(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号

特許第3857722号

(P3857722)

(45)発行日　平成18年12月13日(2006.12.13)　(24)登録日　平成18年9月22日(2006.9.22)

(51)Int.Cl.		F I		
C07C 317/14	(2006.01)	C07C 317/14		
A01N 43/08	(2006.01)	A01N 43/08	A	
A01N 43/10	(2006.01)	A01N 43/10	A	
A01N 43/50	(2006.01)	A01N 43/50	N	
A01N 43/713	(2006.01)	A01N 43/713		

請求項の数 10　(全 183 頁)　最終頁に続く

(21)出願番号	特願平7-523286
(86)(22)出願日	平成7年2月27日(1995.2.27)
(65)公表番号	特表平9-510197
(43)公表日	平成9年10月14日(1997.10.14)
(86)国際出願番号	PCT/GB1995/000400
(87)国際公開番号	WO1995/024403
(87)国際公開日	平成7年9月14日(1995.9.14)
審査請求日	平成14年2月15日(2002.2.15)
(31)優先権主張番号	9404716.4
(32)優先日	平成6年3月10日(1994.3.10)
(33)優先権主張国	英国(GB)
(31)優先権主張番号	9404717.2
(32)優先日	平成6年3月10日(1994.3.10)
(33)優先権主張国	英国(GB)

(73)特許権者
シンジェンタ　リミテッド
イギリス国サリー　ジーユー２　７ワイエイチ，ギルドフォード，サリー・リサーチ・パーク，プリーストリー・ロード，ヨーロピアン・リージョナル・センター
(74)代理人
弁理士　社本　一夫
(74)代理人
弁理士　今井　庄亮
(74)代理人
弁理士　増井　忠弐
(74)代理人
弁理士　栗田　忠彦

最終頁に続く

(54)【発明の名称】殺虫活性を有する（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－置換複素環または炭素環化合物

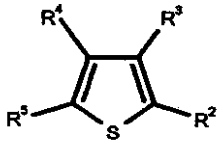
(57)【特許請求の範囲】

【請求項１】

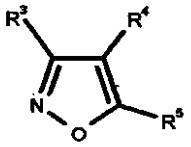
式（Ｉ）の化合物

$R-S(O)_nCH_2CH_2CH=CF_2$

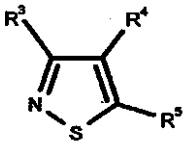
またはその塩［式中のｎは０、１または２であり；Ｒは式（ＩＩＩ）ないし（ＶＩＩ）および（ＩＸ）ないし（ＸＸＩ）の基：



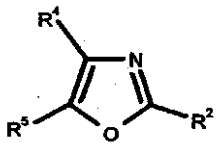
(III)



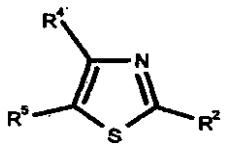
(IV)



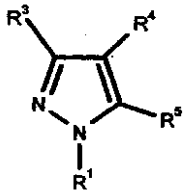
(V)



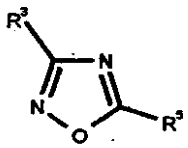
(VI)



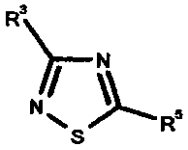
(VII)



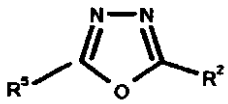
(IX)



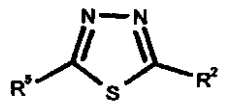
(X)



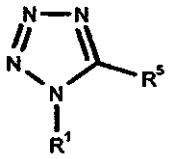
(XI)



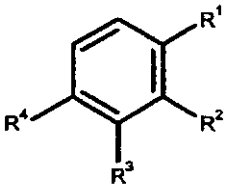
(XII)



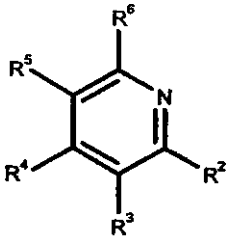
(XIII)



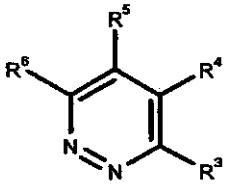
(XIV)



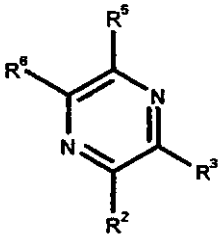
(XV)



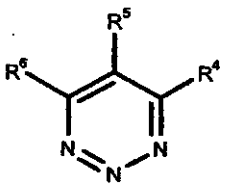
(XVI)



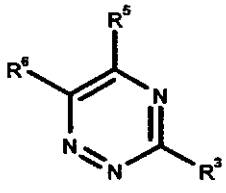
(XVII)



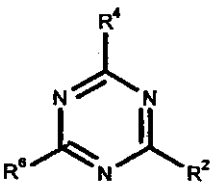
(XVIII)



(XIX)



(XX)



(XXI)

であり；これらの式において

－Ｓ（Ｏ）$_n$ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ＝ＣＦ$_2$基はＲ^1（炭素原子に結合している場合）、Ｒ^2、Ｒ^3、Ｒ^4、Ｒ^{5}またはＲ^{6}のうち少なくとも１つであり；
Ｒ^1（炭素原子に結合している場合）、Ｒ^2、Ｒ^3、Ｒ^4、Ｒ^{5}およびＲ^{6}はそれぞれ独立して水素；ニトロ；ハロゲン；シアノ；－ＣＨ＝ＮＯＨ；Ｃ$_{1-4}$アルキル；Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル；Ｃ$_{2-4}$アルケニル；Ｃ$_{2-4}$ハロアルケニル；シクロプロピル；ヒドロキシ；Ｃ$_{1-4}$アルコキシ；Ｃ$_{2-4}$アルコキシアルキル；－ＣＯＯＨ；Ｃ$_{2-4}$アルコキシカルボニル；Ｃ$_{3-4}$ハロアルケニルオキシカルボニル；－ＣＯＮＨ$_2$；モノ－もしくはジ－Ｃ$_{1-2}$アルキルアミノカルボニル；Ｃ$_{2-4}$アルカンカルボニル；ハロゲン、ニトロ、Ｃ$_{1-4}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$アルコキシもしくはアミノスルホニルから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいフェニル；－ＣＯＮＨＳＯ$_2$－Ｃ$_{1-4}$アルキル；ハロゲン、ニトロ、Ｃ$_{1-4}$アルキルもしくはＣ$_{1-4}$アルコキシから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいベンジル；ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1-4}$アルキルもしくはＣ$_{1-4}$アルコキシから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいフェノキシ；Ｃ$_{1-4}$アルキル基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいアミノ；－ＳＨ；Ｃ$_{1-4}$アルキルチオ；ハロゲンもしくはＣ$_{1-4}$ハロアルキルから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいベンジルチオ；Ｃ$_{2-4}$アルケニルチオ；Ｃ$_{2-4}$ハロアルケニルチオ；第２のＳ（Ｏ）$_n$ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ＝ＣＦ$_2$基；Ｃ$_{1-4}$アルカンスルホニル；Ｃ$_{1-4}$ハロアルカンスルホニル；フルオロスルホニル；モノ－もしくはジ－Ｃ$_{1-4}$アルキルスルファモイル；またはハロゲンで置換されていてもよい５員もしくは６員のヘテロアリール基であり；かつＲ^1（窒素原子に結合している場合）は水素；ニトロ；シアノ；－ＣＨ＝ＮＯＨ；Ｃ$_{1-4}$アルキル；Ｃ$_{1-4}$ハロアルキル；シクロプロピル；ヒドロキシ；－ＣＯＯＨ；Ｃ$_{2-4}$アルコキシカルボニル；Ｃ$_{3-4}$ハロアルケニルオキシカルボニル；－ＣＯＮＨ$_2$；モノ－もしくはジ－Ｃ$_{1-2}$アルキルアミノカルボニル；Ｃ$_{2-4}$アルカンカルボニル；ハロゲン、ニトロ、Ｃ$_{1-4}$アルキル、Ｃ$_{1-4}$アルコキシもしくはアミノスルホニルから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいフェニル；－ＣＯＮＨＳＯ$_2$－Ｃ$_{1-4}$アルキル；ハロゲン、ニトロ、Ｃ$_{1-4}$アルキルもしくはＣ$_{1-4}$アルコキシから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいベンジル；ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1-4}$アルキルもしくはＣ$_{1-4}$アルコキシから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいフェノキシ；Ｃ$_{1-4}$アルキル基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいアミノ；－ＳＨ；Ｃ$_{1-4}$アルキルチオ；ハロゲンもしくはＣ$_{1-4}$ハロアルキルから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいベンジルチオ；Ｃ$_{2-4}$アルケニルチオ；Ｃ$_{2-4}$ハロアルケニルチオ；Ｃ$_{1-4}$アルカンスルホニル；Ｃ$_{1-4}$ハロアルカンスルホニル；フルオロスルホニル；モノ－もしくはジ－Ｃ$_{1-4}$アルキルスルファモイル；またはハロゲンで置換されていてもよい５員もしくは６員のヘテロアリール基である］。

【請求項２】
３－（チエン－２－イル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）イソオキサゾール（化合物ＩＶ．２５）；
３－（チエン－２－イル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）イソオキサゾール（化合物ＩＶ．２６）；
３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－シアノイソチアゾール（化合物Ｖ．１４）；
３，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－シアノイソチアゾール（化合物Ｖ．１５）；
３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－４－シアノイソチアゾール（化合物Ｖ．１３）；
３，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－シアノイソチアゾール（化合物Ｖ．１２）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－トリフルオロメチルオキサゾール（化合物ＶＩ．４）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－トリフルオロメチルオキ

サゾール（化合物ＶＩ．５）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルオキサゾール－５－カルボン酸（化合物ＶＩ．３７）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルオキサゾール－５－Ｎ－メチルスルホニルカルボキシアミド（化合物ＶＩ．３８）；
５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１４）；
５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１５）；
５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１６）；
５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．２４）；
５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．２５）；
５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．２６）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルチアゾール－５－スルホニルフルオリド（化合物ＶＩＩ．５２）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－メチルチアゾール－５－スルホニルフルオリド（化合物ＶＩＩ．５３）；
５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メトキシメチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．３４）；
５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－３－メトキシメチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．３５）；
５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－３－メトキシメチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．３６）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（４－ニトロフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＶＩＩ．１４１）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－（４－ニトロフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１４２）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－（４－ニトロフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１４３）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－フェニル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．９）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－フェニル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１０）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－フェニル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１１）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．６３）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．６４）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．６５）；
２，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１１７）；
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１１８）；
４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－２，３，５，６－テトラフルオロピ

リジン（化合物ＸＶＩ．２）；
４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－２，３，５，６－テトラフルオロピリジン（化合物ＸＶＩ．３）；
４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－２，３，５，６－テトラフルオロピリジン（化合物ＸＶＩ．４）；
５－シアノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピリジン（化合物ＸＶＩ．１５）；
５－シアノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）ピリジン（化合物ＸＶＩ．１６）；
６－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピラジン（化合物ＸＶＩＩＩ．１４）；
６－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）ピラジン（化合物ＸＶＩＩＩ．１５）；
６－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）ピラジン（化合物ＸＶＩＩＩ．１６）；
３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－プロピル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２７）；
３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－プロピル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２８）；
３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．５２）；
３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－メチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．５３）；または
３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－メチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．５４）、
のうちの１つである、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】
請求項１の記載においてｎが０である化合物を製造する方法であって、式（ＸＸＩＩＩ）の化合物

Ｒ－ＳＨ　　（ＸＸＩＩＩ）

を式（ＸＸＩＶ）の化合物

$CF_2=CHCH_2CH_2L$　　（ＸＸＩＶ）

（式中のＲは請求項１に定めたものであり、Ｌは良好な脱離基である）と反応させることを含む方法。

【請求項４】
請求項１の記載においてｎが０である化合物を製造する方法であって、式（ＸＸＶＩＩ）の化合物

Ｒ－Ｌ　　（ＸＸＶＩＩ）

を式（ＸＸＶＩＩＩ）の化合物

$CF_2=CHCH_2CH_2SH$　　（ＸＸＶＩＩＩ）

（式中のＲは請求項１に定めたものであり、Ｌは良好な脱離基である）と反応させることを含む方法。

【請求項５】
請求項１の記載においてｎが１または２である化合物を製造する方法であって、対応して置換されたｎが０である式（Ｉ）の化合物を酸化することを含む方法。

【請求項６】
有効成分としての請求項１に記載の化合物を農業用として受容しうる希釈剤またはキャリヤーとの混合物として含む、害虫の撲滅および防除のための農業用組成物。

【請求項７】
さらに界面活性物質を含む、請求項６に記載の農業用組成物。

【請求項８】
殺虫薬、殺真菌薬、殺菌薬、殺ダニ薬、または他の生物学的に活性な化合物である少なくとも１種類の他の有効成分をさらに含む、請求項６または７に記載の農業用組成物。
【請求項９】
請求項１に記載の化合物および農業用として受容しうる希釈剤またはキャリヤーを混合することを含む、請求項６－８のいずれか１項に記載の農業用組成物を製造する方法。
【請求項１０】
請求項１に記載の化合物または請求項６－８のいずれか１項に記載の組成物を、有害生物、それらの生息環境、または有害生物による攻撃を受けやすい植物に適用することを含む、線虫、昆虫またはダニを撲滅または防除する方法。
【発明の詳細な説明】
本発明は、殺線虫、殺虫および殺ダニ活性を有する新規な複素環およびフェニル誘導体、それらの製造方法、それらを含有する組成物、ならびにそれらを用いて線虫、昆虫およびダニを死滅させ、または抑制する方法に関するものである。
本発明によれば式（Ｉ）の化合物またはその塩が提供され、式中のｎは０、１または２であり；Ｒは式（ＩＩ）ないし（ＸＸＩ）の基であり；これらの式において：
Ｓ（Ｏ）nＣＨ2ＣＨ2ＣＨ＝ＣＦ2基はＲ1（炭素原子に結合している場合）、Ｒ2、Ｒ3、Ｒ4、Ｒ5またはＲ6のうち少なくとも１つであり；
Ｒ1（炭素原子に結合している場合）、Ｒ2、Ｒ3、Ｒ4、Ｒ5およびＲ6はそれぞれ独立して水素、所望により置換されたアルキル、所望により置換されたアルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたアリールアルキル、所望により置換されたヘテロアリール、所望により置換されたヘテロアリールアルキル、所望により置換されたアリールオキシ、所望により置換されたアリールアルコキシ、所望により置換されたアリールオキシアルキル、所望により置換されたヘテロアリールオキシ、所望により置換されたヘテロアリールアルコキシ、所望により置換されたヘテロアリールオキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、ハロアルコキシ、ハロアルケニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、－ＮＲ7Ｒ8、－ＮＲ7ＣＯＲ8、－ＮＲ7ＣＳＲ8、－ＮＲ7ＳＯ2Ｒ8、－Ｎ（ＳＯ2Ｒ7）（ＳＯ2Ｒ8）、－ＣＯＲ7、－ＣＯＮＲ7Ｒ8、－アルキルＣＯＮＲ7Ｒ8、－ＣＲ7ＮＲ8、－ＣＯＯＲ7、－ＯＣＯＲ7、－ＳＲ7、－ＳＯＲ7、－ＳＯ2Ｒ7、－アルキルＳＲ7、－アルキルＳＯＲ7、－アルキルＳＯ2Ｒ7、－ＯＳＯ2Ｒ7、－ＳＯ2ＮＲ7Ｒ8、－ＣＳＮＲ7Ｒ8、－ＳｉＲ7Ｒ8Ｒ9、－ＯＣＨ2ＣＯ2Ｒ7、－ＯＣＨ2ＣＨ2ＣＯ2Ｒ7、－ＣＯＮＲ7ＳＯ2Ｒ8、－アルキルＣＯＮＲ7ＳＯ2Ｒ8、－ＮＨＣＯＮＲ7Ｒ8、－ＮＨＣＳＮＲ7Ｒ8であるか、またはＲ1、Ｒ2、Ｒ3、Ｒ4、Ｒ5およびＲ6のうち隣接対が一緒になった場合には縮合５員もしくは６員炭素環もしくは複素環を形成し；
Ｒ1（窒素原子に結合している場合）は水素、所望により置換されたアルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたアリールアルキル、所望により置換されたアリールオキシアルキル、所望により置換されたヘテロアリール、所望により置換されたヘテロアリールアルキル、所望により置換されたヘテロアリールオキシアルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、－ＮＲ7Ｒ8、－ＮＲ7ＣＯＲ8、－ＮＲ7ＣＳＲ8、－ＮＲ7ＣＯＯＲ8、－ＮＲ7ＳＯ2Ｒ8、－Ｎ（ＳＯ2Ｒ7）（ＳＯ2Ｒ8）、－ＣＯＲ7、－ＣＯＮＲ7Ｒ8、－アルキルＣＯＮＲ7Ｒ8、－ＣＲ7ＮＲ8、－ＣＯＯＲ7、－ＯＣＯＲ7、－ＳＯＲ7、－ＳＯ2Ｒ7、－アルキルＳＲ7、－アルキルＳＯＲ7、－アルキルＳＯ2Ｒ7、－ＯＳＯ2Ｒ7、－ＳＯ2ＮＲ7ＮＲ8、－ＳＲ7、－ＳＯＲ7、－ＳＯ2Ｒ7、－ＣＳＮＲ7Ｒ8、－ＳｉＲ7Ｒ8Ｒ7、－ＯＣＨ2ＣＯ2Ｒ7、－ＯＣＨ2ＣＨ2ＣＯ2Ｒ7、－ＣＯＮＲ7ＳＯ2Ｒ8、－アルキルＣＯＮＲ7ＳＯ2Ｒ8、－ＮＨＣＯＲ7Ｒ8、または－ＮＨＣＳＲ7Ｒ8であり；
Ｒ7、Ｒ8およびＲ9はそれぞれ独立して水素、所望により置換されたアルキル、所望により置換されたアルケニル、アルキニル、所望により置換されたアリール、所望により置換

されたアリールアルキル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、ハロゲンまたはヒドロキシである。
参照の容易さのためにすぎないが、Ｒ基上の置換基はこのＲ基上の位置に従って命名されたことを説明する。たとえばＲが式（ＩＩ）を有する場合、置換基Ｒ2、Ｒ3、Ｒ4、およびＲ5はそれぞれ環上の位置２、３、４および５にある。疑いを避けるために、Ｓ（Ｏ）ｎＣＨ2ＣＨ2ＣＨ＝ＣＦ2基はＲ1（炭素原子に結合している場合）ないしＲ6で示される置換位置のいずれにあってもよい。
Ｒ1ないしＲ9のいずれかがアルキル基である場合、またはアルキル部分を含む場合、それは直鎖または分枝鎖のいずれであってもよく、好ましくはＣ１－６アルキル、より好ましくはＣ１－４アルキル、たとえばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ｎ－ブチル、イソ－ブチル、ｓｅｃ－ブチルまたはｔ－ブチルである。アルキル基が“連結”基として作用する場合、すなわちたとえばＲ－アルキルＳＲ7中のＲ－アルキル－である場合、Ｃ１－４アルキルまたはＣ１－２アルキルが特に好ましい。
Ｒ1ないしＲ8のいずれかが置換アルキル基である場合、または置換アルキル部分を含む場合、それはハロゲン、ニトロ、シアノ、－ＣＯＯＲ7またはその塩、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシイミノ、アルコキシカルボニル、カルバモイル、モノ－またはジ－アルキルカルバモイル、アミノ、モノ－またはジ－アルキルアミノ、アシルアミド（好ましくはＣ１－６アシルアミド）、アルカンスルホニル、およびアリールスルホニル（それ自身がハロゲン、アルコキシまたはニトロで置換されていてもよい）から選ばれる１個または２個以上の置換基を含むことができる。
Ｒ1ないしＲ8のいずれかがアルケニルもしくはアルキニル基である場合、またはアルケニルもしくはアルキニル部分を含む場合、それは直鎖または分枝鎖のいずれであってもよく、好ましくはＣ２－６アルケニルまたはＣ２－６アルキニル、より好ましくはＣ２－４アルケニルまたはＣ２－４アルキニル、たとえばビニル、アリル、ブト－３－エニル、３－メチル－ブト－３－エニル、エチニルまたはプロパルギルである。
Ｒ1ないしＲ8のいずれかが置換アルケニル基である場合、または置換アルケニル部分を含む場合、それはハロゲン、ＣＯＯＲ7またはその塩、ヒドロキシ、ニトロおよびシアノから選ばれる１個または２個以上の置換基を含むことができる。
Ｒ1ないしＲ6のいずれかがシクロアルキルもしくはアルキルシクロアルキル基である場合、またはシクロアルキルもしくはアルキルシクロアルキル部分を含む場合、それは好ましくはＣ３－６シクロアルキルまたはＣ４－７アルキルシクロアルキル、たとえばシクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシルまたはメチルシクロプロピルである。
Ｒ1ないしＲ6のいずれかがアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシもしくはアルコキシアルキル基である場合、またはそれらの部分を含む場合、それは好ましくはＣ１－６アルコキシ、たとえばメトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシ、イソ－プロポキシ、ｎ－ブトキシ、イソ－ブトキシ、ｓｅｃ－ブトキシおよびｔ－ブトキシ；Ｃ２－６アルケニルオキシ、たとえばビニルオキシ、アリルオキシ、ブト－３－エニルオキシおよび３－メチルブト－３－エニルオキシ；Ｃ２－６アルキニルオキシ、たとえばプロパルギルオキシ；Ｃ２－６モノアルコキシアルキル、たとえばメトキシメチル、メトキシエチルおよびエトキシメチル；またはＣ３－６ジアルコキシアルキル、たとえばジメトキシメチルおよびジエトキシメチルである。
Ｒ1ないしＲ9のいずれかがアリールである場合、またはアリール部分を含む場合、それは好ましくはＣ６－１０アリール、より好ましくはフェニルである。Ｒ1ないしＲ9のいずれかがアリールアルキルである場合、それは好ましくはＣ６－１０アリールメチルまたはＣ６－１０アリールエチル、より好ましくはベンジルまたはフェネチルである。
Ｒ1ないしＲ6のいずれかがヘテロアリールである場合、またはヘテロアリール部分を含む場合、それは好ましくは少なくとも１個のＯ、ＮまたはＳ原子を異種原子として含有する５員または６員環、たとえばピリジン、ピロール、ピラジン、フランまたはチオフェンである。Ｒ1ないしＲ6のいずれかがヘテロアリールアルキルである場合、それは好ましくはヘテロアリール－Ｃ１－２アルキルである。

R1ないしR9のいずれかが、置換されたアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキル基である場合、それはアルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシ、－ＣＯＯＲ7（またはその塩）、アミノスルホニル、シアノまたはニトロから選ばれる１個または２個以上の置換基を含むことができる。これらの基の例は４－メチルフェニル、４－クロロフェニル、４－フルオロフェニル、４－ニトロフェニル、３－トリフルオロメチルフェニル、４－トリフルオロメチルフェニル、４－アミノスルホニルフェニル、４－クロロベンジル、４－フルオロベンジル、３－トリフルオロメチルベンジル、４－トリフルオロメチルベンジル、４－ニトロベンジルおよび４－メチルベンジルである。

R1ないしR6のいずれかがアリールオキシまたはアリールアルコキシ基である場合、それは好ましくはフェノキシ、ベンジルオキシまたはフェネトキシである。

R1ないしR6のいずれかが、置換されたアリールオキシ、アリールアルコキシ、ヘテロアリールオキシまたはヘテロアリールアルコキシ基である場合、それはアルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ヒドロキシ、シアノまたはニトロから選ばれる１個または２個以上の置換基を含むことができる。これらの基の例は４－メチルフェノキシ、４－クロロフェノキシ、４－フルオロフェノキシ、４－ニトロフェノキシ、３－トリフルオロメチルフェノキシ、４－トリフルオロメチルフェノキシ、４－クロロベンジルオキシ、４－フルオロベンジルオキシ、３－トリフルオロメチルベンジルオキシ、４－トリフルオロメチルベンジルオキシ、４－ニトロベンジルオキシおよび４－メチルベンジルオキシである。

R1ないしR9のいずれかがハロゲンである場合、またはハロゲン部分を含む場合、それは好ましくはフッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。さらに好ましくは、それはフッ素、塩素または臭素である。

R1ないしR9のいずれかがハロアルキル、ハロアルケニルまたはハロアルキニル基である場合、それは１個または２個以上のハロゲン原子、好ましくは塩素、フッ素または臭素を含むことができる。これらの基の例はフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、２－フルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、２，２－ジフルオロエテニル、３，３－ジクロロプロプ－２－エニル、２－クロロプロプ－２－エニル、３，４，４－トリフルオロブト－３－エニル、４－フルオロブト－３－エニル、４，４－ジフルオロブト－３－エニルおよび３－メチル－４，４－ジフルオロブト－３－エニルである。

R1ないしR6のいずれかがハロアルコキシ基、ハロアルケニルオキシ基またはハロアルキニルオキシ基である場合、それは１個または２個以上のハロゲン原子、好ましくは塩素、フッ素または臭素を含むことができる。好ましいＣ１－６アルコキシ、Ｃ２－６アルケニルオキシおよびＣ２－６アルキニルオキシ基の例はトリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、２－フルオロエトキシ、２，２，２－トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、１，１，２，２－テトラフルオロエトキシ、２，２－ジフルオロエテニルオキシ、３，４，４－トリフルオロブト－３－エニルオキシ、４－フルオロブト－３－エニルオキシ、４，４－ジフルオロブト－３－エニルオキシ、３－メチル－４，４－ジフルオロブト－３－エニルオキシ、２－クロロプロプ－２－エニルオキシおよび３，３－ジクロロプロプ－２－エニルオキシである。

R1ないしR6のいずれかが基－ＮR7R8である場合、それは好ましくは－ＮH2；モノアルキルアミノ基、たとえばメチルアミノおよびエチルアミノ；またはジアルキルアミノ基、たとえばジメチルアミノおよびジエチルアミノである。

