055 AA01 BA03 BA05 BA13 BA39 BA52 BB02 BB10 CA02 CA39
DA06 DA13 EA01 EA02 FA15
4H011 AC01 AC04 BA01 BB09 BB10 BC03 DA02 DA15 DA16 DC05
DD03