R1ないしR6のいずれかが基－ＮR7ＣＯR8である場合、それは好ましくは－ＮＨＣＨＯ；Ｃ２－６アシルアミノ基、たとえば－ＮＨＣＯＣH3、－ＮＨＣＯＣ2H5；またはベンズアミドであり、これらは以下のものから選ばれる１個または２個以上の置換基で置換されていてもよい：ハロゲン、たとえば塩素、フッ素および臭素；アルキル、たとえばメチルおよびエチル；アルコキシ、たとえばメトキシおよびエトキシ；ハロアルキル、たとえばクロロメチル、フルオロメチル、トリフルオロメチルおよび２，２，２－トリフルオロエチル；ハロアルコキシ；たとえばトリフルオロメトキシおよび２，２，２－トリフルオ

ロエトキシ；ヒドロキシ；シアノおよびニトロ。
R1ないしR6のいずれかが－NR7CSR8である場合、R7およびR8は好ましくはアルキル、たとえばメチルおよびエチルである。
R1ないしR6のいずれかが基－NR7SO2R8である場合、それは好ましくはアルカンスルホンアミド基、たとえば－NHSO2CH3および－NHSO2C2H5である。
R1ないしR6のいずれかが基－N（SO2R7）（SO2R8）である場合、それは好ましくはジ－（アルカンスルホニル）アミノ基、たとえば－N（SO2CH3）2および－N（SO2C2H5）2である。
R1ないしR6のいずれかが基－COR7である場合、それは好ましくはC1－6アシル基；または所望により置換されたベンゾイル基である。ベンゾイルは以下のものから選ばれる1個または2個以上の置換基で置換されていてもよい：ハロゲン、たとえば塩素、フッ素および臭素；アルキル、たとえばメチルおよびエチル；アルコキシ、たとえばメトキシおよびエトキシ；ハロアルキル、たとえばクロロメチル、フルオロメチル、トリフルオロメチルおよび2，2，2－トリフルオロエチル；ハロアルコキシ；たとえばトリフルオロメトキシおよび2，2，2－トリフルオロエトキシ；ヒドロキシ；シアノおよびニトロ。好ましい－COR7基の例はアセチル、プロピオニル、n－ブタノイル、4－クロロベンゾイル、4－フルオロベンゾイル、4－ブロモベンゾイル、4－メチルベンゾイルおよび4－トリフルオロメチルベンゾイル。
R1ないしR6のいずれかが基－CONR7R8である場合、それは好ましくは－CONH2；N－アルキル－カルボキシアミド基、たとえば－CONHCH3、－CONHC2H5および－CONHCH2CH2CH3；またはN，N－ジアルキル－カルボキシアミド基、たとえば－CON（CH3）2、－CON（CH3）（C2H5）および－CON（C2H5）2である。
R1ないしR6のいずれかが基－アルキルCONR7R8である場合、それは好ましくはC1－4アルキルCONR7R8である。
R1ないしR6のいずれかが基－CR7NR8である場合、それは好ましくは－CH＝NOHである。
R1ないしR6のいずれかが基－COOR7である場合、それは好ましくは－COOH；アルコキシカルボニル基、たとえばメトキシカルボニルおよびエトキシカルボニル；またはハロアルケニルオキシカルボニル基、たとえば3，4，4－トリフルオロブト－3－エニルオキシカルボニル、4－フルオロブト－3－エニルオキシカルボニル、4，4－ジフルオロブト－3－エニルオキシカルボニルおよび3－メチル－4，4－ジフルオロブト－3－エニルオキシカルボニルである。
R1ないしR6のいずれかが基－OCOR7である場合、それは好ましくはC2－6アシルオキシ基、たとえば－OCOCH3および－OCOC2H5；または所望により置換されたベンゾイルオキシ基である。ベンゾイルオキシ基は以下のものから選ばれる1個または2個以上の置換基を含むことができる：ハロゲン、たとえば塩素、フッ素および臭素；アルキル、たとえばメチルおよびエチル；アルコキシ、たとえばメトキシおよびエトキシ；ハロアルキル、たとえばクロロメチル、フルオロメチル、トリフルオロメチルおよび2，2，2－トリフルオロエチル；ハロアルコキシ；たとえばトリフルオロメトキシおよび2，2，2－トリフルオロエトキシ；ヒドロキシ；シアノおよびニトロ。
R1ないしR6のいずれかが基－SR7である場合、R7は好ましくは水素、所望により置換されたアルキル、所望により置換されたアルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、所望により置換されたアリール、または所望により置換されたアルールアルキルである。好ましいC1－6アルキルチオ（C1－4アルキルが特に好ましい）、C2－6アルケニルチオまたはC2－6アルキニルチオ基の例は、メチルチオ、エチルチオ、n－プロピルチオ、イソ－プロピルチオ、n－ブチルチオ、イソ－ブチルチオ、sec－ブチルチオまたはt－ブチルチオ、アリルチオ、ブト－3－エニルチオ、3－メチルブト－3－エニルチオおよびプロパルギルチオである。好ましいC1－6ハロアルキルチオ（C1－4アルキルが特に好ましい）、C2－6ハロアルケニルチオまたは

Ｃ２－６ハロアルキニルチオ基の例は、フルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、２－フルオロエチルチオ、２，２，２－トリフルオロエチルチオ、３－フルオロ－ｎ－プロピルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、２－クロロプロプ－２－エニルチオ、３，３－ジクロロプロプ－２－エニルチオ、３，４，４－トリフルオロブト－３－エニルチオ、４－フルオロブト－３－エニルチオ、４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオおよび３－メチル－４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオである。好ましいＣ６－１０アリールチオおよびＣ６－１０アリール－Ｃ１－２アルキルチオ基の例は、３－トリフルオロメチルベンジルチオである。

R1ないしR6のいずれかが基－ＳＯR7である場合、それは好ましくはアルカンスルフィニル、アルケニルスルフィニルまたはアルキニルスルフィニル基、たとえばメタンスルフィニルもしくはエタンスルフィニル；またはハロアルカンスルフィニル、ハロアルケニルスルフィニルもしくはハロアルキニルスルフィニル基、たとえばトリフルオロメタンスルフィニルである。他の好ましい態様において－ＳＯR7は好ましくは－ＳＯＦ、－ＳＯＢｒまたは－ＳＯＣｌである。

R1ないしR6のいずれかが基－ＳＯ2R7である場合、それは好ましくはアルカンスルホニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、ハロアルカンスルホニル、ハロアルケニルスルホニル、ハロアルキニルスルホニル基；または所望により置換されたベンゼンスルホニル基である。ベンゼンスルホニル基は以下のものから選ばれる１個または２個以上の置換基を含むことができる：ハロゲン、たとえば塩素、フッ素および臭素；アルキル、たとえばメチルおよびエチル；アルコキシ、たとえばメトキシおよびエトキシ；ハロアルキル、たとえばクロロメチル、フルオロメチル、トリフルオロメチルおよび２，２，２－トリフルオロエチル；ハロアルコキシ；たとえばトリフルオロメトキシおよび２，２，２－トリフルオロエトキシ；ヒドロキシ；シアノおよびニトロ。これらの基の例はメタンスルホニル、エタンスルホニル、トリフルオロメタンスルホニルおよび４－メチルベンゼンスルホニルである。他の好ましい態様において－ＳＯ2R7は好ましくは－ＳＯ2Ｆ、－ＳＯ2Ｂｒまたは－ＳＯ2Ｃｌである。

したがって式（ＩＩ）ないし（ＸＸＩ）のＲ基が１より多くのＳ（Ｏ）nＣH2CH2CH＝ＣＦ2基を含むことができるのは明らかであろう。好ましくはＲ基はこれらの置換基を１個または２個含む。

R1ないしR6のいずれかが基－ＯＳＯ2R7である場合、それは好ましくはアルカンスルホニルオキシ基または所望により置換されたベンゼンスルホニルオキシ基である。ベンゼンスルホニルは以下のものから選ばれる１個または２個以上の置換基で置換されていてもよい：ハロゲン、たとえば塩素、フッ素および臭素；アルキル、たとえばメチルおよびエチル；アルコキシ、たとえばメトキシおよびエトキシ；ハロアルキル、たとえばクロロメチル、フルオロメチル、トリフルオロメチルおよび２，２，２－トリフルオロエチル；ハロアルコキシ、たとえばトリフルオロメトキシおよび２，２，２－トリフルオロエトキシ；ヒドロキシ；シアノおよびニトロ。

R1ないしR6のいずれかが基－ＳＯ2NR7R8である場合、それは好ましくは－ＳＯ2ＮH2；アルキルアミノスルホニル基、たとえば－ＳＯ2NHＣH3および－ＳＯ2NHＣ2H5；またはジアルキルアミノスルホニル基、たとえば－ＳＯ2Ｎ（ＣH3）2および－ＳＯ2Ｎ（Ｃ2H5）2である。

R1ないしR6のいずれかが基－ＣＳNR7R8である場合、それは好ましくは－ＣＳNH2、－ＣＳNHＣH3または－ＣＳＮ（ＣH3）2である。

R1ないしR6のいずれかが基－ＳｉR7R8R9である場合、それは好ましくはトリアルキルシリル基、たとえばトリメチルシリルおよびトリエチルシリルである。

R1ないしR6のいずれかが基－ＯＣH2ＣＯ2R7である場合、それは好ましくはアルコキシカルボニルメトキシ基、たとえばメトキシカルボニルメトキシおよびエトキシカルボニルメトキシである。

R1ないしR6のいずれかが基－ＯＣH2ＣH2ＣＯ2R7である場合、それは好ましくはアルコキシカルボニルエトキシ基、たとえばメトキシカルボニルエトキシおよびエトキシカル

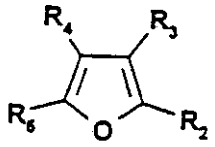
ボニルエトキシである。
R1ないしR6のいずれかが基－ＣＯＮR7ＳＯ2R8である場合、それは好ましくはＮ－アルカンスルホニルカルボキシアミド基またはＮ－アルキル－Ｎ－アルカンスルホニルカルボキシアミド基、たとえばＮ－（メタンスルホニル）－カルボキシアミドおよびＮ－メチル－Ｎ－（メタンスルホニル）カルボキシアミドである。
R1ないしR6のいずれかが基－アルキルＣＯＮR7ＳＯ2R8である場合、R7およびR8は好ましくはアルキル基、たとえばエチルおよびメチルである。
R1ないしR6のいずれかが基－ＮＨＣＯＮR7R8である場合、R7およびR8は好ましくはアルキル基、たとえばエチルおよびメチルである。
R1ないしR6のいずれかが基－ＮＨＣＳＮR7R8である場合、R7およびR8は好ましくはアルキル基、たとえばエチルおよびメチルである。
R1、R2、R3、R4、R5およびR6のうち隣接対が一緒になって、好ましくは２個の酸素原子を含有する縮合５員または６員炭素環または複素環を形成している場合、一緒になった置換基の対は好ましくは－（ＣH2）3－、－（ＣH2）4－、－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－、－Ｏ－ＣH2－Ｏ－であり、これらは所望により１個または２個のハロゲン原子またはメチル基で置換されていてもよく、たとえば－Ｏ－ＣＨＦ－Ｏ－もしくは－Ｏ－ＣＦ2－Ｏ－、－Ｏ－ＣＨ（ＣH3）－Ｏ－、－Ｏ－Ｃ（ＣH3）2－Ｏ－または－Ｏ－（ＣH2）2－Ｏ－である。
本発明の特に好ましい態様によれば、R1（炭素原子に結合している場合）ないしR6はそれぞれ独立して水素；ニトロ；ハロゲン；シアノ；－ＣＨ＝ＮＯＨ；Ｃ１－４アルキル；Ｃ１－４ハロアルキル；Ｃ１－４アルケニル；Ｃ１－４ハロアルケニル；シクロプロピル；ヒドロキシ；Ｃ１－４アルコキシ；Ｃ２－４アルコキシアルキル；－ＣＯＯＨ；Ｃ２－４アルコキシカルボニル；Ｃ２－４ハロアルケニルオキシカルボニル；－ＣＯＮH2；モノ－もしくはジ－Ｃ１－２アルキルアミノカルボニル；Ｃ２－４アルカンカルボニル；－ＣＯＮＨＳＯ2　Ｃ１－４アルキル、好ましくは－ＣＯＮＨＳＯ2ＣH3；所望によりハロゲン、ニトロ、Ｃ１－４アルキル、Ｃ１－４アルコキシもしくはアミノスルホニルから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいフェニル；所望によりハロゲン、ニトロ、Ｃ１－４アルキルもしくはＣ１－４アルコキシから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいベンジル；所望によりハロゲン、シアノ、Ｃ１－４アルキルもしくはＣ１－４アルコキシから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいフェノキシ；所望によりＣ１－４アルキル基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいアミノ；－ＳＨ；Ｃ１－４アルキルチオ；所望によりハロゲンもしくはＣ１－４ハロアルキルから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいベンジルチオ；Ｃ１－４アルケニルチオ；Ｃ２－４ハロアルケニルチオ；第２のＳ（Ｏ）nＣH2ＣH2ＣＨ＝ＣF2基；Ｃ１－４アルカンスルホニル；Ｃ１－４ハロアルカンスルホニル；フルオロスルホニル；モノ－もしくはジ－Ｃ１－４アルキルスルファモイル；５員または６員のヘテロアリール基、たとえばフリル、ピラジニル、ピリジニルもしくはチエニル（所望によりハロゲンで置換されていてもよい）であるか、またはいずれかの隣接対が一緒になって縮合５員または６員炭素環または複素環を形成しており；かつ
R1（窒素原子に結合している場合）は水素；ニトロ；シアノ；－ＣＨ＝ＮＯＨ；Ｃ１－４アルキル；Ｃ１－４ハロアルキル；シクロプロピル；ヒドロキシ；－ＣＯＯＨ；Ｃ２－４アルコキシカルボニル；Ｃ２－４ハロアルケニルオキシカルボニル；－ＣＯＮH2；モノ－もしくはジ－Ｃ１－２アルキルアミノカルボニル；Ｃ２－４アルカンカルボニル；－ＣＯＮＨＳＯ2　Ｃ１－４アルキル、好ましくは－ＣＯＮＨＳＯ2ＣH3；所望によりハロゲン、ニトロ、Ｃ１－４アルキル、Ｃ１－４アルコキシもしくはアミノスルホニルから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいフェニル；所望によりハロゲン、ニトロ、Ｃ１－４アルキルもしくはＣ１－４アルコキシから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいベンジル；所望によりハロゲン、シアノ、Ｃ１－４アルキルもしくはＣ１－４アルコキシから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいフェノキシ；所望によりＣ１－４アルキル基でモノ－もしくはジ－

置換されていてもよいアミノ；－ＳＨ；Ｃ１－４アルキルチオ；所望によりハロゲンもしくはＣ１－４ハロアルキルから独立して選ばれる基でモノ－もしくはジ－置換されていてもよいベンジルチオ；Ｃ１－４アルケニルチオ；Ｃ２－４ハロアルケニルチオ；第２のＳ（Ｏ）nＣＨ2ＣＨ2ＣＨ＝ＣＦ2基；Ｃ１－４アルカンスルホニル；Ｃ１－４ハロアルカンスルホニル；フルオロスルホニル；モノ－もしくはジ－Ｃ１－４アルキルスルファモイル；５員または６員のヘテロアリール基、たとえばフリル、ピラジニル、ピリジニルもしくはチエニル（所望によりハロゲンで置換されていてもよい）である。

以下の表に本発明による化合物の例を挙げる。

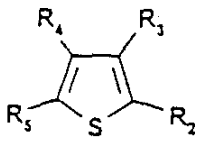
本発明による式（ＩＩ）の化合物の例を表ＩＩに挙げる。

表ＩＩ



No.	R2	R3	R4	R5
II.1	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-H
II.2	2-SOCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-H
II.3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-H
II.4	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CH3
II.5	2-SOCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CH3
II.6	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CH3
II.7	2-CH3	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
II.8	2-CH3	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
II.9	2-CH3	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H

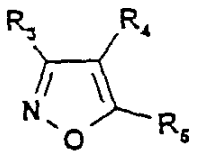
本発明による式（ＩＩＩ）の化合物の例を表ＩＩＩに挙げる。



表ＩＩＩ

No.	R2	R3	R4	R5
III.1	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-H
III.2	2-SOCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-H
III.3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-H
III.4	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CHO
III.5	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CH2OH
III.6	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	(E) 5-CH=NOH
III.7	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	(Z) 5-CH=NOH
III.8	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CN
III.9	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-COCH3
III.10	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	-CH=CH-CH=CH-	
III.11	2-SOCH2CH2CH=CF2	3-H	-CH=CH-CH=CH-	
III.12	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	-CH=CH-CH=CH-	

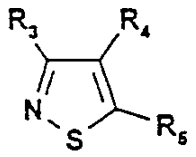
本発明による式（ＩＶ）の化合物の例を表ＩＶに挙げる。



表ＩＶ

No.	R3	R4	R5
IV.1	3-C6H5	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.2	3-C6H5	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IV.3	3-C6H5	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IV.4	3-CN	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.5	3-Cl	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.6	3-CF3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.7	3-CH3	4-CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.8	3-CH3	4-COOCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.9	3-CH3	4-COOH	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.10	3-CH3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.11	3-H	4-Cl	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.12	3-H	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.13	3-H	4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
IV.14	3-H	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IV.15	3-H	4-CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.16	3-H	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.17	3-H	4-NO2	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.18	3-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
IV.19	3-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
IV.20	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
IV.21	3-SCH2CH2CH=CF2	4-Cl	5-H
IV.22	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IV.23	3-(5-Cl-フル-2-イル)	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.24	3-(5-Cl-フル-2-イル)	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IV.25	3-(チエン-2-イル)	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IV.26	3-(チエン-2-イル)	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2

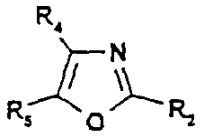
本発明による式（Ｖ）の化合物の例を表Ｖに挙げる。



表V

No.	R3	R4	R5
V.1	3-CF3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
V.2	3-Cl	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
V.3	3-Cl	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
V.4	3-Cl	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
V.5	3-H	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
V.6	3-H	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
V.7	3-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
V.8	3-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-CF3
V.9	3-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
V.10	3-NO2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
V.11	3-SCH2CH2CH=CF2	4-Cl	5-H
V.12	3-SCH2CH2CH=CF2	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
V.13	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
V.14	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
V.15	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
V.16	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl

本発明による式（ＶＩ）の化合物の例を表ＶＩに挙げる。



表V.I

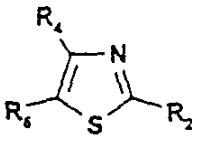
No.	R2	R4	R5
VI.1	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VI.2	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VI.3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VI.4	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CF3	5-H
VI.5	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CF3	5-H
VI.6	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-H
VI.7	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CN	5-H
VI.8	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CONH2	5-H
VI.9	2-SCH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-H
VI.10	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-H
VI.11	2-SCH2CH2CH=CF2	4-COOH	5-H
VI.12	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-Br
VI.13	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
VI.14	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
VI.15	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-Cl
VI.16	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-Cl
VI.17	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-F
VI.18	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-C6H5

VI.19	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-C6H5
VI.20	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-C6H5
VI.21	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CF3
VI.22	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
VI.23	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
VI.24	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
VI.25	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CN
VI.26	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CN
VI.27	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CN
VI.28	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VI.29	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VI.30	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VI.31	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CF3	5-COOCH2CH3
VI.32	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-COOCH3
VI.33	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-COOCH3
VI.34	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-COOCH3
VI.35	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOH
VI.36	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CF3	5-COOH
VI.37	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-COOH
VI.38	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CONHSO2CH3
VI.39	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CONH2
VI.40	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CONH2
VI.41	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CONH2
VI.42	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-NO2
VI.43	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-NO2
VI.44	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-NO2
VI.45	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2F
VI.46	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2F
VI.47	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2NH2
VI.48	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2NH2
VI.49	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-Br
VI.50	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-C6H5
VI.51	2-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-C6H5

VI.52	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
VI.53	2-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-CF3
VI.54	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-Cl
VI.55	2-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-Cl
VI.56	2-H	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-Cl
VI.57	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
VI.58	2-CH3	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
VI.59	2-CH3	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-CN
VI.60	2-CH3	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CN
VI.61	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CONH2
VI.62	2-CH3	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CONH2
VI.63	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH3
VI.64	2-CH3	4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
VI.65	2-CH3	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
VI.66	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOH
VI.67	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-F
VI.68	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-H
VI.69	2-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-H
VI.70	2-H	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H
VI.71	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-NO2
VI.72	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2F
VI.73	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2NH2
VI.74	2-H	4-Br	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.75	2-H	4-C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.76	2-H	4-CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.77	2-H	4-CF3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VI.78	2-H	4-Cl	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.79	2-H	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.80	2-H	4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
VI.81	2-H	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VI.82	2-CH3	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.83	2-H	4-CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.84	2-H	4-CONH2	5-SOCH2CH2CH=CF2

VI.85	2-H	4-CONH2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VI.86	2-CH3	4-CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.87	2-H	4-COOCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.88	2-H	4-COOCH2CH3	5-SOCH2CH2CH=CF2
VI.89	2-H	4-COOCH2CH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VI.90	2-CH3	4-COOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.91	2-H	4-COOH	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.92	2-H	4-F	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.93	2-H	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.94	2-H	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VI.95	2-H	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VI.96	2-H	4-NO2	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.97	2-H	4-NO2	5-SOCH2CH2CH=CF2
VI.98	2-H	4-SO2F	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.99	2-H	4-SO2NH2	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.100	2-Br	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.101	2-C6H5	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.102	2-C6H5	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VI.103	2-C6H5	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VI.104	2-CF3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.105	2-CF3	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VI.106	2-Cl	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.107	2-CN	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.108	2-CN	4-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.109	2-CONH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.110	2-CONH2	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VI.111	2-CONH2	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VI.112	2-CONH2	4-CH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VI.113	2-COOCH2CH3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.114	2-COOCH3	4-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.115	2-COOH	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.116	2-F	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.117	2-F	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VI.118	2-NO2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.119	2-SO2F	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VI.120	2-SO2NH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2

本発明による式（ＶＩＩ）の化合物の例を表ＶＩＩに挙げる。



表ＶＩＩ

No.	R2	R4	R5
VII.1	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VII.2	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VII.3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VII.4	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CF3	5-H
VII.5	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CF3	5-H
VII.6	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CN	5-H
VII.7	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CONH2	5-H
VII.8	2-SCH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-H
VII.9	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-H
VII.10	2-SCH2CH2CH=CF2	4-COOH	5-H
VII.11	2-SCH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-Br
VII.12	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-Br
VII.13	2-SCH2CH2CH=CF2	4-COOH	5-Br
VII.14	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-Br
VII.15	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-Br
VII.16	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-Br
VII.17	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-C6H5
VII.18	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-C6H5
VII.19	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-C6H5
VII.20	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CF3
VII.21	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CH3
VII.22	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CH3
VII.23	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-CH3

VII.24	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
VII.25	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
VII.26	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
VII.27	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-Cl
VII.28	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-Cl
VII.29	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
VII.30	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
VII.31	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
VII.32	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CN
VII.33	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CN
VII.34	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CN
VII.35	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CONH2
VII.36	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CONH2
VII.37	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CONH2
VII.38	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VII.39	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VII.40	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VII.41	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-COOCH3
VII.42	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-COOCH3
VII.43	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-COOCH3
VII.44	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOH
VII.45	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-COOH
VII.46	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-F
VII.47	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-NO2
VII.48	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-NO2
VII.49	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-NO2
VII.50	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2F
VII.51	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2F
VII.52	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-SO2F
VII.53	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-SO2F
VII.54	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2NH2
VII.55	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2NH2
VII.56	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-SO2N(CH2CH3)2

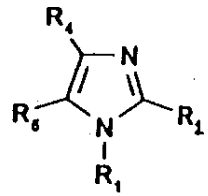
VII.57	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-H
VII.58	2-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-H
VII.59	2-H	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H
VII.60	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-Br
VII.61	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-C6H5
VII.62	2-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-C6H5
VII.63	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
VII.64	2-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-CF3
VII.65	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-Cl
VII.66	2-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-Cl
VII.67	2-H	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-Cl
VII.68	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
VII.69	2-CH3	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
VII.70	2-CH3	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-CN
VII.71	2-CH3	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CN
VII.72	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CONH2
VII.73	2-CH3	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CONH2
VII.74	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH3
VII.75	2-CH3	4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
VII.76	2-CH3	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
VII.77	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOH
VII.78	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-F
VII.79	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-NO2
VII.80	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2F
VII.81	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2NH2
VII.82	2-H	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.83	2-H	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VII.84	2-H	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VII.85	2-H	4-Br	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.86	2-H	4-C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.87	2-H	4-CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.88	2-H	4-CF3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VII.89	2-H	4-Cl	5-SCH2CH2CH=CF2

VII.90	2-H	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.91	2-H	4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
VII.92	2-H	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VII.93	2-CH3	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.94	2-H	4-CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.95	2-H	4-CONH2	5-SOCH2CH2CH=CF2
VII.96	2-H	4-CONH2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VII.97	2-CH3	4-CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.98	2-H	4-COOCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.99	2-H	4-COOCH2CH3	5-SOCH2CH2CH=CF2
VII.100	2-H	4-COOCH2CH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VII.101	2-CH3	4-COOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.102	2-H	4-COOH	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.103	2-H	4-F	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.104	2-H	4-NO2	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.105	2-H	4-NO2	5-SOCH2CH2CH=CF2
VII.106	2-H	4-SO2F	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.107	2-H	4-SO2NH2	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.108	2-Br	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.109	2-C6H5	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.110	2-C6H5	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VII.111	2-C6H5	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VII.112	2-CF3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.113	2-CF3	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VII.114	2-Cl	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.115	2-Cl	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VII.116	2-Cl	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VII.117	2-CN	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.118	2-CN	4-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.119	2-CONH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.120	2-CONH2	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VII.121	2-CONH2	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VII.122	2-CONH2	4-CH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2

VII.123	2-COOCH2CH3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.124	2-COOCH3	4-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.125	2-COOH	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.126	2-F	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.127	2-F	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VII.128	2-NH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.129	2-NO2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.130	2-O(4-CN-C6H4)	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.131	2-SO2F	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.132	2-SO2NH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.133	2-S-(2)-(5-Cl チアゾール)	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VII.134	2-SCH2CH2CH=CF2	4- ジヒドロ	5- ジヒドロ

本発明による式（ＶＩＩＩ）の化合物の例を表ＶＩＩＩに挙げる。

表ＶＩＩＩ



No.	R1	R2	R4	R5
VIII.1	1-H	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.2	1-H	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.3	1-C6H5	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.4	1-C6H5	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.5	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.6	1-CH3	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.7	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.8	1-CH2CH2CH=CF2	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.9	1-CH2CH2CH=CF2	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.10	1-CH2CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.11	1-CH2CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.12	1-CH2CH2CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.13	1-CH2CH2CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.14	1-CH(CH3)2	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.15	1-CH(CH3)2	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.16	1-C(CH3)3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H
VIII.17	1-C(CH3)3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H

VIII.18	1-SO2CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H
VIII.19	1-H	2-SCH2CH2CH=CF2	4-C6H5
VIII.20	1-H	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-C6H5
VIII.21	1-H	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-C6H5
VIII.22	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-C6H5
VIII.23	1-CH3	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-C6H5
VIII.24	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-C6H5
VIII.25	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H
VIII.26	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H
VIII.27	1-H	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH2CH3
VIII.28	1-H	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH2CH3
VIII.29	1-H	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3
VIII.30	1-H	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3
VIII.31	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3
VIII.32	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3
VIII.33	1-CH2CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3
VIII.34	1-CH2CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3
VIII.35	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H
VIII.36	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H
VIII.37	1-CH(CH3)2	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H
VIII.38	1-CH(CH3)2	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H
VIII.39	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H

5-H	
5-H	
5-H	
5-H	
5-H	
5-H	
5-H	
5-Br	
5-CF3	
5-CH3	
5-CH3	
5-CH3	
5-CH3	
5-CH3	
5-CH3	
5-CH3	
5-CH3	
5-CH3	
5-CH3	
5-CH3	
5-Cl	

VIII.40	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
VIII.41	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
VIII.42	1-CH3	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
VIII.43	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
VIII.44	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CN
VIII.45	1-CH3	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CN
VIII.46	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CN
VIII.47	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CONH2
VIII.48	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CONH2
VIII.49	1-CH3	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-CONH2
VIII.50	1-H	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VIII.51	1-H	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VIII.52	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VIII.53	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOCH2CH3
VIII.54	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOH
VIII.55	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH2CH3	5-COOCH3
VIII.56	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH2CH3	5-COOCH3
VIII.57	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-F
VIII.58	1-H	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-H
VIII.59	1-H	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-H
VIII.60	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-H
VIII.61	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-H

VIII.62	1-CH(CH3)2	2-SCH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-H
VIII.63	1-CH(CH3)2	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CH3	5-H
VIII.64	1-H	2-SCH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-H
VIII.65	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-H
VIII.66	1-CH3	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-H
VIII.67	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-COOCH2CH3	5-H
VIII.68	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-COOCH3	5-CH2CH3
VIII.69	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-NO2
VIII.70	1-CH3	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-NO2
VIII.71	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-NO2
VIII.72	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2F
VIII.73	1-CH3	2-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2F
VIII.74	1-CH3	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2NH2
VIII.75	1-CH3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-SO2NH2
VIII.76	1-CH3	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-H
VIII.77	1-CH3	2-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-H
VIII.78	1-CH3	2-H	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H
VIII.79	1-CH3	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
VIII.80	1-CH3	2-CH3	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
VIII.81	1-CH3	2-CH3	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-CN
VIII.82	1-CH3	2-CH3	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CN
VIII.83	1-CH3	2-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-C6H5

VIII.84	1-CH3	2-H
VIII.85	1-CH3	2-H
VIII.86	1-CH3	2-CH3
VIII.87	1-CH3	2-CH3
VIII.88	1-CH3	2-H
VIII.89	1-CH3	2-H
VIII.90	1-CH3	2-CH3
VIII.91	1-CH3	2-H
VIII.92	1-CH3	2-H
VIII.93	1-CH3	2-H
VIII.94	1-CH3	2-H
VIII.95	1-CH3	2-H
VIII.96	1-CH3	2-H
VIII.97	1-CH3	2-H
VIII.98	1-CH3	2-H
VIII.99	1-CH3	2-H
VIII.100	1-CH3	2-H
VIII.101	1-CH3	2-H
VIII.102	1-CH3	2-H
VIII.103	1-CH3	2-H
VIII.104	1-CH3	2-H
VIII.105	1-CH3	2-H

4-SOCH2CH2CH=CF2	5-C6H5
4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH3
4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOH
4-SCH2CH2CH=CF2	5-CONH2
4-SCH2CH2CH=CF2	5-CONH2
4-SCH2CH2CH=CF2	5-Cl
4-SOCH2CH2CH=CF2	5-Cl
4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-Cl
4-SCH2CH2CH=CF2	5-F
4-SCH2CH2CH=CF2	5-Br
4-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2NH2
4-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2F
4-SCH2CH2CH=CF2	5-NO2
4-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
4-SOCH2CH2CH=CF2	5-CF3
4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2

VIII.106	1-CH3	2-H	4-CN
VIII.107	1-CH3	2-CH3	4-CN
VIII.108	1-CH3	2-H	4-C6H5
VIII.109	1-CH3	2-H	4-COOCH2CH3
VIII.110	1-CH3	2-H	4-COOCH2CH3
VIII.111	1-CH3	2-H	4-COOCH2CH3
VIII.112	1-CH3	2-CH3	4-COOCH3
VIII.113	1-CH3	2-H	4-COOH
VIII.114	1-CH3	2-H	4-CONH2
VIII.115	1-CH3	2-H	4-CONH2
VIII.116	1-CH3	2-H	4-CONH2
VIII.117	1-CH3	2-CH3	4-CONH2
VIII.118	1-CH3	2-H	4-Cl
VIII.119	1-CH3	2-H	4-F
VIII.120	1-CH3	2-H	4-Br
VIII.121	1-CH3	2-H	4-SO2NH2
VIII.122	1-CH3	2-H	4-SO2F
VIII.123	1-CH3	2-H	4-NO2
VIII.124	1-CH3	2-H	4-NO2
VIII.125	1-CH3	2-H	4-CF3
VIII.126	1-CH3	2-H	4-CF3
VIII.127	1-CH3	2-H	4-H

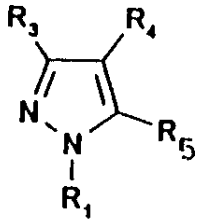
5-SO2CH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SOCH2CH2CH=CF2
5-SO2CH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SOCH2CH2CH=CF2
5-SO2CH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SOCH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2
5-SO2CH2CH2CH=CF2
5-SCH2CH2CH=CF2

VIII.128	1-CH3	2-H	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VIII.129	1-CH3	2-H	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VIII.130	1-CH3	2-CN	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.131	1-CH3	2-CN	4-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.132	1-CH3	2-C6H5	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.133	1-CH3	2-C6H5	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VIII.134	1-CH3	2-C6H5	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VIII.135	1-CH3	2-COOCH2CH3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.136	1-CH3	2-COOCH3	4-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.137	1-CH3	2-COOH	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.138	1-CH3	2-CONH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.139	1-CH3	2-CONH2	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VIII.140	1-CH3	2-CONH2	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VIII.141	1-CH3	2-CONH2	4-CH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
VIII.142	1-CH3	2-Cl	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.143	1-CH3	2-F	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.144	1-CH3	2-F	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
VIII.145	1-CH3	2-Br	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.146	1-CH3	2-SO2NH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.147	1-CH3	2-SO2F	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.148	1-CH3	2-NO2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
VIII.149	1-CH3	2-CF3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2

		4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
		4-H	-CH=CH-CH=CH-
		4-H	-CH=CH-CH=CH-
2-CF3			
2-SCH2CH2CH=CF2			
2-SO2CH2CH2CH=CF2			
VIII.150	1-CH3		
VIII.151	1-5 連結		
VIII.152	1-5 連結		

本発明による式（ＩＸ）の化合物の例を表ＩＸに挙げる。

表ＩＸ



No.	R1	R3	R4	R5
IX.1	1-CH3	3-H	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.2	1-CH3	3-H	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.3	1-CH3	3-H	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.4	1-CH3	3-Cl	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.5	1-CH3	3-Cl	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.6	1-CH3	3-Cl	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.7	1-CH3	3-COOC2H5	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.8	1-CH3	3-COOC2H5	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.9	1-CH3	3-COOC2H5	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.10	1-CH3	3-COOH	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.11	1-CH3	3-COOH	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.12	1-CH3	3-COOH	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.13	1-CH3	3-CONH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2

IX.14	1-CH3	3-CONH2	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.15	1-CH3	3-CONH2	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.16	1-CH3	3-CN	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.17	1-CH3	3-CN	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.18	1-CH3	3-CN	4-H	5-SO2CH2CH2CH-CF2
IX.19	1-CH3	3-SO2F	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.20	1-CH3	3-SO2F	4-H	5-SOCH2CH2CH-CF2
IX.21	1-CH3	3-SO2F	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.22	1-CH3	3-SO2NH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.23	1-CH3	3-SO2NH2	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.24	1-CH3	3-SO2NH2	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.25	1-CH3	3-H		5-SCH2CH2CH=CF2
IX.26	1-CH3	3-H	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.27	1-CH3	3-H	4-H	5-SO2CH2CH=CF2
IX.28	1-CH3	3-H	4-Cl	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.29	1-CH3	3-H	4-Cl	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.30	1-CH3	3-H	4-Cl	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.31	1-CH3	3-H	4-Br	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.32	1-CH3	3-H	4-Br	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.33	1-CH3	3-H	4-Br	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.34	1-CH3	3-H	4-COOC2H5	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.35	1-CH3	3-H	4-COOC2H5	5-SOCH2CH2CH=CF2

IX.36	1-CH3	3-H	4-COOC2H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.37	1-CH3	3-H	4-COOCH(CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.38	1-CH3	3-H	4-COOCH(CH3)2	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.39	1-CH3	3-H	4-COOCH(CH3)2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.40	1-CH3	3-H	4-COOH	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.41	1-CH3	3-H	4-COOH	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.42	1-CH3	3-H	4-COOH	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.43	1-CH3	3-H	4-CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.44	1-CH3	3-H	4-CONH2	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.45	1-CH3	3-H	4-CONH2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.46	1-CH3	3-H	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.47	1-CH3	3-H	4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.48	1-CH3	3-H	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.49	1-CH3	3-H	4-SO2F	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.50	1-CH3	3-H	4-SO2F	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.51	1-CH3	3-H	4-SO2F	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.52	1-CH3	3-H	4-SO2NH2	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.53	1-CH3	3-H	4-SO2NH2	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.54	1-CH3	3-H	4-SO2NH2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.55	1-CH3	3-CH3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.56	1-CH3	3-CH3	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.57	1-CH3	3-CH3	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2

IX.58	1-CH3	3-CH3	4-Cl	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.59	1-CH3	3-CH3	4-Cl	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.60	1-CH3	3-CH3	4-Cl	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.61	1-CH3	3-CH3	4-I	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.62	1-CH3	3-CH3	4-I	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.63	1-CH3	3-CH3	4-I	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.64	1-CH3	3-CH3	4-COOC2H5	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.65	1-CH3	3-CH3	4-COOC2H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.66	1-CH3	3-CH3	4-COOC2H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.67	1-CH3	3-CH3	4-COOH	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.68	1-CH3	3-CH3	4-COOH	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.69	1-CH3	3-CH3	4-COOH	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.70	1-CH3	3-CH3	4-CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.71	1-CH3	3-CH3	4-CONH2	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.72	1-CH3	3-CH3	4-CONH2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.73	1-CH3	3-CH3	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.74	1-CH3	3-CH3	4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.75	1-CH3	3-CH3	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.76	1-CH3	3-CH3	4-SO2F	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.77	1-CH3	3-CH3	4-SO2F	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.78	1-CH3	3-CH3	4-SO2F	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.79	1-CH3	3-CH3	4-SO2NH2	5-SCH2CH2CH=CF2

IX.80	1-CH3	3-CH3	4-SO2NH2	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.81	1-CH3	3-CH3	4-SO2NH2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.82	1-CH3	3-CH3	4-NO2	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.83	1-CH3	3-CH3	4-NO2	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.84	1-CH3	3-CH3	4-NO2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.85	1-CH3	3-CF3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.86	1-CH3	3-CF3	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.87	1-CH3	3-CF3	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.88	1-CH3	3-C6H5	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.89	1-CH3	3-C6H5	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.90	1-CH3	3-C6H5	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.91	1-CH3	3-C6H5	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.92	1-CH3	3-C6H5	4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.93	1-CH3	3-C6H5	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.94	1-CH3	3-SCH2CH2CH=CF2	4-CN	5-H
IX.95	1-CH3	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-CN	5-H
IX.96	1-CH3	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-CN	5-H
IX.97	1-CH3	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
IX.98	1-CH3	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
IX.99	1-CH3	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-Cl
IX.100	1-CH3	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
IX.101	1-CH3	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN

IX.102	1-CH3	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-CN
IX.103	1-CH3	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOC2H5
IX.104	1-CH3	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOC2H5
IX.105	1-CH3	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-COOC2H5
IX.106	1-CH3	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CF3
IX.107	1-CH3	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CF3
IX.108	1-CH3	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-CF3
IX.109	1-CH2COOH	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CH3
IX.110	1-CH2COOH	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-CH3
IX.111	1-CH2COOH	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-CH3
IX.112	1-CH2COOC2H5	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-C6H5
IX.113	1-CH2COOC2H5	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-C6H5
IX.114	1-CH2COOC2H5	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-C6H5
IX.115	1-CH2CN	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-(2-チエニル)
IX.116	1-CH2CN	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-(2-チエニル)
IX.117	1-CH2CN	3-SO2CH2CH2C=CF2	4-H	5-(2-チエニル)
IX.118	1-C6H5	3-H	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.119	1-C6H5	3-H	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.120	1-C6H5	3-H	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.121	1-C6H5	3-H	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.122	1-C6H5	3-H	4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.123	1-C6H5	3-H	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2

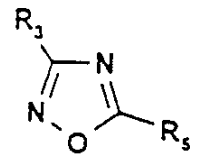
IX.124	1-C6H5	3-H	4-COOC2H5	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.125	1-C6H5	3-H	4-COOC2H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.126	1-C6H5	3-H	4-COOC2H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.127	1-C6H5	3-H	4-COOH	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.128	1-C6H5	3-H	4-COOH	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.129	1-C6H5	3-H	4-COOH	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.130	1-C6H5	3-H	4-Cl	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.131	1-C6H5	3-H	4-Cl	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.132	1-C6H5	3-H	4-Cl	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.133	1-C6H5	3-H	4-SO2F	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.134	1-C6H5	3-H	4-SO2F	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.135	1-C6H5	3-H	4-SO2F	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.136	1-C6H5	3-CH3	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.137	1-C6H5	3-CH3	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.138	1-C6H5	3-CH3	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.139	1-C6H5	3-CH3	4-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.140	1-C6H5	3-CH3	4-CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.141	1-C6H5	3-CH3	4-CN	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.142	1-C6H5	3-CH3	4-COOC2H5	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.143	1-C6H5	3-CH3	4-COOC2H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.144	1-C6H5	3-CH3	4-COOC2H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.145	1-C6H5	3-CH3	4-COOH	5-SCH2CH2CH=CF2

IX.146	1-C6H5	3-CH3	4-COOH	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.147	1-C6H5	3-CH3	4-COOH	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.148	1-C6H5	3-CH3	4-Cl	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.149	1-C6H5	3-CH3	4-Cl	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.150	1-C6H5	3-CH3	4-Cl	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.151	1-C6H5	3-CH3	4-SO2F	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.152	1-C6H5	3-CH3	4-SO2F	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.153	1-C6H5	3-CH3	4-SO2F	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.154	1-C6H5	3-Cl	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.155	1-C6H5	3-Cl	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.156	1-C6H5	3-Cl	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.157	1-C6H5	3-COOC2H5	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.158	1-C6H5	3-COOC2H5	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.159	1-C6H5	3-COOC2H5	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.160	1-C6H5	3-COOH	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.161	1-C6H5	3-COOH	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.162	1-C6H5	3-COOH	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.163	1-C6H5	3-CONH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.164	1-C6H5	3-CONH2	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.165	1-C6H5	3-CONH2	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.166	1-C6H5	3-CN	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.167	1-C6H5	3-CN	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2

IX.168	1-C6H5	3-CN	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.169	1-C6H5	3-SO2F	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.170	1-C6H5	3-SO2F	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.171	1-C6H5	3-SO2F	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.172	1-C6H5	3-SO2NH2	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2
IX.173	1-C6H5	3-SO2NH2	4-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
IX.174	1-C6H5	3-SO2NH2	4-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
IX.175	1-CH3	3-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
IX.176	1-CH3	3-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-CN
IX.177	1-CH3	3-H	4-SO2CH2CH2C=CF2	5-CN
IX.178	1-CH3	3-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-COOC2H5
IX.179	1-CH3	3-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-COOC2H5
IX.180	1-CH3	3-H	4-SO2CH2CH2C=CF2	5-COOC2H5
IX.181	1-CH3	3-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
IX.182	1-CH3	3-H	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-CF3
IX.183	1-CH3	3-H	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CF3
IX.184	1-CH3	3-CN	4-SCH2CH2CH=CF2	5-H
IX.185	1-CH3	3-CN	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-H
IX.186	1-CH3	3-CN	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H
IX.187	1-CH3	3-COOC2H5	4-SCH2CH2CH=CF2	5-H
IX.188	1-CH3	3-COOC2H5	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-H
IX.189	1-CH3	3-COOC2H5	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H

IX.190	1-CH3	3-CF3	4-SCH2CH2CH=CF2	5-H	
IX.191	1-CH3	3-CF3	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	
IX.192	1-CH3	3-CF3	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	

本発明による式（Ｘ）の化合物の例を表Ｘに挙げる。



表X

No.	R3	R5
X1	3-c-C3H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X2	3-C≡CH	5-SCH2CH2CH=CF2
X3	3-C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X4	3-C6H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
X5	3-C6H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X6	3-CF2H	5-SCH2CH2CH=CF2
X7	3-CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
X8	3-CH(CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
X9	3-CH=CH2	5-SCH2CH2CH=CF2
X10	3-CH2Br	5-SCH2CH2CH=CF2
X11	3-CH2C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X12	3-CH2C6H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
X13	3-CH2CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
X14	3-CH2CF3	5-SOCH2CH2CH=CF2
X15	3-CH2CF3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X16	3-CH2CH=CH2	5-SCH2CH2CH=CF2
X17	3-CH2CH2F	5-SCH2CH2CH=CF2
X18	3-CH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X19	3-CH2CN	5-SCH2CH2CH=CF2
X20	3-CH2CN	5-SOCH2CH2CH=CF2
X21	3-CH2CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
X22	3-CH2COOCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X23	3-CH2N(CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
X24	3-CH2NHCOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X25	3-CH2NHCOOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X26	3-CH2OCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X27	3-CH2OCH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2

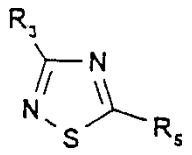
X.28	3-CH2OH	5-SCH2CH2CH=CF2
X.29	3-CH2OH	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.30	3-CH2SO2C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X.31	3-CH2SO2C6H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.32	3-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.33	3-CH3	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.34	3-CH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.35	3-COC6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X.36	3-COCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.37	3-CON(CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.38	3-CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.39	3-CONHCH2C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X.40	3-CONHCH2C6H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.41	3-CONHCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.42	3-CONHCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.43	3-CONHSO2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.44	3-COOC6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X.45	3-COOC6H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.46	3-COOC6H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.47	3-COOCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.48	3-COOCH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.49	3-COOCH2CH2CH=CF2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.50	3-COOCH2CH2F	5-SCH2CH2CH=CF2
X.51	3-COOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.52	3-COOH	5-SCH2CH2CH=CF2
X.53	3-COSCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.54	3-CSNH2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.55	3-H	5-SCH2CH2CH=CF2
X.56	3-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.57	3-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.58	3-N(SO2CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.59	3-NHCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.60	3-NHCHO	5-SCH2CH2CH=CF2

X.61	3-NHCOOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.62	3-NHCOCF3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.63	3-NHCOCF3	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.64	3-NHCOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.65	3-NHCOCH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.66	3-NHCSCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.67	3-NHCSNHCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.68	3-NHSO2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.69	3-OCF2CF2H	5-SCH2CH2CH=CF2
X.70	3-OCF3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.71	3-OCF3	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.72	3-OCH2C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X.73	3-OCH2C6H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.74	3-OCH2CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.75	3-OCH2CF3	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.76	3-OCH2CF3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.77	3-OCH2CH=CCl2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.78	3-OCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.79	3-OCH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.80	3-OCH2CH2CH=CF2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.81	3-OCH2CH2F	5-SCH2CH2CH=CF2
X.82	3-OCH2COOH	5-SCH2CH2CH=CF2
X.83	3-OCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.84	3-OCOC6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X.85	3-OCOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.86	3-OC6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
X.87	3-OC6H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.88	3-OC6H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.89	3-OSO2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.90	3-OSO2CH3	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.91	3-SCF3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.92	3-SCH2CH2CH=CF2	5-C6H5
X.93	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-C6H5

X.94	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-C6H5
X.95	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CF2H
X.96	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
X.97	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5
X.98	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5
X.99	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CF3
X.100	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2F
X.101	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2Cl
X.102	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CN
X.103	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH3
X.104	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OH
X.105	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3
X.106	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH3
X.107	3-SCH2CH2CH=CF2	5-Cl
X.108	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
X.109	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CON(CH3)2
X.110	3-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2CH=CF2
X.111	3-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2F
X.112	3-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
X.113	3-SCH2CH2CH=CF2	5-F
X.114	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H
X.115	3-SCH2CH2CH=CF2	5-N(SO2CH3)2
X.116	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCHO
X.117	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOCF3
X.118	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOOCH3
X.119	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHSO2CH3
X.120	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NO2
X.121	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OC6H5
X.122	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCF2H
X.123	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCF3
X.124	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
X.125	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
X.126	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3

X.127	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCOCH3
X.128	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OSO2CH3
X.129	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.130	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.131	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.132	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH3
X.133	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2CF3
X.134	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.135	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.136	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2CH3
X.137	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SO2CH3
X.138	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2N(CH3)2
X.139	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SOCF3
X.140	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.141	3-SCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.142	3-SO2CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.143	3-SO2CF3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.144	3-SO2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.145	3-SO2N(CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.146	3-SO2NH2	5-SCH2CH2CH=CF2
X.147	3-SO2NHCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.148	3-SO2NHCH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.149	3-SOCF3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.150	3-SOCF3	5-SOCH2CH2CH=CF2
X.151	3-SOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
X.152	3-SOCH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.153	3-(4-CF3-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
X.154	3-(4-CF3-C6H4)	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.155	3-(4-CH3-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
X.156	3-(4-CN-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
X.157	3-(4-CONH2-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
X.158	3-(4-CONH2-C6H4)	5-SO2CH2CH2CH=CF2
X.159	3-(4-NO2-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
X.160	3-(4-OCH3-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2

本発明による式（ＸＩ）の化合物の例を表ＸＩに挙げる。



表ＸＩ

No.	R3	R5
XI.1	3-Br	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.2	3-c-C5H9	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.3	3-c-C5H9	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.4	3-C≡CH	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.5	3-C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.6	3-C6H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.7	3-C6H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.8	3-CF2H	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.9	3-CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.10	3-CH=CH2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.11	3-CH=CHCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.12	3-CH=CHCN	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.13	3-CH=CHNO2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.14	3-CH=NOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.15	3-CH2(3-CF3-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.16	3-CH2(3-CF3-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.17	3-CH2C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.18	3-CH2C6H5	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.19	3-CH2C6H5	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.20	3-CH2CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.21	3-CH2CF3	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.22	3-CH2CH=CH2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.23	3-CH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.24	3-CH2CH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.25	3-CH2Cl	5-SCH2CH2CH=CF2

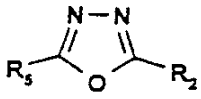
XI.26	3-CH2CN	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.27	3-CH2CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.28	3-CH2N(CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.29	3-CH2NHCOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.30	3-CH2OCH2CH2CH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.31	3-CH2OCH2CH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.32	3-CH2OCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.33	3-CH2OCH2CH3	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.34	3-CH2OCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.35	3-CH2OCH3	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.36	3-CH2OCH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.37	3-CH2OH	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.38	3-CH2SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.39	3-CH2SO2C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.40	3-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.41	3-CH3	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.42	3-CH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.43	3-Cl	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.44	3-Cl	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.45	3-CN	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.46	3-COC6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.47	3-COCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.48	3-CON(CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.49	3-CON(CH3)C2H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.50	3-CONH2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.51	3-CONHCH2C6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.52	3-CONHCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.53	3-CONHCH2CH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.54	3-CONHCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.55	3-CONHCH3	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.56	3-CONHCH3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.57	3-CONHSO2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.58	3-COOC6H5	5-SCH2CH2CH=CF2

XI.59	3-COOCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.60	3-COOCH2CH2F	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.61	3-COOCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.62	3-COOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.63	3-COOH	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.64	3-COSCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.65	3-CSNH2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.66	3-F	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.67	3-H	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.68	3-H	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.69	3-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.70	3-N(SO2CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.71	3-NHCHO	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.72	3-NHCOC2H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.73	3-NHCOCF3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.74	3-NHCOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.75	3-NHCSCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.76	3-NHCSNHCH2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.77	3-NHSO2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.78	3-NO2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.79	3-OC6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.80	3-OCF2CF2H	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.81	3-OCF2H	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.82	3-OCF3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.83	3-OCH2CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.84	3-OCH2CF3	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.85	3-OCH2CF3	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.86	3-OCH2CH=CCl2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.87	3-OCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.88	3-OCOC2H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.89	3-OCOC6H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.90	3-OCOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.91	3-OSO2CH3	5-SCH2CH2CH=CF2

XI.92	3-SCF3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.93	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
XI.94	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5
XI.95	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CF3
XI.96	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH=CH2
XI.97	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CN
XI.98	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CONH2
XI.99	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2NHCOCH3
XI.100	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH3
XI.101	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3
XI.102	3-SCH2CH2CH=CF2	5-Cl
XI.103	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CN
XI.104	3-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
XI.105	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCHO
XI.106	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OC6H5
XI.107	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
XI.108	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH3
XI.109	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.110	3-SCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.111	3-SO2C2H5	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.112	3-SO2CF3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.113	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
XI.114	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.115	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.116	3-SO2F	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.117	3-SO2N(CH3)2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.118	3-SO2NH2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.119	3-SO2NHCH3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.120	3-SOCF3	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.121	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2CN
XI.122	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
XI.123	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.124	3-SOCH3	5-SCH2CH2CH=CF2

XI.125	3-(2-ピラジニル)	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.126	3-(3-F-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.127	3-(3-NO2-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.128	3-(3-NO2-C6H4)	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.129	3-(3-NO2-C6H4)	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XI.130	3-(4-F-C6H4)	5-SCH2CH2CH=CF2
XI.131	3-(4-F-C6H4)	5-SOCH2CH2CH=CF2
XI.132	3-(4-F-C6H4)	5-SO2CH2CH2CH=CF2

本発明による式（ＸＩＩ）の化合物の例を表ＸＩＩに挙げる。



表ＸＩＩ

No.	R2	R5
XII.1	2-SCH2CH2CH=CF2	5-c-C3H5
XII.2	2-SCH2CH2CH=CF2	5-C≡CH
XII.3	2-SCH2CH2CH=CF2	5-C6H5
XII.4	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-C6H5
XII.5	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-C6H5
XII.6	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CF2H
XII.7	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
XII.8	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH(CH3)2
XII.9	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH(CH3)2
XII.10	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH=CH2
XII.11	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2(2,6-ジF-C6H3)
XII.12	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2(4-NO2-C6H4)
XII.13	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2(4-NO2-C6H4)
XII.14	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2(4-OCH3-C6H4)
XII.15	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2(4-OCH3-C6H4)
XII.16	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2Br
XII.17	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5
XII.18	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5

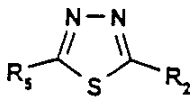
XII.19	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5
XII.20	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CF3
XII.21	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2CF3
XII.22	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2CF3
XII.23	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH(CH3)2
XII.24	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH=CH2
XII.25	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH2CH2CH3
XII.26	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH2CH2CH3
XII.27	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH2CH2CH3
XII.28	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH2CH3
XII.29	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH2CH3
XII.30	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH2CH3
XII.31	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH3
XII.32	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH3
XII.33	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH3
XII.34	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2F
XII.35	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH3
XII.36	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CN
XII.37	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2CN
XII.38	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CONH2
XII.39	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2COOCH2CH3
XII.40	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2N(CH3)2
XII.41	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2NHCOCH3
XII.42	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2NHCOOCH3
XII.43	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH3
XII.44	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH3
XII.45	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OH
XII.46	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2OH
XII.47	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2SO2C6H5
XII.48	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2SO2C6H5
XII.49	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3
XII.50	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH3
XII.51	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH3

XII.52	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COC6H5
XII.53	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COCH3
XII.54	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CON(CH3)2
XII.55	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONH2
XII.56	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH2C6H5
XII.57	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH2C6H5
XII.58	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH2CH2CH=CF2
XII.59	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH3
XII.60	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHSO2CH3
XII.61	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOC6H5
XII.62	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-COOC6H5
XII.63	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-COOC6H5
XII.64	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2CH=CF2
XII.65	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2CH=CF2
XII.66	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2CH=CF2
XII.67	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2F
XII.68	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH3
XII.69	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
XII.70	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOH
XII.71	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COSCH2CH2CH=CF2
XII.72	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CSNH2
XII.73	2-SCH2CH2CH=CF2	5-H
XII.74	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-H
XII.75	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H
XII.76	2-SCH2CH2CH=CF2	5-N(SO2CH3)2
XII.77	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCH2CH3
XII.78	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCHO
XII.79	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOOCH3
XII.80	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOCF3
XII.81	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-NHCOCF3
XII.82	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOCH3
XII.83	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-NHCOCH3
XII.84	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCSCH2CH3

XII.85	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCSNHCH2CH3
XII.86	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHSO2CH3
XII.87	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCF2CF2H
XII.88	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCF3
XII.89	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCF3
XII.90	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2C6H5
XII.91	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2C6H5
XII.92	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
XII.93	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
XII.94	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
XII.95	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH=CCl2
XII.96	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2CH=CF2
XII.97	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2CH=CF2
XII.98	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2CH=CF2
XII.99	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2F
XII.100	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2COOH
XII.101	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH3
XII.102	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCOC6H5
XII.103	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCOCH3
XII.104	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OC6H5
XII.105	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OC6H5
XII.106	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OC6H5
XII.107	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OSO2CH3
XII.108	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OSO2CH3
XII.109	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCF3
XII.110	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XII.111	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH3
XII.112	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2CF3
XII.113	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SO2CF3
XII.114	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XII.115	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XII.116	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2CH3
XII.117	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2N(CH3)2

XII.118	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2NH2
XII.119	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2NHCH3
XII.120	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SO2NHCH3
XII.121	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SOCF3
XII.122	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-SOCF3
XII.123	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
XII.124	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
XII.125	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
XII.126	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SOCH3
XII.127	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SOCH3
XII.128	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(2-CH3-C6H4)
XII.129	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-(2-CH3-C6H4)
XII.130	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-(2-CH3-C6H4)
XII.131	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(2-フリル)
XII.132	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(2-OCH3-C6H4)
XII.133	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(2-チオフェニル)
XII.134	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(3-フリル)
XII.135	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-CF3-C6H4)
XII.136	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-(4-CF3-C6H4)
XII.137	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-CH3-C6H4)
XII.138	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-CN-C6H4)
XII.139	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-CONH2-C6H4)
XII.140	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-(4-CONH2-C6H4)
XII.141	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-NO2-C6H4)
XII.142	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-(4-NO2-C6H4)
XII.143	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-(4-NO2-C6H4)
XII.144	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-OCH3-C6H4)
XII.145	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-(4-OCH3-C6H4)
XII.146	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-(4-OCH3-C6H4)
XII.147	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-OH-C6H4)
XII.148	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-ピリジニル)

本発明による式（ＸＩＩＩ）の化合物の例を表ＸＩＩＩに挙げる。



表ＸＩＩＩ

No.	R2	R5
XIII.1	2-SCH2CH2CH=CF2	5-Br
XIII.2	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-Br
XIII.3	2-SCH2CH2CH=CF2	5-C(CH3)3
XIII.4	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-C(CH3)3
XIII.5	2-SCH2CH2CH=CF2	5-C(O)C6H5
XIII.6	2-SCH2CH2CH=CF2	5-c-C3H5
XIII.7	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-c-C3H5
XIII.8	2-SCH2CH2CH=CF2	5-C≡CH
XIII.9	2-SCH2CH2CH=CF2	5-C6H5
XIII.10	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-C6H5
XIII.11	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-C6H5
XIII.12	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CF2H
XIII.13	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CF2H
XIII.14	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3
XIII.15	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CF3
XIII.16	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH(CH3)2
XIII.17	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH(CH3)2
XIII.18	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH=CH2
XIII.19	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2Br
XIII.20	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5
XIII.21	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5
XIII.22	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5
XIII.23	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CF3
XIII.24	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2F
XIII.25	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2F
XIII.26	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2F
XIII.27	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH3

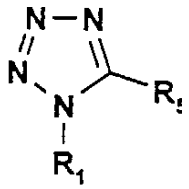
XIII.28	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH3
XIII.29	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2CH3
XIII.30	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CHCH2
XIII.31	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CN
XIII.32	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CONH2
XIII.33	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2COOCH2CH3
XIII.34	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2N(CH3)2
XIII.35	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH3
XIII.36	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH3
XIII.37	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH3
XIII.38	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OH
XIII.39	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2SO2C6H5
XIII.40	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3
XIII.41	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH3
XIII.42	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH3
XIII.43	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COCH3
XIII.44	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CON(CH3)2
XIII.45	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONH2
XIII.46	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH2C6H5
XIII.47	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH2CH2CH=CF2
XIII.48	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH2CH2CH=CF2
XIII.49	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CONHCH2CH2CH=CF2
XIII.50	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH3
XIII.51	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHSO2CH3
XIII.52	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CONHSO2CH3
XIII.53	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOC6H5
XIII.54	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-COOC6H5
XIII.55	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2CH=CF2
XIII.56	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2CH=CF2
XIII.57	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2CH=CF2
XIII.58	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2F
XIII.59	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH3
XIII.60	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COOH

XIII.61	2-SCH2CH2CH=CF2	5-COSCH2CH2CH=CF2
XIII.62	2-SCH2CH2CH=CF2	5-CSNH2
XIII.63	2-SCH2CH2CH=CF2	5-H
XIII.64	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-H
XIII.65	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H
XIII.66	2-SCH2CH2CH=CF2	5-N(CH3)2
XIII.67	2-SCH2CH2CH=CF2	5-N(SO2CH3)2
XIII.68	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-N(SO2CH3)2
XIII.69	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NH2
XIII.70	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCH3
XIII.71	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-NHCH3
XIII.72	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-NHCH3
XIII.73	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCHO
XIII.74	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-NHCHO
XIII.75	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOCF3
XIII.76	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-NHCOCF3
XIII.77	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOCH3
XIII.78	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOOCH3
XIII.79	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-NHCOOCH3
XIII.80	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCSCH2CH3
XIII.81	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCSNHCH2CH3
XIII.82	2-SCH2CH2CH=CF2	5-NHSO2CH3
XIII.83	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-NHSO2CH3
XIII.84	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OC6H5
XIII.85	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OC6H5
XIII.86	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OC6H5
XIII.87	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCF2CF2H
XIII.88	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCF3
XIII.89	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCF3
XIII.90	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCF3
XIII.91	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2C6H5
XIII.92	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
XIII.93	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3

XIII.94	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3
XIII.95	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH=CCl2
XIII.96	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2CH=CF2
XIII.97	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2CH=CF2
XIII.98	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2CH=CF2
XIII.99	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2F
XIII.100	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2COOCH3
XIII.101	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH3
XIII.102	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCH3
XIII.103	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH3
XIII.104	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCOC6H5
XIII.105	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OCOCH3
XIII.106	2-SCH2CH2CH=CF2	5-OSO2CH3
XIII.107	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-OSO2CH3
XIII.108	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OSO2CH3
XIII.109	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCF3
XIII.110	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2(3-CF3C6H4)
XIII.111	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-SCH2(3-CF3C6H4)
XIII.112	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SCH2(3-CF3C6H4)
XIII.113	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2(4-CF3-C6H4)
XIII.114	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2(c-C3H5)
XIII.115	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2C≡CH
XIII.116	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH=CH2
XIII.117	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XIII.118	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2
XIII.119	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH3
XIII.120	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-SCH3
XIII.121	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SCH3
XIII.122	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SH
XIII.123	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XIII.124	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SO2CH2CH2CH=CF2
XIII.125	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2CH3
XIII.126	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SO2CH3

XIII.127	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2N(CH3)2
XIII.128	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2NH2
XIII.129	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2NHCH3
XIII.130	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SOCF3
XIII.131	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-SOCF3
XIII.132	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
XIII.133	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
XIII.134	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-SOCH2CH2CH=CF2
XIII.135	2-SCH2CH2CH=CF2	5-SOCH3
XIII.136	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-CF3-C6H4)
XIII.137	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-(4-CF3-C6H4)
XIII.138	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-CH3-C6H4)
XIII.139	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-(4-CH3-C6H4)
XIII.140	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-CN-C6H4)
XIII.141	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-(4-CN-C6H4)
XIII.142	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-CONH2-C6H4)
XIII.143	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-H2NSO2-C6H4)
XIII.144	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-NO2-C6H4)
XIII.145	2-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-OCH3-C6H4)
XIII.146	2-SOCH2CH2CH=CF2	5-(4-OCH3-C6H4)
XIII.147	2-SO2CH2CH2CH=CF2	5-(4-OCH3-C6H4)

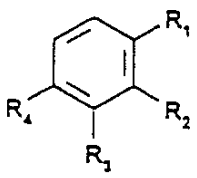
本発明による式（ＸＩＶ）の化合物の例を表ＸＩＶに挙げる。



表ＸＩＶ

No.	R1	R5
XIV.1	1-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2

本発明による式（ＸＶ）の化合物の例を表ＸＶに挙げる。

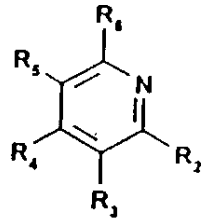


表ＸＶ

No.	R1	R2	R3	R4
XV.1	1-SCH2CH2CH=CF2	2-H	3-H	4-NO2

本発明による式（ＸＶＩ）の化合物の例を表ＸＶＩに挙げる。

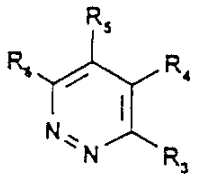
表ＸＶＩ



No.	R2	R3	R4	R5	R6
XVI.1	2-Cl	3-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-H
XVI.2	2-F	3-F	4-SCH2CH2CH=CF2	5-F	6-F
XVI.3	2-F	3-F	4-SOCH2CH2CH=CF2	5-F	6-F
XVI.4	2-F	3-F	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-F	6-F
XVI.5	2-H	3-H	4-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-H
XVI.6	2-H	3-H	4-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	6-H
XVI.7	2-SCH2CH2CH=CF2	3-CF3	4-H	5-H	6-H
XVI.8	2-SCH2CH2CH=CF2	3-CN	4-H	5-H	6-H
XVI.9	2-SCH2CH2CH=CF2	3-CONH2	4-H	5-H	6-H
XVI.10	2-SCH2CH2CH=CF2	3-COOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H	6-H
XVI.11	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CF3	6-H
XVI.12	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CF3	6-H
XVI.13	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-Cl	6-H
XVI.14	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-Cl	6-H
XVI.15	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CN	6-H
XVI.16	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CN	6-H

XVI.17	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-CONH2	6-H	
XVI.18	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-COOH	6-H	
XVI.19	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-H	6-H	
XVI.20	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-H	6-H	
XVI.21	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-NO2	6-H	
XVI.22	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-SCH2CH2CH=CF2	6-H	
XVI.23	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	4-H	5-H	6-F	
XVI.24	2-SCH2CH2CH=CF2	3-NO2	4-H	5-H	6-H	

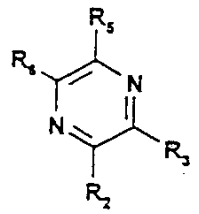
本発明による式（ＸＶＩＩ）の化合物の例を表ＸＶＩＩに挙げる。



表ＸＶＩＩ

No.	R3	R4	R5	R6
XVII.1	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H	6-CH3
XVII.2	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H	6-Cl
XVII.3	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H	6-OCH3
XVII.4	3-SCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H	6-C6H5
XVII.5	3-SOCH2CH2CH=CF2	4-H	5-H	6-C6H5
XVII.6	3-SO2CH2CH2CH=CF2	4-H	5-H	6-C6H5
XVII.7	3-SCH2CH2CH=CF2	-CH=CH-CH=CH-		6-H

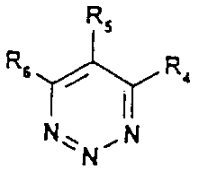
本発明による式（ＸＶＩＩＩ）の化合物の例を表ＸＶＩＩＩに挙げる。



表ＸＶＩＩＩ

No.	R2	R3	R5	R6
XVIII.1	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	-CH=CH-CH=CH-	
XVIII.2	2-SOCH2CH2CH=CF2	3-H	-CH=CH-CH=CH-	
XVIII.3	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	-CH=CH-CH=CH-	
XVIII.4	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	-CH=C(Cl)CH=CH-	
XVIII.5	2-SOCH2CH2CH=CF2	3-H	-CH=C(Cl)CH=CH-	
XVIII.6	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	-CH=C(Cl)CH=CH-	
XVIII.7	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	5-H	6-H
XVIII.8	2-SOCH2CH2CH=CF2	3-H	5-H	6-H
XVIII.9	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	5-H	6-H
XVIII.10	2-SCH2CH2CH=CF2	3-Cl	5-H	6-H
XVIII.11	2-SOCH2CH2CH=CF2	3-Cl	5-H	6-H
XVIII.12	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-Cl	5-H	6-H
XVIII.13	2-SCH2CH2CH=CF2	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-H
XVIII.14	2-SCH2CH2CH=CF2	3-H	5-H	6-Cl
XVIII.15	2-SOCH2CH2CH=CF2	3-H	5-H	6-Cl
XVIII.16	2-SO2CH2CH2CH=CF2	3-H	5-H	6-Cl

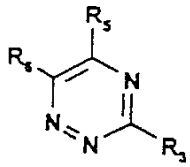
本発明による式（ＸＩＸ）の化合物の例を表ＸＩＸに挙げる。



表ＸＩＸ

No.	R4	R5	R6
XIX.1	4-SCH2CH2CH=CF2	-CH=CH-CH=CH-	

本発明による式（ＸＸ）の化合物の例を表ＸＸに挙げる。



表ＸＸ

No.	R3	R5	R6
XX.1	3-SCH2CH2CH=CF2	5-Br	6-H
XX.2	3-SCH2CH2CH=CF2	5-c-C3H5	6-H
XX.3	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-c-C3H5	6-H
XX.4	3-SCH2CH2CH=CF2	5-C6H5	6-CH3
XX.5	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-C6H5	6-CH3
XX.6	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-C6H5	6-CH3
XX.7	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-C6H5	6-CN
XX.8	3-SCH2CH2CH=CF2	5-C6H5	6-H
XX.9	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-C6H5	6-H
XX.10	3-SCH2CH2CH=CF2	5-(4-F-C6H4)	6-H
XX.11	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-(4-F-C6H4)	6-H
XX.12	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CF2H	6-CH3
XX.13	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CF3	6-H
XX.14	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-CF3	6-OC6H5
XX.15	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH(CH3)2	6-H

XX.16	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH=CH2	6-H
XX.17	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH=CHCN	6-H
XX.18	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH=CHNO2	6-H
XX.19	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH=NOCH3	6-CH3
XX.20	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2C≡CH	6-H
XX.21	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5	6-H
XX.22	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2C6H5	6-H
XX.23	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CF3	6-H
XX.24	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH=CH2	6-H
XX.25	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH2CH3	6-H
XX.26	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH2CH3	6-H
XX.27	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH3	6-H
XX.28	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2CH3	6-H
XX.29	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH2F	6-H
XX.30	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CH3	6-H
XX.31	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CN	6-CH3
XX.32	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2CONH2	6-H
XX.33	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2N(CH3)2	6-CH3
XX.34	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2NHCOCH3	6-H
XX.35	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH2CH3	6-H
XX.36	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH2CH3	6-H
XX.37	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OCH3	6-CH3
XX.38	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2OH	6-H
XX.39	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH2SO2C6H5	6-H
XX.40	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CF2H
XX.41	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CH=CH2
XX.42	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CH2CH2F
XX.43	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CH2CN
XX.44	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CH2N(CH3)2
XX.45	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CH2OH
XX.46	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CH3
XX.47	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CONH2
XX.48	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CONHCH3

XX.49	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-CONHSO2CH3
XX.50	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-COOCH2CH3
XX.51	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-COOCH3
XX.52	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-H
XX.53	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-H
XX.54	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-H
XX.55	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-NHCHO
XX.56	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-NHCOCH3
XX.57	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-NHCONH2
XX.58	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-OCF2H
XX.59	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-OCH2CF3
XX.60	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-OCH2CH2F
XX.61	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-OCOCH3
XX.62	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-OSO2CH3
XX.63	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-SO2NH2
XX.64	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CH3	6-SOCH3
XX.65	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CHCl2	6-H
XX.66	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CHO	6-CH3
XX.67	3-SCH2CH2CH=CF2	5-Cl	6-H
XX.68	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-Cl	6-H
XX.69	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CN	6-H
XX.70	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-CN	6-H
XX.71	3-SCH2CH2CH=CF2	5-COCH3	6-H
XX.72	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CON(CH3)2	6-H
XX.73	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CONH2	6-H
XX.74	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH2C6H5	6-H
XX.75	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH2CH2CH=CF2	6-H
XX.76	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHCH3	6-H
XX.77	3-SCH2CH2CH=CF2	5-CONHSO2CH3	6-CH3
XX.78	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2CH=CF2	6-H
XX.79	3-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH2F	6-H
XX.80	3-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH2CH3	6-H
XX.81	3-SCH2CH2CH=CF2	5-COOCH3	6-CH3

XX.82	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-COOCH3	6-H
XX.83	3-SCH2CH2CH=CF2	5-COOH	6-H
XX.84	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-COOH	6-H
XX.85	3-SCH2CH2CH=CF2	5-F	6-H
XX.86	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-(1-CH3-cC3H4)
XX.87	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-(4-F-C6H4)
XX.88	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	6-(4-F-C6H4)
XX.89	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-Br
XX.90	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-C(CH3)3
XX.91	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-c-C3H5
XX.92	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-c-C5H9
XX.93	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-C≡CH
XX.94	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-C6H5
XX.95	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-C6H5
XX.96	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CF3
XX.97	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	6-CF3
XX.98	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH(CH3)2
XX.99	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH=CHCN
XX.100	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH=CHNO2
XX.101	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH=NOCH3
XX.102	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2(4-CF3-C6H4)
XX.103	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2C≡CH
XX.104	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2C6H5
XX.105	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2C6H5
XX.106	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2CF3
XX.107	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2CH=CH2
XX.108	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2CH2CH2CH3
XX.109	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2CH2CH3
XX.110	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2CH3
XX.111	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2CONH2
XX.112	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2NHCOCH3
XX.113	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2OCH2CH3
XX.114	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2OCH3

XX.115	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH2SO2C6H5
XX.116	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH3
XX.117	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH3
XX.118	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	6-CH3
XX.119	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CHO
XX.120	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-Cl
XX.121	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-Cl
XX.122	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CN
XX.123	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-COCH3
XX.124	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CON(CH3)2
XX.125	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	6-CON(CH3)C2H5
XX.126	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CONHCH2C6H5
XX.127	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CONHCH2CH2CH=CF2
XX.128	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-CONHCH2CH2CH3
XX.129	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-COOC6H5
XX.130	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-COOCH2CH2CH=CF2
XX.131	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-COOCH2CH2F
XX.132	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-COOCH3
XX.133	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-COOCH3
XX.134	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-COOH
XX.135	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	6-COOH
XX.136	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-F
XX.137	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-H
XX.138	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHCH2CH3
XX.139	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHCH2CH3
XX.140	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHCOC2H5
XX.141	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHCOC6H5
XX.142	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHCOCF3
XX.143	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHCOCH3
XX.144	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHCOOCH3
XX.145	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHCSCH2CH3
XX.146	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHCSNHCH2CH3
XX.147	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NHSO2CH3

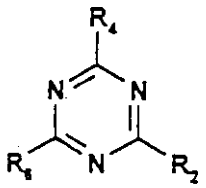
XX.148	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-NO2
XX.149	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OC4H9
XX.150	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OC5H11
XX.151	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OC6H5
XX.152	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OC6H5
XX.153	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCF2CF2H
XX.154	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCF3
XX.155	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCF3
XX.156	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH(CH3)C2H5
XX.157	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2(4-Cl-C6H4)
XX.158	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2(4-Cl-C6H4)
XX.159	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2C6H5
XX.160	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2CCl=CH2
XX.161	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2CH=CCl2
XX.162	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2CH=CH2
XX.163	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2CH=CH2
XX.164	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2CH2CH3
XX.165	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2CH2COOCH3
XX.166	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2CH2COOCH3
XX.167	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2CH2CH=CF2
XX.168	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2CH3
XX.169	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH2COOH
XX.170	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH3
XX.171	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCH3
XX.172	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCOC2H5
XX.173	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OCOC6H5
XX.174	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OH
XX.175	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-OH
XX.176	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-SCF3
XX.177	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-SCF3
XX.178	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-SCH2CH2CH3
XX.179	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-SCH2CH2CH=CF2
XX.180	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-SCH3

XX.181	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-H	6-SCH3
XX.182	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-SO2NHCH3
XX.183	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-SOCF3
XX.184	3-SCH2CH2CH=CF2	5-H	6-SOCH2CH2CH=CF2
XX.185	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NH2	6-CH3
XX.186	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-NHCH2CH3	6-C6H5
XX.187	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCH2CH3	6-H
XX.188	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCHO	6-H
XX.189	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOCF3	6-CH3
XX.190	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-NHCOCH3	6-C6H5
XX.191	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOCH3	6-H
XX.192	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCONH2	6-CH3
XX.193	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHCOOCH3	6-H
XX.194	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NHSO2CH3	6-CH3
XX.195	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NMe2	6-H
XX.196	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-NO2	6-C6H5
XX.197	3-SCH2CH2CH=CF2	5-NO2	6-H
XX.198	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OC6H5	6-H
XX.199	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-OC6H5	6-H
XX.200	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-OC6H5	6-NHCOCH3
XX.201	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCF2CF2H	6-CH3
XX.202	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCF2H	6-H
XX.203	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCF3	6-H
XX.204	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCF3	6-H
XX.205	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH(CH3)2	6-H
XX.206	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCH(CH3)C2H5	6-H
XX.207	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2(4-Cl-C6H4)	6-H
XX.208	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2(4-Cl-C6H4)	6-H
XX.209	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2C6H5	6-H
XX.210	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CCl=CH2	6-H
XX.211	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CF3	6-H
XX.212	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH=CH2	6-H
XX.213	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2COOCH3	6-CH3

XX.214	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2COOCH3	6-H
XX.215	3-SO2CH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2COOCH3	6-H
XX.216	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2CH=CF2	6-H
XX.217	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH2F	6-CH3
XX.218	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2CH3	6-H
XX.219	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2COOCH3	6-H
XX.220	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH2COOH	6-H
XX.221	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCH3	6-H
XX.222	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCOC2H5	6-H
XX.223	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-OCOC6H5	6-H
XX.224	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OCOCH3	6-CH3
XX.225	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-OH	6-C6H5
XX.226	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OH	6-CH3
XX.227	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OH	6-H
XX.228	3-SCH2CH2CH=CF2	5-OSO2CH3	6-H
XX.229	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SCF3	6-H
XX.230	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-SCF3	6-H
XX.231	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2	6-H
XX.232	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH3	6-H
XX.233	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH2CH2CH=CF2	6-H
XX.234	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SCH3	6-H
XX.235	3-SOCH2CH2CH=CF2	5-SCH3	6-H
XX.236	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2NH2	6-CH3
XX.237	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SO2NHCH3	6-H
XX.238	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SOCF3	6-H
XX.239	3-SCH2CH2CH=CF2	5-SOCH3	6-CH3
XX.240	3-CH3	5-CH3	6-SCH2CH2CH=CF2
XX.241	3-CH3	5-H	6-SCH2CH2CH=CF2
XX.242	3-CH3	5-OC4H9	6-SO2CH2CH2CH=CF2
XX.243	3-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2	6-CH3
XX.244	3-CH3	5-SCH2CH2CH=CF2	6-H
XX.245	3-H	5-CH3	6-SCH2CH2CH=CF2
XX.246	3-H	5-H	6-SCH2CH2CH=CF2

XX.247	3-H	5-SCH2CH2CH=CF2	6-CH3
XX.248	3-H	5-SCH2CH2CH=CF2	6-H
XX.249	3-H	5-SOCH2CH2CH=CF2	6-CH3
XX.250	3-H	5-SO2CH2CH2CH=CF2	6-CH3
XX.251	3-SCH2CH2CH=CF2	-(CH2CH2CH2CH2)-	
XX.252	3-SOCH2CH2CH=CF2	-(CH2CH2CH2CH2)-	
XX.253	3-SO2CH2CH2CH=CF2	-(CH2CH2CH2CH2)-	

本発明による式（ＸＸＩ）の化合物の例を表ＸＸＩに示す。



表ＸＸＩ

No.	R2	R4	R6
XXI.1	2-SCH2CH2CH=CF2	4-H	6-H

ｎが０である式（Ｉ）の化合物は種々の方法で製造することができる。
それらは、たとえば対応する式（ＸＸＩＩＩ）のチオール化合物と式（ＸＸＩＶ）の適宜なジフルオロブト－１－エンアルキル化剤（式中のＬは良好な脱離基である）の反応により製造しうる。この反応は好ましくは、緩和な塩基、たとえばアルカリ金属炭酸塩、たとえば炭酸ナトリウムまたはカリウムの存在下に、不活性溶剤中で０－２００℃の温度において実施される。この範囲内に沸点を有する適切な不活性溶剤、たとえばアセトンの還流温度で反応を実施するのが好都合である。
式（ＸＸＩＶ）において脱離基Ｌは好ましくはハロゲンまたは式（ＸＸＶ）で示されるように式ＯＳＯ2Ｒｂのスルホン酸のエステルであり、ここでＲｂはＣ１－４アルキル基または所望によりＣ１－４アルキル基で置換されたフェニル基である。より好ましくはＬは式（ＸＸＶＩ）に示されるように臭素である。
式（ＸＸＶ）のスルホン酸エステルは、１，４－ジブロモ－１，１，２－トリフルオロブタンを選ばれたスルホン酸の銀塩と反応させ、得られた中間体４－トルエンスルホン酸エステルを脱臭素フッ素化することにより製造しうる。
出願中の国際特許出願ＰＣＴ／ＧＢ９４／０１５７０号明細書に、本発明者らは式（ＸＸＶＩ）の化合物、すなわち４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンの製造方法を開示した。その方法においては臭化水素を不活性溶剤中で市販の４－ブロモ－１，１，２－トリフルオロブト－１－エンと反応させて１，４－ジブロモ－１，１，２－トリフルオロブタンとなす。次いでこの中間体を適切な溶剤、たとえばアセトンまたは水中において脱臭素フッ素化剤で処理して、式（ＸＸＶＩ）の化合物となすことができる。
式（ＸＸＩＩＩ）の化合物が均等なメルカプトとチオン形との間の互変異性体平衡状態で存在する可能性があることは当業者には自明であろう。別途明記しない限り本明細書においては便宜上、これらの化合物をそれらのメルカプト形で表す。
式（ＸＸＩＩＩ）の化合物は市販されているか、または市販の前駆物質から当技術分野で周知の標準法により製造することができる。
あるいは式（Ｉ）の化合物は、対応する式（ＸＸＶＩＩ）の化合物（ここでもＬは良好な脱離基である）を、このような置換反応に関して当技術分野で周知の条件下に式（ＸＸＶＩＩＩ）のメルカプト化合物と反応させることにより製造しうる。好ましくはＬはハロゲンまたはニトロ基である。２相溶剤系、たとえば水／ジクロロメタンを用いて、相間移動触媒、たとえばテトラ－ｎ－ブチルアンモニウムブロミドの存在下に、周囲温度で窒素雰

囲気下に反応を実施するのが好都合である。
式（ＸＸＶＩＩＩ）のメルカプト化合物はそのＳ－アセチルまたはそのイソチオウロニウム臭化水素酸塩の形で反応させるのが好都合である。それらの化合物は容易に加水分解されて式（ＸＸＶＩＩＩ）のメルカプト化合物となる。
式（Ｉ）の化合物は、式（ＸＸＩＸ）の対応するアミノ化合物から製造することもでき、これをたとえば式（ＸＸＸ）のジスルフィドの存在下に、適切な溶剤、たとえばジクロロメタンまたはアセトニトリル中で、アルキルニトリル、たとえば亜硝酸ｔ－ブチルによりジアゾ化することができる。
ｎが１または２である式（Ｉ）の化合物は、対応して置換されたｎが０である式（Ｉ）の化合物を常法により、たとえば不活性有機溶剤中において適切な酸化剤で処理することにより酸化することによって製造しうる。一般に式（Ｉ）の化合物を１当量の適切な酸化剤で酸化することによりｎが１である対応する化合物が得られ、２当量の酸化剤を用いる酸化によりｎが２である対応する化合物が得られる。適切な酸化剤には有機および無機の過酸化物、たとえばペルオキシカルボン酸、またはその塩類、たとえばメタクロロ過安息香酸、過安息香酸、マグネシウムモノペルオキシフタル酸またはペルオキシモノ硫酸カリウムが含まれる。
したがって本発明の他の観点によれば、ｎが１または２である式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、対応して置換されたｎが０である式（Ｉ）の化合物を酸化することを含む方法が提供される。
式（Ｉ）の化合物が対応する式（ＸＸＩＩＩ）、（ＸＸＶＩＩ）または（ＸＸＩＸ）の置換化合物から製造されるのと同様に、必要な環置換を達成するための既知の化学方法により後続の官能基変換を実施しうることは自明であろう。それらの官能基変換の例には、ニトロ基からアミン基への還元、ハロゲン化、たとえば塩素化、エステルから酸への加水分解、アルコール類から酸への酸化、塩の形成が含まれる。
本発明の他の種々の好ましい特色および態様を、以下の具体例を参照してさらに詳述する。例中の％は重量％であり、以下の略号を用いる：ｍｐ＝融点；ｂｐ＝沸点；ｇ＝グラム；ＧＣ＝ガスクロマトグラフィー；ＮＭＲ＝核磁気共鳴；ｓ＝一重項；ｄ＝二重項；ｄｄ＝重複二重項；ｔ＝三重項；ｑ＝四重項；ｍ＝多重項；ｂｒ＝幅広い；Ｍ＝モル；ｍＭ＝ミリモル；$CDCl_3$＝ジュウテリオクロロホルム。化学シフト（δ）はテトラメチルシランからのｐｐｍとして測定する。別途明記しない限り$CDCl_3$をNMRスペクトル測定の溶剤として用いた。M^+＝質量スペクトル測定により測定した分子イオン；ＦＡＢ＝；高速原子衝撃法；ＴＬＣ＝薄層クロマトグラフィー。
本発明化合物の製造に有用な多数の中間化合物の合成を以下に示す。これらの化合物のうち若干は当技術分野で知られている。

製造例１

これはメタンスルホン酸４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルの３工程製造法につき説明する。

工程１：　４－ブロモ－４，４－ジフルオロブタン酸

アクリル酸（１．４４ｇ）およびアセトニトリル（８０cm^3）の撹拌された溶液に、亜ジチオン酸ナトリウム（４．１８ｇ）、炭酸水素ナトリウム（２．０１ｇ）、水（２０cm^3）、そして最後にジブロモジフルオロメタン（５cm^3）を添加した。２相混合物を周囲温度で撹拌して、無機塩類を徐々に溶解した。４時間後のＧＣ分析はアクリル酸が完全に消費されたことを示した。水相を固体塩化ナトリウムで飽和させた。有機相を分離し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させて、少量の白色固体を含有する淡黄色の油を得た。この混合物を酢酸エチルに装入し、濾過し、溶剤を減圧下で蒸発させて、淡黄色の油（２．５４ｇ）を得た。
^1H NMR (DMSO-d_6): δ 2.45(2H,t); 2.65(2H,m).

工程２：　４－ブロモ－４，４－ジフルオロブタノール

窒素雰囲気下にジエチルエーテル中の水素化アルミニウムリチウムの溶液（５cm^3，５

ｍＭ）を０℃に冷却した。この温度を維持しながら、乾燥ジエチルエーテル（５ｃｍ^3）に溶解した４－ブロモ－４，４－ジフルオロブタン酸（１ｇ）を撹拌下に滴加した。０℃で１時間後に反応混合物を２Ｍ塩酸の添加によって慎重に停止した。有機相を分離し、飽和炭酸水素ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させて、無色の油（０．５７ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 1.82-1.96(2H,m); 2.40-2.60 (2H,m); 3.74(2H,t).

工程３： メタンスルホン酸４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチル

４－ブロモ－４，４－ジフルオロブタノール（０．５７ｇ）の、乾燥ジエチルエーテル（５ｃｍ^3）中における撹拌された溶液を、０℃に冷却した。この温度を維持しながら、トリエチルアミン（１．７ｃｍ^3）を添加した。１０分後に塩化メタンスルホニル（０．３ｃｍ^3）を添加し、混合物を０℃でさらに１時間撹拌した。反応混合物を２Ｍ塩酸（２ｃｍ^3）およびジエチルエーテル（２０ｃｍ^3）に注入した。有機相を分離し、飽和ブラインで洗浄し、次いでシリカゲルのプラグに導通し、さらにジエチルエーテルで溶離した。ジエチルエーテル画分を減圧下で蒸発させて、淡黄色の油（０．７０５ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.04-2.18(2H,m); 2.46-2.64(2H,m); 3.04(3H,s); 4.32(2H,t).

製造例２

これは４－メチルベンゼンスルホン酸－４，４－ジフルオロブト－３－エニルエステルを市販の４－ブロモ－１，１，２－トリフルオロブト－１－エンから製造する３工程法につき説明する。

工程１： １，４－ジブロモ－１，１，２－トリフルオロブタンの製造

４－ブロモ－１，１，２－トリフルオロブト－１－エン（フルオロケム・リミテッド）（２４０ｇ）を使用前に水（３００ｃｍ^3）、次いでブライン（３００ｃｍ^3）で洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。過酸化ベンゾイル（約０．７ｇ）を一度に添加し、反応温度が３０－４０℃に維持される速度で臭化水素ガスを混合物に吹き込んだ。２時間後に反応混合物の試料のＧＣは出発物質がほとんど残存しないことを示した。反応混合物を水（３００ｃｍ^3）、次いで飽和炭酸水素ナトリウム溶液、次いで再び水（３００ｃｍ^3）で洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過すると淡黄色の油（２９６．７ｇ）が得られ、１，４－ジブロモ－１，１，２－トリフルオロブタンと同定された。この物質はＧＣ分析により純度９８％を越えることが示された。

^{1}H NMR: δ 2.38(2H,m); 3.57(2H,m); 4.90(1H,m).

工程２： ４－メチルベンゼンスルホン酸４－ブロモ－３，４，４－トリフルオロブチルの製造

工程１の生成物（１ｇ）を、銀トシレート（１．０３ｇ）の、アセトニトリル（１０ｃｍ^3）中における撹拌された懸濁液に、周囲温度で遮光下に滴加した。次いで反応物を２４時間加熱還流したのち、ＧＣ分析は出発物質が完全に消費されたことを示した。反応混合物を周囲温度に冷却し、沈殿を濾過し、酢酸エチルで洗浄した。濾液および酢酸エチル洗液を合わせて水で洗浄し、水相を酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を合わせて水およびブラインで洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で蒸発させて、褐色の油（１．２１ｇ）を得た。ＧＣ分析はこの物質が純度＞９９％であることを示した。

^{1}H NMR: δ 2.20(2H,m); 2.46(3H,s); 4.19(2H,m); 4.74(1H,m); 7.38(2H,d); 7.80(2H,d).

工程３： ４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルの製造

粉末状亜鉛（１．４１ｇ）およびヨウ素（１粒、触媒用）の、メタノール（３ｃｍ^3）中における撹拌された懸濁液に、ｐ－トリルスルホン酸４－ブロモ－３，４，４－ジフルオロブチル（０．７１ｇ）の、メタノール（２ｃｍ^3）中における溶液を添加した。反応混合物を２ 1/2時間加熱還流したのち、ＧＣ分析は出発物質が完全に消費されたことを示した。有機相を亜鉛懸濁液からピペットで取り出し、亜鉛を酢酸エチルで３回洗浄した。酢

酸エチル分を２M塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で蒸発させて、褐色の液体（０．４７ｇ）を得た。ＧＣ分析はこの物質が純度＞９９％であることを示した。

^{1}H NMR: δ 2.35(2H,m); 2.46(3H,s); 4.01(2H,m); 4.15(1H,m); 7.38(2H,d); 7.79(2H,d).

製造例３

これは４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンを１，４－ジブロモ－１，１，２－トリフルオロブタンから製造することにつき説明する。

亜鉛粉末（０．８８ｇ）を、水（１滴）を含有するアセトン（６ｃｍ^3）中における１，４－ジブロモ－１，１，２－トリフルオロブタン（１．３８ｇ）の撹拌された溶液に、窒素雰囲気下で添加した。４５分後にＧＣ分析は大部分の出発物質が消費されたことを示した。次いで混合物を、痕跡量の水を含有するアセトン中の追加の亜鉛粉末（３ｇ）（５５℃に予熱）に添加した。この温度でさらに２０分後に、ＧＣ分析はすべての出発物質が消費されたことを示し、これは脱臭素フッ素化反応が開始したことを示した。次いでさらに出発物質（１２．３４ｇ）を、７５分間にわたって反応混合物を５５℃に維持しながら反応物に添加した。次いでさらに９５分間加熱を続けた。試料のＧＣ分析は約３％の出発ジブロモ化合物が未変化のままであることを示した。さらに亜鉛粉末（０．１６ｇ）を添加し、すべての出発物質が消費されたことをＧＣ分析が示すまで加熱を続けた。アセトン溶液を亜鉛残渣からデカントして、後続の化学反応に用いるのに適した４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン溶液を得た。

製造例４

これはチオ酢酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルの製造につき説明する。

チオ酢酸カリウム（１．９８ｇ）、４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（３．０ｇ）およびテトラ－ｎ－ブチルアンモニウムブロミド（０．３ｇ、触媒）を周囲温度で窒素下に５時間撹拌し、１８時間保存した。混合物をクーゲルロール（Ｋｕｇｅｌｒｏｈｒ）装置により蒸留して、チオ酢酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルを無色の液体（１．１２ｇ）として得た。

^{1}H NMR: δ 2.25(2H,m); 2.30(3H,s); 2.90(2H,t); 4.20(1H,m);

（沸点１１５℃、１２０ｍｍＨｇで）。

製造例５

これは４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウム塩の製造につき説明する。

チオ尿素（０．２９ｇ）および４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（１ｇ）を一緒にエタノール（２０ｃｍ^3）中で２４時間加熱還流した。反応混合物を冷却し、溶剤を減圧下で蒸発させて、油を得た。これは徐々に結晶化した。ヘキサンで摩砕処理して（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）－チオ尿素をその４－メチルベンゼンスルホン酸（１．１４ｇ）として得た。

MH^+(FAB)=167; ^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 2.48(3H,s); 2.46-2.58(2H,m); 3.42(2H,t); 4.66-4.84(1H,m); 7.32(2H,d); 7.68(2H,d); 9.10-9.40(3H,br)

製造例６

これは臭化水素酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウムの製造につき説明する。

チオ尿素（１８．５ｇ）を、４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（４１．５ｇ）の、エタノール（１５０ｃｍ^3）中における溶液に添加し、撹拌しながら１８時間加熱還流した。反応混合物を周囲温度に冷却し、減圧下で蒸発させた。得られたろう状固体をジエチルエーテルで洗浄し、濾過し、さらにジエチルエーテルで洗浄し、吸引乾固して、目的生成物を無色固体（５７ｇ）として得た。

MH⁺ =167; ^{1}H NMR(DMSO-d_6): δ 2.20(2H,m); 3.20(2H,t); 4.50(1H,m); 8.95(4H,broad signal).

上記中間体のＮ－メチル誘導体を上記方法で、ただしチオ尿素の代わりにＮ－メチルチオ尿素を用いて製造した。それは以下を有していた：

MH⁺ =181; ^{1}H NMR(DMSO-d_6): δ 2.45-2.55(2H,m); 3.0-3.05(3H,d); 3.4-3.5(2H,t); 4.30-4.45(1H,m);

（融点７４－７７．２℃）。

製造例７

これはビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）ジスルフィドの製造につき説明する。

二硫化ナトリウムの溶液（予め硫化ナトリウム・９水和物（５３ｇ）およびイオウ（７．０ｇ）から製造、エタノール（２５０ｃｍ^3）中）を、エタノール（１００ｃｍ^3）中の１－ブロモ－４，４－ジフルオロブト－３－エン（５０ｇ）に添加した。混合物を２時間、還流下に徐々に加熱および撹拌し、次いで冷却し、減圧下で蒸発させた。残渣をジエチルエーテルで抽出し、有機相を濾過して臭化ナトリウムを除去し、ジエチルエーテルを減圧下で蒸発させて液体を得た。これを１６ｍｍＨｇ、沸点１２０℃で蒸留して、ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）ジスルフィド（２４ｇ）を無色の液体として得た。

実施例ＩＩ．１

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）フラン（化合物ＩＩ．１）の製造につき説明する。

ブチルリチウム（６．５ｃｍ^3、エーテル中２．５Ｍ）を、フラン（１ｇ）の、ジエチルエーテル（４０ｃｍ^3）中における溶液に撹拌しながら滴加した。９０分後に反応混合物を３０分間加熱還流し、次いで周囲温度に冷却した。撹拌しながら粉末状イオウ（０．４８ｇ）を少量ずつ添加した。２時間後に４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（３．０ｇ）を添加し、周囲温度で１８時間撹拌を続けた。水により反応停止し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した。有機抽出液を合わせて乾燥させ、濾過し、蒸発させて、暗褐色の液体を得た。シリカ上でのクロマトグラフィー（溶離剤、ヘキサン－ジエチルエーテル混合物）により化合物ＩＩ．１（０．９６５ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.2-2.3(2H,m); 2.7-2.8(2H,t); 4.15-4.35(1H,m); 6.4(1H,dd); 6.53(1H,d); 7.5(1H,d);

（油）。

実施例ＩＩ．２

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メチルフラン（化合物ＩＩ．４）の製造につき説明する。

ブチルリチウム（５．４ｃｍ^3、エーテル中２．５Ｍ）を、フラン（１ｇ）の、ジエチルエーテル（４０ｃｍ^3）中における溶液に撹拌しながら滴加した。９０分後に反応混合物を３０分間加熱還流し、次いで周囲温度に冷却した。撹拌しながら粉末状イオウ（０．３８ｇ）を少量ずつ添加した。２時間後に４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（２．０５ｇ）を添加し、１８時間撹拌を続けた。水により反応停止し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した。有機抽出液を合わせて乾燥させ、濾過し、蒸発させた。シリカ上でのクロマトグラフィー（溶離剤、ヘキサン－エーテル混合物）により化合物ＩＩ．４（１．２５ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.2-2.3(2H,m); 2.3(3H,s); 2.7-2.77(2H,t); 4.16-4.34(1H,m); 5.97(1H,m); 6.43(1H,d);

（油）。

実施例ＩＩ．３

この実施例は３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－２－メチルフラン（化合物ＩＩ．７）の製造につき説明する。

２－メチル－３－フランチオール（２．０ｇ）、４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（３．２４ｇ）および炭酸カリウム（２．４８ｇ）の、アセトン（５０ｃｍ^3）中における溶液を２時間加熱還流し、次いで１８時間放置した。水により反応停止し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した。有機抽出液を合わせて乾燥させ、濾過し、蒸発させた。シリカ上でのクロマトグラフィー（溶離剤、ヘキサン中の１０％エーテル）により化合物ＩＩ．７（２．３３８ｇ）を得た。

M^+=204; ^{1}H NMR: δ 2.1-2.25(2H,m); 2.35(3H,s); 2.65(2H,t); 4.1-4.3(1H,m); 6.3 (1H,d); 7.3(1H, d);

（油）。

実施例ＩＩ．４

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）フラン（化合物ＩＩ．２）の製造につき説明する。

３－クロロ過安息香酸（固体５０重量％のもの０．５４ｇ、１．５８ｍＭ）を、化合物ＩＩ．１（０．３０ｇ）の、ジクロロメタン（５ｃｍ^3）中における溶液に、氷浴冷却しながら少量ずつ添加した。４時間撹拌したのち、反応物を酢酸エチルと２Ｍ　ＮａＯＨ溶液との間で分配した。有機層を分離し、追加の２Ｍ　ＮａＯＨ溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、蒸発させて、化合物ＩＩ．２（０．２１０ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.3-2.5(2H,m); 3.1-3.4(2H,m); 4.15-4.35(1H,m); 6.5(1H,dd); 7.0(1H,d); 7.7(1H,d);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）フラン（化合物ＩＩ．３）；

^{1}H NMR: δ 2.4-2.55(2H,m); 3.25-3.3(2H,t); 4.1-4.3 (1H,m); 6.6(1H,dd); 7.23(1H,d); 7.67(1H,d)

（油）、化合物ＩＩ．１から２．１当量のオキシダントを用いて。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－メチルフラン（化合物ＩＩ．５）；

^{1}H NMR: δ 2.3-2.45(5H,m); 3.0-3.15 および 3.3-3.4(計 2H,m); 4.2-4.3(1H,m); 6.1(1H,d); 6.85(1H,d);

（油）、化合物ＩＩ．４から１当量のオキシダントを用いて。

（iii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－メチルフラン（化合物ＩＩ．６）；

^{1}H NMR: δ 2.4-2.55(5H,m); 3.2-3.28 (2H,t); 4.15-4.3(1H,m); 6.2(1H,d); 7.1(1H,d);

（油）、化合物ＩＩ．４から２．１当量のオキシダントを用いて。

（iv）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－２－メチルフラン（化合物ＩＩ．８）；

^{1}H NMR: δ 2.3-2.45(5H,m); 2.8-2.9および3.1-3.2(計 2H, m); 4.2-4.35(1H,m); 6.66(1H,d); 7.4(1H,d)

化合物ＩＩ．４から１当量のオキシダントを用いて。
（ｖ）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－２－メチルフラン（化合物ＩＩ．９）；

^{1}H NMR: δ 2.42-2.52(2H,m); 2.6(3H,s); 3.2-3.28(2H,t); 4.1-4.23(1H,m); 6.6(1H,d); 7.36(1H,d)

化合物ＩＩ．４から２．１当量のオキシダントを用いて。

実施例ＩＩＩ．１

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チオフェン（化合物ＩＩＩ．１）の製造につき説明する。
２－メルカプトチオフェン（１０ｇ）、４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（１５．４７ｇ）および炭酸カリウム（１１．８７ｇ）をアセトン（２５０ｃｍ^3）中に含有する溶液を２時間加熱還流し、次いで１８時間放置した。水により反応停止し、ジエチルエーテルで数回抽出した。有機抽出液を合わせて硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、蒸発させて、黄褐色の油を得た。シリカ上でのクロマトグラフィー（溶離剤、ヘキサン中の５％エーテル）により化合物ＩＩＩ．１（９．５ｇ）を得た。

M^+=206; ^{1}H NMR: δ 2.2-2.4(2H,m); 2.8(2H,t); 4.1-4.3(1H,m); 6.95-7.0(1H,dd); 7.15(1H,d); 7.35(1H,d);

（油）。
以下の本発明化合物を上記方法で製造した：
（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ベンゾ［ｂ］チオフェン（化合物ＩＩＩ．１０）；

^{1}H NMR: δ 2.2-2.3(2H,m); 2.7-2.8(2H,t); 4.15-4.35(1H,m); 6.4(1H,dd); 6.53(1H,d); 7.5(1H,d).

ベンゾチオフェンから。

実施例ＩＩＩ．２

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－ホルミルチオフェン（化合物ＩＩＩ．４）の製造につき説明する。
化合物ＩＩＩ．１（１．０ｇ）を、ジメチルホルムアミド（０．４８ｃｍ^3）および塩化ホスホリル（０．５６ｃｍ^3）を含有する溶液に徐々に添加した。反応混合物を１００℃に２時間加熱し、氷浴中で冷却し、次いで２Ｍ　ＮａＯＨ溶液で中和した。水溶液をジエチルエーテルで２回抽出し、有機層を合わせて水およびＮａＨＣＯ$_3$溶液で洗浄した。有機抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、蒸発させて、暗色の液体を得た。シリカにより濾過して（溶離剤、ヘキサン中の２０％ジエチルエーテル）、化合物ＩＩＩ．４（０．９１ｇ）を得た。

M^+=234; ^{1}H NMR: δ 2.4(2H,m); 3.0(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 7.1(1H,d); 7.7(1H,d); 9.8(1H,s);

（油）。

実施例ＩＩＩ．３

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－ヒドロキシメチルチオフェン（化合物ＩＩＩ．５）の製造につき説明する。
水素化ホウ素ナトリウム（０．０６５ｇ）を、化合物ＩＩＩ．４（０．７５ｇ）の、エタノール（２１ｃｍ^3）および水（９ｃｍ^3）中における溶液に添加した。反応混合物を周囲温度で２時間撹拌し、２Ｍ　塩酸で反応停止し、次いで水とジエチルエーテルとの間で分

配した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、蒸発させて、帯緑色の液体を得た。シリカ上でのクロマトグラフィー（溶離剤、ヘキサン中の２０％酢酸エチル）により化合物ＩＩＩ．５（０．４４ｇ）を得た。

M^+=236; ^{1}H NMR: δ 1.8-2.0(1H,br s); 2.3(2H,m); 2.8(2H,t); 4.1-4.3(1H,m); 4.8(2H,s); 6.8(1H,d); 7.0(1H,d);

（油）。

実施例ＩＩＩ．４

この実施例は（Ｅ）－および（Ｚ）－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－ヒドロキシイミノチオフェン（化合物ＩＩＩ．６およびＩＩＩ．７）の製造につき説明する。

塩酸ヒドロキシルアミン（０．９ｇ）および炭酸水素ナトリウム（１．０９ｇ）をエタノール（１５ｃｍ^3）および水（１５ｃｍ^3）中で５分間撹拌した。化合物ＩＩＩ．４（３ｇ）を添加し、反応混合物を周囲温度で２時間撹拌し、次いで１８時間放置した。反応混合物を水とジエチルエーテルとの間で分配した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、蒸発させて、黄褐色の液体（３．４ｇ）を得た。シリカ上でのクロマトグラフィー（溶離剤、ヘキサン中の２０％酢酸エチル）により化合物ＩＩＩ．６（１．５ｇ）およびＩＩＩ．７（１．３ｇ）を得た。

M^+=249; ^{1}H NMR: δ 2.25-2.35(2H,m); 2.85(2H,t); 4.14-4.35(1H,m); 7.05(2H,m); 7.52(1H,br s); 8.18(1H,s);

（油）および

M^+ =249; δ 2.25-2.38(2H,m); 2.85-2.95(2H,t); 4.18-4.35(1H,m); 7.08(1H,d); 7.25(1H,d); 7.64(1H,s);

（油）。

実施例ＩＩＩ．５

この実施例は５－シアノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チオフェン（化合物ＩＩＩ．８）の製造につき説明する。

１，１′－カルボニル－ジイミダゾール（０．３２６ｇ）を化合物ＩＩＩ．６（０．５ｇ）の溶液に添加し、反応混合物を周囲温度で１０分間撹拌し、次いで２時間加熱還流し、１８時間放置した。さらに、当量の１，１′－カルボニル－ジイミダゾールを添加し、反応混合物を１時間加熱還流した。反応混合物をセライトにより濾過し、次いで蒸発させて、化合物ＩＩＩ．８（０．２８ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.27-2.38(2H,m); 2.94(2H,t); 4.15-4.33(1H,m); 7.05(1H,d); 7.5(1H,d);

（油）。

実施例ＩＩＩ．６

この実施例は５－アセチル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チオフェン（化合物ＩＩＩ．９）の製造につき説明する。

臭化メチルマグネシウム（１．３ｃｍ^3、ジエチルエーテル中の３Ｍ溶液、３当量）を、化合物ＩＩＩ．８（０．３ｇ）の、テトラヒドロフラン（１０ｃｍ^3）中における溶液に徐々に添加した。反応混合物を周囲温度で３時間撹拌し、次いで溶剤を蒸発させた。残渣を水酸化アンモニウム溶液とクロロホルムの間で分配した。有機層を水で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、蒸発させた。残渣をシリカ上でクロマトグラフィー処理して（溶離剤、ヘキサン中の１０％酢酸エチル）、化合物ＩＩＩ．９（０．１６ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.30-2.40(2H,m); 2.50(3H,s); 2.97(2H,t); 4.15-4.33(1H,m); 7.04(1H,d); 7.55(1H,d);

（油）。

実施例ＩＩＩ．７

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）チオフェン（化合物ＩＩＩ．２）の製造につき説明する。

化合物ＩＩＩ．１（０．５０ｇ）を周囲温度でジクロロメタン（５ｃｍ^3）中において撹拌し、３－クロロ過安息香酸（固体５０重量％のもの０．８３４ｇ、１当量）を添加した。出発物質が消費されたことをＴＬＣが示したのち、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液の添加により反応を停止し、生成物をジクロロメタン中へ抽出した。有機相を分離し、飽和ブラインで洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させた。濾過し、減圧下での蒸発により濃縮したのち、液体（０．５８４ｇ）が得られ、これをシリカゲル上で溶離剤としてヘキサン中の２０％酢酸エチル、次いでジエチルエーテルを用いるクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＩＩＩ．２（０．２９ｇ）を溶離させた。

^{1}H NMR: δ 2.3-2.55 (2H, m); 2.9-3.2 (2H, m); 4.2-4.5 (1H, m);

7.15 (1H, m); 7.5 (1H, m); 7.7 (1H, m);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チオフェン（化合物ＩＩＩ．３）

^{1}H NMR: δ 2.4-

2.6(2H,m); 3.2-3.4(2H,t); 4.1-4.3 (1H, m); 7.15(1H,dd); 7.7-7.8(1H,m);

（油）、化合物ＩＩＩ．１から２当量のオキシダントを用いて。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）ベンゾ［ｂ］チオフェン（化合物ＩＩＩ．１１）

^{1}H NMR: δ

2.3-2.4(2H,m); 3.0-3.2(2H,m); 4.2-4.4(1H,m); 7.45(2H,m); 7.9(2H,m); 7.75(1H,s)

化合物ＩＩＩ．１０から１当量のオキシダントを用いて。

（iii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）ベンゾ［ｂ］チオフェン（化合物ＩＩＩ．１２）

^{1}H NMR: δ 2.5(2H,m); 3.3(2H,t); 4.2-4.35(1H,m); 7.5(2H,m); 7.9(3H,m)

化合物ＩＩＩ．１０から２当量のオキシダントを用いて。

実施例ＩＶ．１

この実施例は５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メチルイソオキサゾール－４－カルボン酸エチル（化合物ＩＶ．８）の製造につき説明する。

チオ酢酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（２ｇ）の、５０％水酸化ナトリウム溶液（６．７ｃｍ^3）中における溶液を、３０分間激しく撹拌した。エチル５－クロロ－４－メチルイソオキサゾール（２．２ｇ）の、ジクロロメタン（１２ｃｍ^3）中における溶液を添加し、次いで臭化テトラ－ｎ－ブチルアンモニウム（触媒）を添加し、周囲温度で窒素下に反応物を撹拌した。３時間後に層を分離し、有機相をブラインで洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣を８８０アンモニアと共に撹拌すると結晶化した。結晶を濾過により単離して、化合物ＩＶ．８（２．８７ｇ）を得た。

^{1}H NMR δ 1.35(3H,t); 2.45(3H,s); 2.50(2H,m); 3.20(2H,t); 4.25(1H,m); 4.30(2H,q);

（融点４１－４２℃）。

実施例ＩＶ．２

この実施例は５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メチルイソオキサゾール－４－カルボン酸（化合物ＩＶ．９）の製造につき説明する。

化合物ＩＶ．８（０．５ｇ）の、イソプロパノール（５ｃｍ^3）および２Ｍ　ＮａＯＨ（１ｃｍ^3）中における溶液を、３時間撹拌した。次いで混合物を水に注入し、酢酸エチル

で洗浄した。次いで水層を２Ｍ　ＨＣｌで酸性化し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。この抽出液を乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて、化合物ＩＶ．９（０．１６ｇ）を得た。

M^+=249; ^{1}H NMR δ 2.45(3H,s); 2.50(2H,m); 3.20(2H,t); 4.20- 4.40(1H,m);

（融点１３２－１３３℃）。

実施例ＩＶ．３

この実施例は５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メチルイソオキサゾール－４－カルボキシアミド（化合物ＩＶ．７）の製造につき説明する。

トリエチルアミン（０．３３ｃｍ^3）およびクロロギ酸エチル（０．２４ｃｍ^3）を、ジクロロメタン（１５ｃｍ^3）中の化合物ＩＶ．９（０．５６ｇ）に０℃で添加した。反応物を周囲温度にまで昇温させ、２時間撹拌した。溶液が飽和するまでアンモニアを吹き込み、次いで反応物をさらに１時間撹拌した。アンモニア水を添加し、生成物をジクロロメタン中へ抽出した。有機相を水で洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させた。クーゲルロール装置中での蒸留による精製により化合物ＩＶ．７（０．０６９ｇ）を得た。

^{1}H NMR δ 2.45(2H,m); 2.50(3H,s); 3.25(2H,t); 4.25(1H,m);

（融点８７℃）。

実施例ＩＶ．４

この実施例は３－（５－クロロフル－２－イル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）イソオキサゾール（化合物ＩＶ．２３）の製造につき説明する。

硫化水素を、カリウムメトキシド（１．９ｇ）の、エタノール（１０ｃｍ^3）中における撹拌された溶液（アセトン／氷浴中で冷却）に吹き込んだ。５－クロロ－３－（５－クロロフル－２－イル）イソオキサゾール（２．２ｇ）を添加し、次いで反応物を１時間加熱還流し、その間に溶剤を蒸発させた。アセトン（１０ｃｍ^3）および４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（２ｇ）を添加し、混合物をさらに２時間加熱還流した。得られた溶液を冷却し、ジエチルエーテルおよびブラインに注入し、層を分離した。水層をエーテルで抽出した。有機相を合わせてブラインで洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて、黒色固体を得た。シリカゲル上で溶離剤としてヘキサン中の１０％エーテルを用いるカラムクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＩＶ．２３（２ｇ）を得た。

M^+=291; ^{1}H NMR δ 2.35-2.50(2H,m); 3.10(2H,t); 4.30(1H,m);

6.30(1H,d); 6.43(1H,s); 6.90(1H,d);

（融点８０－８２℃）。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した：

（ｉ）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－フェニルイソオキサゾール（化合物ＩＶ．１）

M^+=267; ^{1}H NMR: δ 2.43(2H,m); 3.10(2H,t); 4.28(1H,m); 6.50(1H,s); 7.45(3H,m); 7.78(2H,m);

（油）、５－クロロ－３－フェニルイソオキサゾールから。

実施例ＩＶ．５

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メチルイソオキサゾール（化合物ＩＶ．１０）の製造につき説明する。

アセトンオキシム（０．３６５ｇ）の、乾燥テトラヒドロフラン（２０ｃｍ^3）中における撹拌された溶液に、０℃で窒素下にｎ－ブチルリチウム（ヘキサン中の２．５Ｍ溶液４．６ｃｍ^3）を添加すると、淡黄色沈殿が生じた。０℃で３０分間撹拌したのち、二硫化炭素（０．３ｃｍ^3）を添加して、鮮明な橙色の溶液を得た。さらに１０分後に３Ｍ　Ｈ

Ｃｌ（２０ｃｍ^3）を添加し、反応物を３時間加熱還流し、次いで冷却した。層を分離し、水層をクロロホルムで抽出した。有機相を合わせて乾燥させ（ＭｇＳＯ$_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて、褐色の油を得た。次いでこの油をアセトン（１１ｃｍ^3）に装入し、１－ブロモ－４，４－ジフルオロブト－３－エン（０．７７ｇ）および炭酸カリウム（０．８７ｇ）を添加し、反応物を３．５時間加熱還流し、次いで冷却した。次いで混合物を酢酸エチルおよび２Ｍ　ＨＣｌに注入し、層を分離した。水層を酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせて乾燥させ（ＭｇＳＯ$_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて、褐色の油を得た。シリカゲル上で溶離剤として１：９酢酸エチル：ヘキサンを用いるカラムクロマトグラフィーにより精製して、２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メチルイソオキサゾール（０．１０５ｇ）を得た。

M^+=205; ^{1}H NMR: δ 2.30(3H,s); 2.40(2H,m); 3.05(2H,t); 4.25(1H,m); 6.00(1H,s);

（油）。

実施例ＩＶ．６

この実施例は３－（５－クロロフル－２－イル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）イソオキサゾール（化合物ＩＶ．２４）の製造につき説明する。

化合物ＩＶ．２３（２ｇ）の、メタノール（４０ｃｍ^3）中における撹拌された溶液（氷／アセトン浴中で冷却）に、モノペルオキシフタル酸マグネシウム（９．４ｇ）を添加した。３０分間撹拌したのち冷却浴を取り除き、反応物を周囲温度にまで昇温させ、１時間撹拌した。混合物をジエチルエーテルおよびブラインに注入し、層を分離した。有機相を合わせて２Ｍ　ＮａＯＨ、水およびブラインで洗浄し、乾燥させ（ＭｇＳＯ$_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて、化合物ＩＶ．２４（１．９ｇ）を得た。

M^+=323; ^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.40(2H,t); 4.25(1H,m); 6.38(1H,d); 7.05(1H,d); 7.20(1H,s);

（融点８６．５－８８．５℃）。

以下の本発明化合物を上記の酸化方法で製造した：

（ｉ）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－３－フェニルイソオキサゾール（化合物ＩＶ．２）

M^+=283; ^{1}H NMR: δ 2.53(2H,m); 3.25(2H,t); 4.29(1H,m); 7.18(1H,s); 7.50(3H,m); 7.80(2H,m);

（油）、化合物ＩＶ．１および１当量のオキシダントから。

（ii）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－３－フェニルイソオキサゾール（化合物ＩＶ．３）

M^+=299; ^{1}H NMR: δ 2.57(2H,m); 3.43(2H,t); 4.27(1H,m); 7.2(1H,s); 7.51(3H,m); 7.80(2H,m);

（融点５７－５８．５℃）、化合物ＩＶ．１および２当量のオキシダントから。

（iii）３－（チエン－２－イル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）イソオキサゾール（化合物ＩＶ．２６）

M^+=305; ^{1}H NMR: δ 2.50-2.63(2H,m); 3.41(2H,t); 4.27(1H,m); 7.20(1H,s); 7.14-7.23(1H,m); 7.52(2H,m);

（融点５５－５７℃）、３－（チエン－２－イル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）イソオキサゾール（化合物ＩＶ．２５）から。これ自身は５－クロロ－３－（チエン－２－イル）イソオキサゾールから実施例ＩＶ．４の方法で製造された。

実施例Ｖ．１

この実施例は３－クロロ－４－シアノ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）イソチアゾール（化合物Ｖ．２）の製造につき説明する。

４－シアノ－３，５－ジクロロイソチアゾール（１ｇ）の、メタノール（１０ｃｍ^3）中における溶液を、１５分間にわたって硫化ナトリウム・９水和物（１．３ｇ）の、水（２．６ｃｍ^3）およびメタノール（２５ｃｍ^3）中における溶液（５０℃に加熱）に添加した。反応物を１時間撹拌し、次いで溶剤を減圧下で蒸発させて、黄色固体を得た。この残渣をアセトン（２０ｃｍ^3）に溶解し、４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（０．６８ｇ）を添加し、反応物を１２時間撹拌した。得られた混合物を水に注入し、層を分離した。水層を酢酸エチルで抽出した。有機相を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させた。シリカゲル上で溶離剤として１：１酢酸エチル：ヘキサンを用いるカラムクロマトグラフィーにより精製して、化合物Ｖ．２（０．８８ｇ）を得た。

M$^+$=266; ^{1}H NMR δ 2.50(2H,m); 3.20(2H,t); 4.20-4.40(1H,m);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で、ただし２当量の硫化ナトリウム・９水和物および４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンを用いて製造した：

（ｉ）３，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－シアノイソチアゾール（化合物Ｖ．１２）

^{1}H NMR δ

2.40-2.60(4H,m); 3.20(2H,t); 3.30(2H,t); 4.20-4.40(2H,m);

（油）。

実施例Ｖ．２

この実施例は５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－シアノイソチアゾール（化合物Ｖ．６）および３，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－シアノイソチアゾール（化合物Ｖ．１５）の製造につき説明する。

化合物Ｖ．１２（０．１ｇ）の、ジクロロメタン（５ｃｍ^3）中における溶液に、３－クロロ過安息香酸（０．４２ｇ）を添加し、出発物質が消失するまで反応混合物を撹拌した。反応混合物を酢酸エチルおよび水に注入し、層を分離した。水層を酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル相を合わせて炭酸水素ナトリウムで洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣をジエチルエーテルに装入し、トリエチルアミンを添加して溶液を混濁させた。次いでジエチルエーテル溶液を水で洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させた。残渣をシリカゲル上で溶離剤として１：１酢酸エチル：ヘキサンを用いるカラムクロマトグラフィーにより精製して、化合物Ｖ．１５（０．０１ｇ）；

M$^+$=418; ^{1}H NMR δ 2.60-2.70(4H,m); 3.60(4H,t); 4.30(2H,m);

（油）および化合物Ｖ．６（０．０８ｇ）；

M$^+$=264; ^{1}H NMR δ 2.60(2H,m); 3.60(2H,t); 4.30(1H,m); 9.40(1H,s);

（油）を得た。

実施例ＶＩ．１

２、４または５－位において４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ基で置換されたオキサゾール類は、対応して置換されたメルカプト－オキサゾールおよび適宜なアルキル化剤ジフルオロブト－１－エンから出発して製造することができる。これを以下の２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－フェニルオキサゾール（化合物ＶＩ．１８）の製造により説明する。

２－メルカプト－５－フェニルオキサゾール（０．４４ｇ）の、アセトン（１５ｃｍ^3）中における溶液に、４－メチル－ベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロ－３－ブテニル（０．７ｇ）および炭酸カリウム（０．３６９ｇ）を添加し、反応物を合計８時間加熱還流したのち、若干の出発トシレートが残存した。さらに２－メルカプト－５－フェニルオキサゾール（０．０５ｇ）を添加し、５時間加熱を続けた。反応混合物を冷却し、ジエチ

ルエーテルおよび水に注入し、層を分離した。水層をエーテルで抽出し、有機相を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、黄色の液体を得た。シリカゲル上でヘキサン中の５％ｔ－ブチルジメチルエーテルを用いるクロマトグラフィーにより、化合物ＶＩ．１８を得た。

M^+=267; ^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ 2.51(2H,m); 3.23(2H,t); 4.30(1H,m);

7.23-7.47(4H,m); 7.58(2H,d);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）オキサゾール（化合物ＶＩ．１）

^{1}H NMR ($CDCl_3$) δ

2.45(2H,m); 3.20(2H,t); 4.25(1H,m); 7.10(1H,s); 7.66(1H,s);

（油）、オキサゾール－２－チオンから。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルオキサゾール（化合物ＶＩ．６）

M^+ 205; ^{1}H NMR

δ : 2.04(3H,s); 2.45(2H,m); 3.18(2H,t); 4.25(1H,m); 7.38(1H,q);

（油）、２－メルカプト－４－メチルオキサゾールから。

実施例ＶＩ．２

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルオキサゾール－５－カルボン酸メチル（化合物ＶＩ．３２）の３工程製造法につき説明する。

工程１：　２－アミノ－４－メチルオキサゾール－５－カルボン酸メチル

メタノール（２００cm^3）中の３－クロロアセト酢酸メチル（７５ｇ）および尿素（９０ｇ）を２４時間、撹拌および加熱還流した。反応混合物を周囲温度に冷却し、溶液から沈殿を濾過し、冷メタノールで洗浄し、吸引乾固した。この固体を２M水酸化ナトリウム水溶液で処理し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した（数回）。減圧下で溶剤を蒸発させると無色固体（１４．５ｇ）が得られ、これをアセトニトリルから再結晶した。融点２２５℃（分解）。

^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 2.15(3H,s); 3.75(3H,s); 7.4(2H,br).

工程２：　２－クロロ－４－メチルオキサゾール－５－カルボン酸メチル

工程１で得た生成物（１．５６ｇ）を乾燥アセトニトリル（４０cm^3）に部分的に溶解し、８℃で少量ずつ、塩化銅（ＩＩ）（１．６１ｇ）および亜硝酸ｔ－ブチルの、アセトニトリル（乾燥、２０cm^3）中における撹拌された混合物に窒素雰囲気下で添加した。得られた褐色溶液を２０℃で２時間撹拌し、減圧下で蒸発させた。残渣を２M塩酸水溶液で処理し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した。有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、次いでシリカゲルの短いカラムを通してさらにエーテルで洗浄した。濾液を減圧下で蒸発させて、目的とする中間体（０．９ｇ）を黄色固体として得た。M^+＝１７５。

工程３：　２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルオキサゾール－５－カルボン酸メチル

工程２で得た生成物（０．１７６ｇ）およびチオ尿素（０．０８４ｇ）をエタノール（５cm^3）中で撹拌し、窒素雰囲気下で５時間加熱還流した。反応物を冷却し、減圧下での蒸発により溶剤を除去して、黄色のガムを得た。これを、４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（０．１７ｇ）および炭酸カリウム（０．２ｇ）を含有するアセトンに溶解した。この混合物を窒素雰囲気下に周囲温度で１時間撹拌し、１８時間保存した。溶剤を減圧下で蒸発させ、残渣を水およびジエチルエーテルで処理した。有機相を分離し、乾燥させ（$MgSO_4$）、蒸発させて、化合物ＶＩ．３２を得た（0.095g）；

M^+=175. ^1H

NMR: δ 2.45(5H,m); 3.22 (2H,t); 3.90(3H,s); 4.25(1H,m);

（油）。

実施例ＶＩ．３

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルオキサゾール－５－カルボン酸（化合物ＶＩ．３７）の製造法につき説明する。

化合物ＶＩ．３２（０．４ｇ）を、水酸化ナトリウム水溶液（２Ｍ溶液２ｃｍ^3）を含有するプロパン－２－オール（１０ｃｍ^3）に溶解し、周囲温度で５時間撹拌した。混合物を減圧下で蒸発させ、残渣を水で希釈し、酢酸エチルで抽出し、希塩酸で酸性化し、酢酸エチルで再抽出した（１００ｃｍ^{3}で３回）。後者の抽出液を合わせて飽和ブラインで洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、目的生成物を無色固体（０．３ｇ）として得た。

M^+=249; ^1H NMR: δ 2.5(5H,m); 3.27(2H,t); 4.27(1H,m); 6.5(1H,br s);

（融点６６－６８℃）。

この化合物のナトリウム塩は、試料（０．７ｇ）を乾燥メタノール中のナトリウムメトキシド（メタノール（１０ｃｍ^3）に溶解した金属ナトリウム０．０６１ｇ）で周囲温度において処理することにより調製された。減圧下で溶剤を蒸発させて、化合物ＶＩ．３７のナトリウム塩を無色固体として得た。M^+（ＦＡＢ）＝２７１；（融点２１１－２１２℃）。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－トリフルオロメチルオキサゾール－５－カルボン酸（化合物ＶＩ．３６）

M^+=303; ^1H NMR: δ 2.54(2H,m); 3.32(2H,t); 4.28(1H,m) 7.65(1H,br s)

化合物ＶＩ．３１から。

実施例ＶＩ．４

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－トリフルオロメチルオキサゾール（化合物ＶＩ．４）の製造につき説明する。

ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）ジスルフィド（２．７１ｇ）を含有するジクロロメタン（２５ｃｍ^3）中の２－アミノ－４－トリフルオロメチルオキサゾール（０．８４ｇ）を０℃で撹拌し、窒素下に亜硝酸ｔ－ブチル（０．６２ｇ）で滴加処理した。反応溶液を減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ、溶離剤ヘキサン）により分画して化合物ＶＩ．４（０．３５ｇ）を得た。

M^+=259; ^1H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.26(3H,t); 4.28(1H,m); 7.95(1H,q);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で対応するアミノオキサゾールから製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－トリフルオロメチルオキサゾール－５－カルボン酸エチル（化合物ＶＩ．３１）

MH^+=322; ^1H NMR: δ 1.40(3H,t); 2.52(2H,m); 3.30(2H,m);

4.28(1H,m); 4.43(2H,q);

（油）、２－アミノ－４－トリフルオロメチルオキサゾール－５－カルボン酸エチル（１，１，１－トリフルオロメチルアセト酢酸エチルおよび尿素から実施例ＶＩ．２と同様な方法で製造）から。

実施例ＶＩ．５

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－クロロオキサゾー

ル（化合物ＶＩ．１３）の製造につき説明する。
化合物ＶＩ．１（２．０ｇ）を、Ｎ－クロロスクシンイミド（１．５０ｇ）を含有するアセトニトリル（５０ｃｍ^3）に溶解し、周囲温度で２４時間撹拌した。混合物を減圧下で蒸発させ、ヘキサン（５０ｃｍ^3）で抽出し、濾過し、濾液を減圧下で蒸発させた。残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン中の２０％ジエチルエーテル）により分画して化合物ＶＩ．１３（０．７５ｇ）を得た。
M$^+$=225; ^{1}H NMR: δ 2.46(2H,m); 3.16(2H,t); 4.28(1H,m); 6.86(1H,s);

（油）。
以下の本発明化合物を上記方法で化合物ＶＩ．６から製造した：
（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチル－５－クロロオキサゾール（化合物ＶＩ．１５）
M$^+$=239; ^{1}H NMR: δ 2.05(3H,s); 2.45(2H,m); 3.15(2H,t); 4.25(1H,m);

（油）。
実施例ＶＩ．６
この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルオキサゾール－５－カルボキシアミド（化合物ＶＩ．４０）の製造につき説明する。
化合物ＶＩ．３２（１．５ｇ）をメタノール（１０ｃｍ^3）に溶解し、周囲温度においてアンモニア水（３５ｃｍ^3、密度０．８８）で処理した。混合物を５時間撹拌し、ブラインで希釈し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した（１００ｃｍ^{3}で２回）。有機相を合わせてブラインで洗浄し（５０ｃｍ^{3}で４回）、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させた。残渣をヘキサンで洗浄して化合物ＶＩ．４０（１ｇ）を得た。
M$^+$=248; ^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 2.50(5H,m); 3.26(2H,t); 3.85(3H,s); 4.28(1H,m); 5.6, 6.0 (2H,br s);

（融点７２－７３℃）。
実施例ＶＩ．７
この実施例は５－シアノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルオキサゾール（化合物ＶＩ．２５）の製造につき説明する。
化合物ＶＩ．４０（０．６４ｇ）を、乾燥ピリジン（１ｃｍ^3）を含有するジクロロメタン（１０ｃｍ^3）に周囲温度で溶解し、塩化メタンスルホニル（０．５ｃｍ^3）で処理した。溶液を５時間撹拌し、７２時間保存し、さらに塩化メタンスルホニル（０．２５ｃｍ^3）およびピリジン（０．５ｃｍ^3）を添加し、８時間撹拌し、４８時間保存した。混合物を希塩酸で処理し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。有機相を合わせてブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。濾過したのち、溶剤を減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン中の１０％酢酸エチル）により分画して化合物ＶＩ．２５（０．４６ｇ）を得た。
M$^+$=230; ^{1}H NMR: δ 2.32(3H,s); 2.50(2H,m); 2.58(3H,s); 3.25(2H,t); 3.85(3H,s); 4.28(1H,m);

（油）。
実施例ＶＩ．８
この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルオキサゾールカルボキシアミドＮ－メチルスルホニル（化合物ＶＩ．３８）の製造につき説明する。
化合物ＶＩ．３７のナトリウム塩（０．５２ｇ）をヘキサン（６．５ｃｍ^3）中で撹拌し、周囲温度において塩化オキサリル（０．２７５ｇ）で処理した。混合物を６時間撹拌し、１８時間保存し、減圧下で蒸発させた。オキサゾールカルボニルクロリド誘導体を含有する残渣を、メタンスルホンアミド（０．２０ｇ）の、乾燥ブタン－２－オン（５ｃｍ^3）中における溶液で処理し、撹拌しながら８時間加熱還流し、周囲温度に冷却し、１８時

間保存した。混合物を減圧下で蒸発させ、残渣を水に溶解し、２Ｍ塩酸で酸性化し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した（１５０ｃｍ^{3}で２回）。ジエチルエーテル抽出液を合わせて飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、乾燥させ（ＭｇＳＯ$_4$）、減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、アセトニトリル）により精製して、化合物ＶＩ．３８（０．２０ｇ）を得た。

M^+=326; ^{1}H NMR: δ 2.50(5H,m); 3.27(2H,t); 3.40(3H,s); 4.28(1H,m);

（融点６０－６２℃）。

実施例ＶＩ．９

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－フェニルオキサゾール（化合物ＶＩ．１９）の製造につき説明する。

化合物ＶＩ．１８（１ｇ）の、ジクロロメタン（４０ｃｍ^3）中における溶液に、３－クロロ過安息香酸（固体５０重量％のもの１．３ｇ（１当量））を添加し、反応物を周囲温度で５時間撹拌した。反応混合物をジエチルエーテルと炭酸水素ナトリウム水溶液の混合物に注入し、層を分離した。有機層を乾燥させ（ＭｇＳＯ$_4$）、減圧下で蒸発させると白色固体が得られ、これをシリカ上で１：４酢酸エチル：ヘキサンにより溶離するクロマトグラフィーによって精製して、化合物ＶＩ．１９（０．５６７ｇ）を得た。

M^+=283; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.41(2H,t); 4.29(1H,m); 7.27(1H,s); 7.38-7.55(3H,m); 7.71(2H,d);

（油）。

以下の化合物を対応するチオエーテル類から上記の一般法により、ただし２当量の３－クロロ過安息香酸を用いて製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－トリフルオロメチルオキサゾール（化合物ＶＩ．５）

^{1}H NMR: δ 2.65(2H,m); 3.58(2H,t); 4.28(1H,m); 8.24(1H,q);

（油）。

（ii）５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）オキサゾール（化合物ＶＩ．１４）

MNH_4^+=275;

^{1}H NMR: δ 2.60(2H,m); 3.47(2H,t); 4.26(1H,m); 7.18(1H,s);

（油）。

（iii）５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－メチルオキサゾール（化合物ＶＩ．１６）

^{1}H NMR: δ 2.25(3H,s); 2.60(2H,m); 3.45(2H,t); 4.26(1H,m);

（油）。

（iv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－フェニルオキサゾール（化合物ＶＩ．２０）

M^+=299; ^{1}H NMR: δ 2.62(2H,m); 3.51(2H,t); 4.27(1H,m); 7.26(1H,s); 7.42-7.55(3H,m); 7.69-7.79(2H,d);

（融点５５－５９℃）。

実施例ＶＩＩ．１

この実施例は、２、４または５－位において４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ基で置換されたチアゾール類を、対応する置換メルカプトチアゾールおよび適宜なアルキル化剤ジフルオロブト－１－エンから出発して製造する一般法につき説明する。これを以下

の２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－フェニルチアゾール（化合物ＶＩＩ．１７）の製造により証明する。
２－メルカプト－５－フェニルチアゾール（０．４８３ｇ）のアセトン（１５ｃｍ^3）中における溶液に、４－メチル－ベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロ－３－ブテニル（０．７ｇ）および炭酸カリウム（０．３６９ｇ）を添加し、反応物を合計８時間加熱還流したのち、若干の出発トシレートが残存した。さらに２－メルカプト－５－フェニルチアゾール（０．０５ｇ）を添加し、５時間加熱を続けた。反応混合物を冷却し、ジエチルエーテルおよび水に注入し、層を分離した。水層をエーテルで抽出し、有機層を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて黄色液体を得た。シリカ上でヘキサン中の５％ｔ－ブチルジメチルエーテルを用いるクロマトグラフィーにより化合物ＶＩＩ．１７（０．５８２ｇ）を得た。

M^+=283; ^{1}H NMR: δ 2.51(2H,m); 3.31(2H,t); 4.32(1H,m); 7.26(1H,s); 7.30-7.48(3H,m); 7.89(2H,d);

（油）。
以下の本発明化合物を上記方法で製造した：
（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１）

M^+=207; ^{1}H NMR: δ 2.47(2H,m); 3.26(2H,t); 4.27(1H,m); 7.22(1H,d); 7.68(1H,d);

（油）、２－メルカプトチアゾールから。
（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾリン（化合物ＶＩＩ．１３４）

M^+=209; ^{1}H NMR: δ 2.40(2H,m); 3.15(2H,t); 3.4(2H,t); 4.18-4.31(1H,m); 4.2(2H,t);

（油）、２－メルカプトチアゾリンから。
実施例ＶＩＩ．２
この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－トリフルオロメチルチアゾール（化合物ＶＩＩ．４）の２工程製造法につき説明する。
工程１：２－メルカプト－４－トリフルオロメチルチアゾールの製造
ｔ－ブタノール（２０ｃｍ^3）中の１－ブロモ－３，３，３－トリフルオロプロパン－２－オン（５．０ｇ）をジチオカルバミン酸アンモニウム（２．９ｇ）で処理し、混合物を周囲温度で１８時間撹拌し、水に注入し、酢酸エチルで抽出し、有機層を乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン：酢酸エチル１７：３－７：３（容量比））により分画して、目的とするメルカプトチアゾールの水和物（２．１６ｇ）を得た。この物質の一部（１．０ｇ）を、パラトルエンスルホン酸（０．００５ｇ、触媒）を含有するトルエン（２０ｃｍ^3）に添加し、４時間加熱還流した。反応中に生成した水をディーン－スターク装置により除去した。溶液を周囲温度に冷却し、水で洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、目的とする中間生成物（０．３７ｇ）を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：δ7.10（1H,s）；7.80（1H,s）。
工程２：化合物ＶＩＩ．４の製造
無水炭酸カリウム（０．３ｇ）および４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（０．３４ｇ）を含有するアセトン（１５ｃｍ^3）中の工程１の生成物（０．３７ｇ）を４時間、撹拌および加熱環流した。混合物を冷却し、水に注入し、酢酸エチルで抽出し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、化合物ＶＩＩ．４（０．３０ｇ）を得た。

M^+=275; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.32(2H,t);4.28(1H,m);7.60(1H,s);

（油）。
以下の本発明化合物を、対応するメルカプトチアゾール類から上記方法の工程２を用いて製造した：
（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール－４－カルボン酸エチル（化合物ＶＩＩ．８）
^1H
NMR: δ 1.40(3H,t); 2.48(2H,m); 3.32(2H,t); 4.28(1H,m); 4.40(2H,q); 8.03(1H,s);

（油）２－メルカプトチアゾール－４－カルボン酸エチルから。
（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルチアゾール－５－カルボン酸メチル（化合物ＶＩＩ．４１）
^1H NMR: δ 2.48(2H,m); 2.68(3H,s); 3.26(2H,t); 3.85(3H,s); 4.28(1H,m);

（油）、２－メルカプト－４－メチルチアゾール－４－カルボン酸メチルから。
（iii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－ニトロチアゾール（化合物ＶＩＩ．４７）
M^+=252; ^1H NMR:
δ 2.52(2H,m); 3.35(2H,m); 4.27(1H,m); 8.35(1H,s);

（油）、２－メルカプト－５－ニトロチアゾールから（２－ブロモ－５－ニトロチアゾールおよびチオ尿素から得た）
実施例ＶＩＩ．３
この実施例は５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．２４）の３工程製造法につき説明する。
工程１：２－（４－ブロモ－３，４，４－トリフルオロブチルチオ）チアゾール
１，４－ジブロモ－１，１，２－トリフルオロブタン（２７．０ｇ）を含有するアセトン（３０ｃｍ^3）中の２－メルカプトチアゾール（１１．７ｇ）を、窒素雰囲気下に無水炭酸カリウム（１３．８ｇ）少量ずつで処理した。反応物を１．５時間撹拌し、濾過し、不溶分をさらにアセトン（２５ｃｍ^{3}で４回）で洗浄した。濾液を減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン中の１０％酢酸エチル）により分画して、２－（４－ブロモ－３，４，４－トリフルオロブチルチオ）チアゾール（２９．５ｇ）を得た。
^1H NMR: δ 2.2-
2.5(2H,m); 3.2-3.6(2H,m); 4.7-5.0(1H,m); 7.23(1H,d); 7.68(1H,d).

工程２：２－（４－ブロモ－３，４，４－トリフルオロブチルチオ）－５－クロロチアゾール
ジクロロメタン（１３０ｃｍ^3）中の工程１から得た化合物（３０．６ｇ）を周囲温度においてジクロロメタン（３０ｃｍ^3）中の塩化スルフリル（９．６ｃｍ^3）で、１時間にわたって窒素雰囲気下で撹拌しながら処理した。反応物をさらに１時間撹拌し、徐々に水（２５０ｃｍ^3）に注入し、０．２５時間撹拌した。有機相を分離し、水相をジクロロメタンで抽出し（７５ｃｍ^{3}で２回）、有機相を合わせて炭酸水素ナトリウム水溶液、ブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン中の５％ジエチルエーテル）により分画して、２－（４－ブロモ－３，４，４－トリフルオロブチルチオ）－５－クロロチアゾール（２８．０ｇ）を得た。
^1H NMR: δ 2.20-2.45 (2H,m); 3.25-3.50(2H,m); 4.70-5.0(1H,m); 7.45(1H,s);

（油）。
工程３：化合物ＶＩＩ．２４

水（６００ｃｍ^3）中の亜鉛粉末（３３ｇ）をヨウ素（０．１７ｇ、触媒）と共に撹拌し、８０℃に加熱し、濃塩酸（０．５ｃｍ^3）、次いで工程２から得た化合物（１２５ｇ）を少量ずつ１．５時間にわたって窒素雰囲気下で添加した。さらに亜鉛（１６．６ｇ）、ヨウ素（０．１ｇ）および塩酸（０．６ｃｍ^3）を４時間にわたって少量ずつ添加して、反応を完結させた。混合物を周囲温度に冷却し、ケイソウ土によりジクロロメタンを溶剤として用いて濾過し、濾液をジクロロメタンで抽出した（２５０ｃｍ^{3}で５回）。有機相を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させ、残査をシリカ上でヘキサンを溶離剤とするクロマトグラフィーにより分画して、化合物ＶＩＩ．２４（１４０ｇ）を得た。

M^+=241; ^{1}H NMR: δ 2.42(2H,m); 3.20(2H,t); 4.25(1H,m); 7.45(1H,s);

（油）。

実施例ＶＩＩ．４

この実施例は５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１４）の製造につき説明する。

臭化水素酸２－アミノ－５－ブロモチアゾール（１１ｇ）を炭酸水素ナトリウム水溶液で処理し、ジクロロメタン中へ抽出し（２５０ｃｍ^{3}で２回）、乾燥させた（$MgSO_4$）。混合物を濾過し、濾液をビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）ジスルフィド（２０ｇ）に添加した。撹拌された溶液にジクロロメタン（４０ｃｍ^3）中の亜硝酸ｔ－ブチル（９．６ｃｍ^3）を周囲温度で窒素雰囲気下に滴加した。反応物を１８時間撹拌し、シリカ上へ蒸発させ、残渣をシリカの短いカラムに添加し、これを（１）ヘキサンおよび（２）ヘキサン：ジエチルエーテル２０：１（容量比）で溶離して、化合物ＶＩＩ．１４（６．４ｇ）を得た。

M^+=285; ^{1}H NMR: δ 2.46(2H,m); 3.24(3H,t); 4.27(1H,m); 7.54(1H,s);

（油）。

実施例ＶＩＩ．５

この実施例は、２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルチアゾール－５－スルホニルフルオリド（化合物ＶＩＩ．５２）を、実施例ＶＩＩ．４に示したものに代わるジアゾ化法で製造することにつき説明する。

アセトニトリル（１０ｃｍ^3）中の２－アミノ－４－メチルチアゾールスルホニルフルオリド（１．５ｇ）を、亜硝酸ｔ－ブチル（１．６５ｃｍ^3）およびビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）ジスルフィド（２．２５ｇ）の、アセトニトリル（５０ｃｍ^3）中における撹拌された混合物に、６０℃で窒素雰囲気下に滴加した。混合物を１時間加熱し、減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン：酢酸エチル４：１（容量比））により分画して、化合物ＶＩＩ．５２（１．８４ｇ）を得た。

M^+=303; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 2.68(3H,s); 3.32(2H,t); 4.28(1H,m);

（油）。

以下の本発明化合物を対応するアミノチアゾール類から上記方法で製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メチルチアゾール（化合物ＶＩＩ．２１）

M^+=221; ^{1}H NMR: δ 2.45(5H,m); 3.22(2H,t); 4.26(1H,m); 7.30(1H,s);

（油）２－アミノ－５－メチルチアゾールから。

（ii）５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．２４）

M^+=241; ^{1}H NMR: δ 2.45(2H,m); 3.22(2H,t); 4.26(1H,m); 7.45(1H,s);

（油）、２－アミノ－５－クロロチアゾールから、前記実施例ＶＩＩ．３に対する別法に

より。
（iii）５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルチアゾール（化合物ＶＩＩ．２７）
M^+=255; ^{1}H NMR: δ 2.35(3H,s); 2.42(2H,m); 3.18(2H,t); 4.26(1H,m);

（油）、２－アミノ－５－クロロ－４－メチルチアゾールから
実施例ＶＩＩ．６
この実施例は５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール－４－カルボン酸エチル（化合物ＶＩＩ．１１）の２工程製造法につき説明する。
工程１：２－アミノ－５－ブロモチアゾール－４－カルボン酸エチルの製造
濃臭化水素酸（９ｃｍ^3）中の２－アミノチアゾール－４－カルボン酸エチル（５．０ｇ）（ブロモピルビン酸エチルおよびチオ尿素から、対応するオキサゾールにつきＪ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．，１９７１，１４，１０７５に記載の方法により製造）を周囲温度で撹拌し、臭素（３．２ｇ）で滴加処理し、次いで６０℃に２時間加熱し、炭酸ナトリウムで中和し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。
有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、２－アミノ－５－ブロモチアゾール－４－カルボン酸エチル（１．５４ｇ）を得た。
MH^+=251; ^{1}H NMR: δ 1.40(3H,t); 4.40(2H,t); 5.6(2H,br s).

工程２：化合物ＶＩＩ．１１の製造
工程１からの生成物を前記実施例ＶＩＩ．５に記載したジアゾ化反応により処理して、化合物ＶＩＩ．１１を得た。
M^+=357; ^{1}H NMR: δ 1.40(3H,t); 2.50(2H,m); 3.30(2H,t); 4.30(1H,m); 4.45(2H,q);

（油）。
実施例ＶＩＩ．７
この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルチアゾール－５－スルホンアミドＮ，Ｎ－ジエチル（化合物ＶＩＩ．５６）の３工程製造法につき説明する。
工程１：２－アセトアミド－４－メチルチアゾール－５－スルホンアミドＮ，Ｎ－ジエチル
テトラヒドロフラン（１００ｃｍ^3）中の２－アセトアミド－４－メチルチアゾール－５－スルホニルクロリド（５．２ｇ）を周囲温度で撹拌し、ジエチルアミン（４．５ｃｍ^3）少量ずつで処理した。混合物を４時間撹拌し、減圧下で蒸発させ、残渣を酢酸エチル（２００ｃｍ^3）中へ抽出し、水で洗浄し（１００ｃｍ^{3}で２回）、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で再蒸発させて、２－アセトアミド－４－メチルチアゾール－５－スルホンアミドＮ，Ｎ－ジエチル（４．９ｇ）を得た。
^{1}H NMR: δ 1.20(6H,t); 2.28(3H,s); 2.57(3H,s); 3.32(4H,q); 9.7(1H,br s);

（固体）。
工程２：２－アミノ－４－メチルチアゾール－５－スルホンアミドＮ，Ｎ－ジエチル
工程１からの生成物（２．５ｇ）をメタノール（２５ｃｍ^3）に溶解し、窒素雰囲気下で撹拌しながら５℃に冷却した。メタノール中のナトリウムメトキシド（２５％ｗ／ｖ溶液２ｃｍ^3）を滴加し、混合物を１８時間で周囲温度に昇温させた。反応物を１時間加熱還流し、冷却し、水（２５０ｃｍ^3）で希釈し、ジエチルエーテルで抽出し（１００cm^{3}で２回）、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、２－アミノ－４－メチルチアゾール－５－スルホンアミドＮ，Ｎ－ジエチル（０．４８ｇ）を得た。
M^+249; ^{1}H NMR: δ 1.20(6H,t); 2.48(3H,s); 3.28(4H,q); 5.25(2H,br s);

（固体）。

工程３：化合物ＶＩＩ．５６の製造
工程２からの生成物を前記実施例ＶＩＩ．５に記載したジアゾ化反応により処理して、化合物ＶＩＩ．５６を得た。
M^+=356; ^{1}H NMR: δ 1.15(6H,t);

2.45(2H,m); 2.60(3H,s); 3.25(2H,t); 3.26(4H,q); 4.25(1H,m);

（油）。
実施例ＶＩＩ．８
この実施例は２－アミノ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１２８）の製造につき説明する。
臭化水素酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウム（１６．８７ｇ）を、水酸化カリウム（１８．０ｇ）の、エタノール（１５０ｃｍ^3）中における溶液に周囲温度で添加し、窒素雰囲気下で０．２時間撹拌した。エタノール（１５０ｃｍ^3）中の臭化水素酸２－アミノ－５－ブロモチアゾール（１７．７６ｇ）を少量ずつ添加し、混合物を４０℃に２時間加熱し、塩酸で中和し、減圧下で蒸発させた。残渣を２Ｍ塩酸に溶解し、ジエチルエーテルで抽出し、２Ｍ水酸化ナトリウムで塩基性化し、ジエチルエーテルで再抽出した。後者のエーテル抽出液を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、化合物ＶＩＩ．１２８（８．０ｇ）を得た。
M^+=222;

^{1}H NMR: δ 2.28(2H,m); 2.67(2H,t); 4.24(1H,m); 5.3(2H, 2 br s); 7.08(1H,s);

（融点３４．６－３５．４℃）。
実施例ＶＩＩ．９
この実施例は５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．８２）の製造につき説明する。
化合物ＶＩＩ．１２８（０．３０ｇ）を乾燥テトラヒドロフラン（１４ｃｍ^3）に溶解し、窒素雰囲気下で加熱還流した。テトラヒドロフラン（８ｃｍ^3）中の亜硝酸ｔ－ブチル（０．５２ｃｍ^3）を０．２５時間にわたって滴加し、混合物を２時間加熱し、さらに亜硝酸ｔ－ブチル（０．５２ｃｍ^3）を添加し、さらに２時間加熱を続けた。溶液を冷却し、減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン：酢酸エチル１：１（容量比））により分画して、化合物ＶＩＩ．１２８（０．１０ｇ）を得た。
^{1}H NMR: δ 2.28(2H,m); 2.82(2H,t); 4.24(1H,m); 7.86(1H,s); 8.86(1H,s);

（油）。
実施例ＶＩＩ．１０
この実施例は２－クロロ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１１４）の製造につき説明する。
アセトニトリル（５０ｃｍ^3）中の化合物ＶＩＩ．１２８（４．０ｇ）を０℃で、塩化銅（ＩＩ）（５．３８ｇ）および亜硝酸ｔ－ブチル（３．７１ｇ）の、アセトニトリル（５０ｃｍ^3）中における撹拌された混合物に添加し、１８時間にわたって徐々に周囲温度にまで昇温させた。溶剤を減圧下で蒸発させ、生成物をジエチルエーテルに溶解し、濾過し、濾液を再蒸発させると黄褐色液体が得られ、これをクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン：ジエチルエーテル４：１（容量比））により分画して、化合物ＶＩＩ．１１４（２．４３ｇ）を得た。
M^+=241; ^{1}H NMR: δ 2.28(2H,m); 2.68(2H,t); 4.22(1H,m); 7.52(1H,s)

（油）。
実施例ＶＩＩ．１１
この実施例は２－（４－シアノフェノキシ）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１３０）の製造につき説明する。

Ｎ－メチルピロリジン－２－オン（３ｃｍ^3）中の化合物ＶＩＩ．１１４（０．４８３ｇ）、４－シアノフェノール（０．２３８ｇ）、無水炭酸カリウム（０．２７６ｇ）およびフッ化セシウム（０．３０４ｇ）を一緒に窒素雰囲気下で撹拌し、９０℃に３６時間加熱した。反応混合物を水で希釈し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させ、残渣を厚層クロマトグラフィー（シリカ；ヘキサン：ジエチルエーテル４：１（容量比）で溶離）により分画して、化合物ＶＩＩ．１３０（０．１２５ｇ）を得た。

M^+=324; ^{1}H NMR: δ 2.28(2H,m); 2.80(2H,t); 4.20(1H,m); 7.40(2H,m); 7.75(2H,m);

（油）。

実施例ＶＩＩ．１２

この実施例は５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール－４－カルボン酸エチル（化合物ＶＩＩ．９８）の製造につき説明する。

乾燥テトラヒドロフラン（１５ｃｍ^3）中のイソシアノ酢酸エチル（２．３ｇ）を、カリウムｔ－ブトキシド（２．２４ｇ）の撹拌された混合物に－４０℃で窒素雰囲気下に添加した。１０分後に反応物を－７８℃に冷却し、テトラヒドロフラン（２０ｃｍ^3）中の二硫化炭素（１．５２ｇ）を徐々に添加した。添加が完了した時点で反応温度を　℃にまで昇温させ、テトラヒドロフラン（１０ｃｍ^3）中の４－メチル－ベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（５．２４ｇ）を添加した。混合物を周囲温度にまで昇温させ、　時間撹拌し、３時間加熱還流し、周囲温度に冷却した。反応混合物を２Ｍ塩酸水溶液に注入し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、溶剤を減圧下での蒸発により除去した。残渣をシリカゲル上で１：１ヘキサン：酢酸エチルにより溶離するカラムクロマトグラフィーによって、化合物ＶＩＩ．９８（３．１５ｇ）を得た。

^{1}H NMR δ

1.45(3H,t); 2.50(2H,m); 3.10(2H,t); 4.3–4.4(1H,m); 4.50(2H,q); 8.65(1H,s);

（油）。

実施例ＶＩＩ．１３

この実施例は５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール－４－カルボキシアミド（化合物ＶＩＩ．９４）の製造につき説明する。

メタノール（８ｃｍ^3）中の化合物ＶＩＩ．９８（０．５ｇ）をアンモニア水（３５ｃｍ^3；密度０．８８）と共に４時間撹拌した。化合物ＶＩＩ．９４が固体として得られ、これを溶液から濾過し、吸引乾固した（０．２７ｇ）。

^{1}H NMR δ 2.50(2H,m); 3.00(2H,t); 4.30–4.41(1H,m); 5.5 および 7.0(2H,broad); 8.55(1H,s);

（固体、融点１４０－１４１℃）。

以下の本発明化合物を対応するエステル類から上記方法で製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール－４－カルボキシアミド（化合物ＶＩＩ．７）

M^+=250; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.27(2H,t); 4.28(1H,m); 5.9 and 7.1(2H,br s); 8.03(1H,s);

（融点５７－５８℃）、化合物ＶＩＩ．８から。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルチアゾール－５－カルボキシアミド（化合物ＶＩＩ．３６）

^{1}H NMR: δ 2.48(2H,m); 2.66(3H,s) 3.26(2H,t); 3.85(3H,s); 4.28(1H,m); 5.7(2H,br s);

（融点９９－１００℃）、化合物ＶＩＩ．４１から。

実施例ＶＩＩ．１４

この実施例は－シアノ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．９０）の製造につき説明する。

乾燥ジクロロメタン（１３ｃｍ^3）中の化合物ＶＩＩ．９４（０．２７ｇ）をピリジン（１ｃｍ^3）および塩化メタンスルホニル（０．２６ｃｍ^3）で処理した。混合物を５日間撹拌し、さらに塩化メタンスルホニル（０．２ｃｍ^3）を添加し、再び２時間撹拌した。次いで反応物を２Ｍ塩酸水溶液に注入し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させた。残渣をシリカゲル上でクロマトグラフィー処理して化合物ＶＩＩ．９０（０．１４２ｇ）を得た。

^{1}H NMR δ 2.40(2H,m); 3.20(2H,t); 4.30(1H,m); 8.80(1H,s).

以下の本発明化合物を対応するカルボキシアミド類から上記方法で製造した：

（ｉ）４－シアノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール（化合物ＶＩＩ．６）

^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.32(2H,t); 4.26(1H,m); 7.86(1H,s);

（油）、化合物ＶＩＩ．７から。

（ii）５－シアノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルチアゾール（化合物ＶＩＩ．３２）

^{1} H NMR: δ 2.48(2H,m); 2.58(3H,s) 3.30(2H,t); 3.85(3H,s); 4.28(1H,m);

（油）、化合物ＶＩＩ．３６から。

実施例ＶＩＩ．１５

この実施例は５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール－４－カルボン酸（化合物ＶＩＩ．１３）の製造につき説明する。

水酸化ナトリウム水溶液（２Ｍ溶液１．２ｃｍ^3）を含有するメタノール（５ｃｍ^3）中の化合物ＶＩＩ．１１（０．３０ｇ）を周囲温度で１８時間撹拌し、水に注入し、２Ｍ塩酸で酸性化した。生成物を酢酸エチル中へ抽出し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて化合物ＶＩＩ．１３（０．１８ｇ）を得た。

M^+＝３２９；

^{1}H NMR: δ 2.48(2H,m); 3.30(2H,t); 4.28(1H,m); 7.0(1H,broad signal);

（融点８６．５－８７．５℃）。

以下の本発明化合物を対応するエステル類から上記方法で製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール－４－カルボン酸（化合物ＶＩＩ．１０）。M^+＝２５１；

^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.35(2H,t); 4.28(1H,m); 8.18(1H,s);

（融点１１４－１１５℃）、化合物ＶＩＩ．８から。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルチアゾール－５－カルボン酸（化合物ＶＩＩ．４５）

M^+=265; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 2.70(3H,s); 3.27(2H,t); 4.28(1H,m); 9.8(1H,broad signal);

（融点５２．０－５３．５℃）、化合物ＶＩＩ．４１から。

（iii）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）チアゾール－４－カルボン酸（化合物ＶＩＩ．１０２）

M^+=251; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.10(2H,t); 4.28(1H,m); 8.70(1H,s);

（融点１２８．５℃）、化合物ＶＩＩ．９８から。

実施例ＶＩＩ．１６

この実施例は、本発明化合物の製造に適した方法であって、酸化されていない対応する化合物の４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ置換基のイオウ原子を酸化してスルホキ

シド（スルフィニル）またはスルホン（スルホニル）となす方法につき説明する。
方法Ａ：オキシダントとしてペルオキシ一硫酸カリウムを使用
５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．２６）の製造
化合物ＶＩＩ．２４（４．８３ｇ）の、メタノール（５０ｃｍ^3）中における撹拌された溶液を８℃において、水（１００ｃｍ^3）中のペルオキシ一硫酸カリウム（２７．０ｇ）で、０．２５時間にわたって冷却しながら滴加処理し、さらにメタノール（５０ｃｍ^3）を添加した。反応物を周囲温度で１８時間撹拌し、不溶分を溶液から濾去し、濾液をジクロロメタンで抽出し（５０ｃｍ^{3}で４回）、乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で除去し、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン：酢酸エチル４：１（容量比））により分画して、化合物ＶＩＩ．２６（３．９１ｇ）を得た。
$M(NH4)^+$=291; ^{1}H NMR: δ 2.60(2H,m); 3.50(2H,t); 4.25(1H,m); 7.85(1H,s);

（油）。
方法Ｂ：ペルオキシフタル酸一マグネシウムを使用
５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１５）の製造
化合物ＶＩＩ．１４（１．５０ｇ）をジクロロメタン（１０ｃｍ^3）に溶解し、ペルオキシフタル酸一マグネシウム・６水和物（１．６ｇ、８０％ペルオキシ酸）および水（１５ｃｍ^3）で処理した。混合物を周囲温度で１時間撹拌し、ジクロロメタン（９０ｃｍ^3）で希釈し、有機相を炭酸水素ナトリウム水溶液および水で洗浄した。有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン：酢酸エチル１０：１（容量比））により分画して、化合物ＶＩＩ．１５（１．０ｇ）を得た。
$M(NH4)^+$=321; ^{1}H NMR: δ 2.38 (1H,m); 2.60(1H,m); 3.20(2H,m);

4.20(1H,m); 7.85(1H,s);

（油）。
以下の本発明化合物を対応するチオエーテル類から上記方法、方法Ｂで製造した：
（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．２）
MH^+=224; ^{1}H NMR: δ

2.36(1H,m); 2.50-2.70(1H,m); 3.20(2H,m); 4.22(1H,m); 7.67(1H,d); 7.98(1H,d);

（油）、化合物ＶＩＩ．１および１当量のオキシダントから。
（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．３）
MH^+=240; ^{1}H NMR: δ

2.55(2H,m); 3.45(2H,t); 4.24(1H,m); 7.78(1H,d); 8.08(1H,d);

（油）、化合物ＶＩＩ．１および２当量のオキシダントから。
（iii）５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１６）
$M(NH4)^+$=335; ^{1}H NMR: δ 2.58(2H,m); 3.46(2H,t); 4.25(1H,m); 7.96(1H,s);
（油）、化合物ＶＩＩ．１４および２当量のオキシダントから。
（iv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－メチルチアゾール（化合物ＶＩＩ．２２）
^{1}H NMR: δ

2.38(1H,m); 2.50-2.65(4H,m); 3.15(1H,m); 4.23(1H,m); 7.60(1H,q);

（油）、化合物ＶＩＩ．２１および１当量のオキシダントから。
（ｖ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－メチルチアゾール（化合物ＶＩＩ．２３）
^{1}H NMR: δ

2.55(2H,m); 2.60(3H,s); 3.45(2H,t); 4.25(1H,m); 7.73(1H,q);

（油）、化合物ＶＩＩ．２１および２当量のオキシダントから。
（vi）５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．２５）
$M(NH4)^+$=275; ^{1}H NMR: δ 2.38(1H,m); 2.60(1H,m); 3.18(2H,m); 4.25(1H,m);

7.74(1H,s);

（油）、化合物ＶＩＩ．２４および１当量のオキシダントから。
（vii）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．８３）
^{1}H NMR: δ

2.50(2H,m); 3.05(1H,m); 3.20(1H,m); 4.28(1H,m); 8.20(1H,s); 9.12(1H,s);

（油）、化合物ＶＩＩ．８２および１当量のオキシダントから。
（viii）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．８４）
^{1}H NMR: δ

2.50(2H,m); 3.30(2H,m); 4.25(1H,m); 8.20(1H,s); 9.12(1H,s);

（油）、化合物ＶＩＩ．８２および２当量のオキシダントから。
（ix）２－クロロ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１１５）
^{1}H NMR: δ

2.50(2H,m); 3.05(1H,m); 3.20(1H,m); 4.28(1H,m); 7.85(1H,s);

（油）、化合物ＶＩＩ．１１４および１当量のオキシダントから。
（ｘ）２－クロロ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チアゾール（化合物ＶＩＩ．１１６）
^{1}H NMR: δ 2.52(2H,m); 3.30(2H,m); 4.28(1H,m); 8.08(1H,s);

（油）、化合物ＶＩＩ．１１４および２当量のオキシダントから。
方法Ｃ：３－クロロ過安息香酸を使用
以下の本発明化合物を対応するチオエーテル類から上記方法、方法Ｂで、ただし３－クロロ過安息香酸をペルオキシフタル酸一マグネシウム・６水和物の代わりに用いて製造した：
（xi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チアゾール－４－カルボン酸エチル（化合物ＶＩＩ．９）
M^+=311; ^{1}H NMR: δ 1.43(3H,t); 2.60(2H,m); 3.56(2H,t); 4.28(1H,m); 4.48(2H,q);

8.50(1H,s);

（融点６４－６５℃）、化合物ＶＩＩ．８および２当量のオキシダントから。
（xii）５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）チアゾール－４－カルボン酸エチル（化合物ＶＩＩ．１２）

M+=389; ^{1}H NMR: δ 1.43(3H,t); 2.60(2H,m); 3.56(2H,t); 4.28(1H,m); 4.48(2H,q);

（融点７２－７３℃）、化合物ＶＩＩ．１１および２当量のオキシダントから。
（xiii）５－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－メチルチアゾール（化合物ＶＩＩ．２８）
^{1}H NMR: δ 2.55(2H,m); 2.45(3H,s); 3.40(2H,t); 4.25(1H,m);
（油）、化合物ＶＩＩ．２７および２当量のオキシダントから。
（xiv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－メチルチアゾール－５－カルボン酸メチル（化合物ＶＩＩ．４３）
^{1}H NMR: δ 2.60(2H,m); 2.85(3H,s); 3.50(2H,t); 3.95(3H,s); 4.25(1H,m);
（油）、化合物ＶＩＩ．４１および２当量のオキシダントから。
（xv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－メチルチアゾール－５－スルホニルフルオリド（化合物ＶＩＩ．５３）
^{1}H NMR: δ 2.60(2H,m); 2.85(3H,s); 3.55(2H,t); 4.28(1H,m);

（融点６７℃）、化合物ＶＩＩ．５２および２当量のオキシダントから。
実施例ＶＩＩＩ．１
この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．５）の製造につき説明する。
２－メルカプト－１－メチルイミダゾール（９．７８ｇ）の、アセトン（３００ｃｍ^3）中における溶液に、炭酸カリウム（１４．２ｇ）および４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（１６．１２ｇ）をアセトン（１００ｃｍ^3）中における溶液として添加した。混合物を１８時間加熱還流し、放冷した。反応混合物をソルブシル－Ｃ３０シリカのプラグで濾過し、酢酸エチルで洗浄することにより無機固体を除去した。濾液を減圧下で蒸発させて粗製化合物ＶＩＩＩ．５（１７．８ｇ）を得た。これは後続反応（実施例ＶＩＩＩ．７参照）に適していた。
一部（１ｇ）をソルブシル－Ｃ３０上で酢酸エチル：ヘキサン３：７により溶離するクロマトグラフィーによって精製して、純粋な化合物ＶＩＩＩ．５（０．７７６ｇ）を得た。
^{1}H NMR: δ 2.3-2.4(2H,m); 3.05-3.15(2H,t); 3.60(3H,s); 4.15-4.35(1H,m); 6.95(1H,s); 7.05(1H,s);
（油）。
以下の本発明化合物を、適宜なメルカプトイミダゾールを用いて上記方法で製造した：
（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－フェニルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３）
M+=266; ^{1}H NMR: δ 2.3-2.4(2H,m); 3.1-3.15(2H,t); 4.1-4.25(1H,m); 7.1-7.2(2H,m); 7.3-7.55(5H,m);
（油）。
（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－エチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．１０）
M+=218; ^{1}H NMR: δ 1.4(3H,t); 2.3-2.4(2H,m); 3.15(2H,t); 4.0(2H,q); 4.2-4.35(1H,m); 6.95(1H,s); 7.1(1H,s);
（油）。
（iii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－エチル－５－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．２７）

M+=232; 1H NMR: δ 1.15(3H,t); 2.15(3H,s); 2.35-2.45(2H,m); 2.5-2.6(2H,q); 2.95(2H,t); 4.1-4.3(1H,m);

（融点５４－５６℃）。
（iv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．５８）
M+=204; 1H NMR: δ 2.25-2.35(5H,m); 3.0(2H,t); 4.15-4.3(1H,m); 6.75(1H,s);

（油）。
（ｖ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－エトキシカルボニルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．６４）
M+=262; 1H NMR: δ 1.3-1.35(3H,t); 2.25-2.35(2H,m); 3.05-3.15(2H,t); 4.1-4.25(1H,m); 4.3-4.4(2H,q); 7.8(1H,br s);

（融点５７．８－６１℃）
（vi）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）イミダゾ－［１，５ａ］－ピリジン（化合物ＶＩＩＩ．１５１）
1H NMR: δ 2.30 (2H,m); 3.00(2H,t); 4.20(1H,m); 6.65(1H,m); 6.80(1H,m); 7.45(1H,dt); 7.55(1H,s); 8.15(1H,dd);

（油）、２，３－ジヒドロイミダゾ－［１，５ａ］－ピリジン－３－チオンから。
実施例ＶＩＩＩ．２
この実施例は、クロマトグラフィーにより分離しうる混合物としての２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．１）および１－（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．８）の製造につき説明する。
２－メルカプト－イミダゾール（１０．０１ｇ）の、アセトン（４００ｃｍ^3）中における溶液に、炭酸カリウム（２０．７３ｇ）および４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（１８．７９ｇ）を添加した。混合物を１８時間加熱還流し、放冷した。反応混合物をソルブシル－Ｃ３０シリカのプラグで濾過し、酢酸エチルで洗浄することにより無機固体を除去した。濾液を減圧下で蒸発させると淡褐色の油（１９．２ｇ）が得られ、これをシリカ上でヘキサン中の１５％酢酸エチルからヘキサン中の５０％酢酸エチルまで漸増させて溶離するクロマトグラフィー処理した。２つの主画分が得られ、そのうち最初のもの（７．４ｇ）はＴＬＣにより２生成物を含有することが示された。第２画分（１０．７５ｇ）（白色固体として得られた）は純粋な化合物ＶＩＩＩ．１であることが示された。第１画分をさらに上記に従ってクロマトグラフィー処理して、化合物ＶＩＩＩ．８（１．６１ｇ）；
M+=280; 1H NMR: δ 2.3-2.45(4H,m); 3.1-3.15(2H,t); 3.9-4.0(2H,t); 4.05-4.3(2H,m); 6.95(1H,s); 7.05(1H,s);

（油）、および化合物ＶＩＩＩ．１（５．３１ｇ）を得た。この化合物ＶＩＩＩ．１の試料を酢酸エチルおよびヘキサンから再結晶して４．２ｇを得た。これは下記を有していた：
M+=190; 1H NMR: δ 2.3-2.4(2H,m); 3.0-3.1(2H,t); 4.15-4.3(1H,m); 7.0-7.1(2H,br s); 9.2(1H,br s);

（融点５８．６－５９．６℃）。

実施例ＶＩＩＩ．３

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－フェニルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．１９）の製造につき説明する。

クロロホルム（７ｃｍ^3）中の臭化フェナシル（１．６１１ｇ）を、８４％エタノール／水（２０ｃｍ^3）中の臭化水素酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウム（２ｇ）に添加し、炭酸水素ナトリウム（２．７２ｇ）を撹拌しながら徐々に添加した。得られた黄色の懸濁液を３時間加熱還流した。混合物を冷却し、溶剤を減圧下での蒸発により除去した。残渣を温水で２回洗浄し（２０ｃｍ^{3}で２回）、これをデカントして無機物質を除去した。こうして得た粗生成物をシリカ上でヘキサン中の２０％酢酸エチルにより溶離するクロマトグラフィーによって精製し、生成物含有画分をトルエン中の５％酢酸エチルにより再度カラム処理した。これにより化合物ＶＩＩＩ．１９（０．７８ｇ）を得た。

M^+=266; ^{1}H NMR: δ 2.3-2.4(2H,m); 3.05-3.1(2H,t); 4.15-4.3(1H,m); 7.2-7.4(4H,m); 7.6-7.75(2H,br s)

副生物である対応するＮ－フェナシル誘導体は含有されなかった。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－メチル－４－フェニルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．２２）

M^+=280; ^{1}H NMR: δ 2.35-2.45(2H,m); 3.10-3.18(2H,t); 3.65(3H,s); 4.19-4.35(1H,m); 7.2-7.25(2H,m); 7.33-7.38(2H,t); 7.72-7.78(2H,d)

（油）、臭化水素酸Ｎ－メチル４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウムを用いて。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－エチル－４－メトキシカルボニル－１－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．６８）

M^+=290; ^{1}H NMR: δ 1.2-1.25(3H,t); 2.35-2.45(2H,m); 2.8-2.9(2H,q); 3.2-3.25(2H,t); 3.78(3H,s); 3.85(3H,s); 4.16-4.32(1H,m);

（油）、臭化水素酸Ｎ－メチル４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウムおよび２－ブロモ－３－オキソペンタン酸メチルを用いて。

実施例ＶＩＩＩ．４

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４，５－ジメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．２９）の製造につき説明する。

炭酸カリウム（１８．９ｇ）および臭化水素酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウム（１６．９ｇ）を、３－ブロモブタン－２－オン（１０．３２ｇ）の、ジメチルホルムアミド（１００ｃｍ^3）中における溶液に添加し、混合物を６０℃で９０分間、次いで８０℃で３０分間撹拌した。得られた混合物を冷却し、水（１００ｃｍ^3）を添加し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した。有機相を合わせて水およびブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。減圧下での蒸発により濃縮すると淡橙色液体（１２．２ｇ）が得られ、これをソルブシルＣ３０シリカ上でヘキサン中の３０％酢酸エチルにより溶離するクロマトグラフィーによって精製した。３成分が得られた。溶離した第１成分は３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ブタン－２－オン（０．６８ｇ）と同定された；

M^+=194; ^{1}H NMR: δ 1.4(3H,d); 2.15-2.3(5H,m); 2.45(2H,t); 3.3-3.4(1H,q); 4.1-4.35(1H,m).

溶離した第２成分が目的化合物ＶＩＩＩ．２９（４．１ｇ）であった；

M^+=218; ^{1}H NMR: δ 2.15(6H,s) 2.25-2.35(2H,m); 2.9-3.0(2H,t); 4.15-4.3(1H,m);

（融点８１．４－８４．４℃）。溶離した第３成分は、３－ブロモブタン－２－オンでさらにＮ－アルキル化された化合物ＶＩＩＩ．２９、すなわちＮ－（１－メチルプロパン－２－オン）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４，５－ジメチルイミダゾール（１．１１ｇ）と同定された；

M^+=217; ^{1}H NMR: δ 1.55(3H,s); 2.0(3H,s); 2.05(3H,s); 2.15(3H,s); 2.3-2.4(2H,m); 3.0-3.05(2H,t); 4.15-4.35(1H,m); 5.0-5.1(1H,m);

（油）。

実施例ＶＩＩＩ．５

この実施例は、２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－プロピルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．１２）を、対応するＮ－Ｈイミダゾールである化合物ＶＩＩＩ．１からヨウ化プロピルを用いるアルキル化により製造することにつき説明する。

化合物ＶＩＩＩ．１（２ｇ）を少量ずつ（泡立つ）、水素化ナトリウム（油中６０％固体０．７３６ｇ）の、ジメチルホルムアミド（２０ｃｍ^3）中における懸濁液に窒素雰囲気下で添加した。混合物を３０分間撹拌したのち、ヨウ化ｎ－プロピル（２．６８ｇ）を添加し、反応混合物を周囲温度で１８時間撹拌した。次いで水およびジエチルエーテルを添加し、生成物をエーテル中へ抽出した。有機相を合わせて水および飽和ブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。濾過したのち、減圧下での蒸発により溶剤を除去して粗生成物（２．７ｇ）を得た。これをソルブシルＣ－３０上で酢酸エチル：ヘキサン３：７により溶離するクロマトグラフィーによって精製して、化合物ＶＩＩＩ．１２（２．１５ｇ）を得た。

M^+=232; ^{1}H NMR: δ 0.9-0.95(3H,t); 1.75-1.85(2H,m); 2.3-2.45(2H,m); 3.1-3.15(2H,t); 3.85-3.95(2H,t); 4.15-4.35(1H,m); 6.9(1H,s); 7.1(1H,s);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で、適宜なアルキル化剤および出発Ｎ－Ｈイミダゾールを用いて製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－（１－メチルエチル）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．１４）

M^+=232; ^{1}H NMR: δ 1.4(6H,d); 2.3-2.4(2H,m); 3.1-3.15(2H,t); 4.15-4.3(1H,m); 4.5-4.6(1H,m); 7.0(1H,s); 7.1(1H,s);

（油）、化合物ＶＩＩＩ．１から。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，４，５－トリメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３１）；

^{1}H NMR: δ 2.15(6H,two s); 2.25-2.35(2H,m); 2.95(2H,t); 3.5(3H,s); 4.15-4.3(1H,m);

（油）、化合物ＶＩＩＩ．２９から。

（iii）１－エチル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４，５－ジメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３３）；

^{1}H NMR: δ 1.25(3H,t); 2.15(6H,br s); 2.3-2.4(2H,m); 3.0(2H,t); 3.9-3.95(2H,q); 4.15-4.3(1H,m);

（油）、化合物ＶＩＩＩ．２９から。

（iv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，５－ジメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３５）および２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－

１，４－ジメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．６０）の混合物
^{1}H NMR: δ 2.15(3H,s); 2.3-2.4(2H,m); 3.0-3.05(2H,t); 3.5 および 3.55(3H, 2 s); 4.15-4.3(1H,m); 6.65 および 6.80(1H,two s)

化合物ＶＩＩＩ．５８から。
（ｖ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メチル－１－（１－メチルエチル）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３７）および２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－メチル－１－（１－メチルエチル）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．６２）の混合物；主として後者の異性体であることが示された；
^{1}H NMR: δ 1.35(6H,d); 2.2(3H,s); 2.3-2.4(2H,m); 3.05(2H,t); 4.15-4.3(1H,m); 4.5-4.6(1H,m); 6.70(1H,s)

化合物ＶＩＩＩ．５８から。
（vi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－エトキシカルボニル－１－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．５２）
M$^+$=276; ^{1}H NMR: δ 1.32-1.40(3H,t); 2.37-2.47(2H,m); 3.2-3.3(2H,t); 3.82(3H,s); 4.17-4.32(1H,m); 4.25-4.35(2H,q); 7.7(1H,s);

（油）、化合物ＶＩＩＩ．６４から。この反応により、クロマトグラフィーで分離しうる化合物ＶＩＩＩ．５２と化合物ＶＩＩＩ．６５の混合物が生成し、前者が最初に溶離した。
（vii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－エトキシカルボニル－１－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．６５）
M$^+$=276; ^{1}H NMR: δ 1.35-1.40(3H,t); 2.35-2.42(2H,m); 3.20-3.27(2H,t); 3.63(3H,s); 4.15-4.30(1H,m); 4.3-4.4(2H,q); 7.60(1H,s);

（油）、化合物ＶＩＩＩ．６４から。

実施例ＶＩＩＩ．６

この実施例は、２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－Ｎ－（メタンスルホニル）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．１８）の製造につき説明する。
化合物ＶＩＩＩ．１（０．４９ｇ）の、乾燥テトラヒドロフラン（３ｃｍ^3）中における溶液を、水素化ナトリウム（油中５５％、０．１２ｇ、使用前にヘキサンで洗浄）の、乾燥テトラヒドロフラン（５ｃｍ^3）中における懸濁液（冷水浴中で冷却）に添加した。反応混合物を周囲温度で２時間撹拌し、次いで塩化メタンスルホニル（０．３ｇ）を添加し、反応物をさらに１６時間撹拌した。反応混合物を酢酸エチル／水に注入し、層を分離した。水層を酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて、黄色の油を得た。シリカゲル上で３：７酢酸エチル：ヘキサンを用いるカラムクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＶＩＩＩ．１８（０．３１ｇ）を得た。
^{1}H NMR δ 2.40-2.50(2H,m); 3.30 (2H,t); 3.30(3H,s); 4.25(1H,m); 7.05(1H,d); 7.35(1H,d);

（油）。

実施例ＶＩＩ．７

この実施例は、酸化されていない対応する化合物の４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ置換基のイオウ原子を酸化してスルホキシド（スルフィニル）またはスルホン（スルホニル）となすことによる、本発明化合物の製造に適した方法につき説明する。

化合物ＶＩＩＩ．５からの化合物ＶＩＩＩ．７の製造

化合物ＶＩＩＩ．５（１８．１ｇ）を０℃に冷却し、ジクロロメタン（４００ｃｍ^3）および３－クロロ過安息香酸（水湿潤固体６１．２ｇ、２当量）を添加した。混合物を周囲

温度で１８時間撹拌し、次いで飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注入した。生成物をジクロロメタン中へ抽出し、有機相を水および飽和ブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。減圧下で溶剤を蒸発させて、粗製化合物ＶＩＩＩ．７を得た。これをシリカゲル上でヘキサン中１５％酢酸エチルからヘキサン中５０％酢酸エチルにまで漸増させて溶離するクロマトグラフィー処理して、純粋な化合物ＶＩＩＩ．７を得た。

^{1}H NMR: δ 2.55-2.6(2H,m); 3.5-3.55(2H,t); 4.0(3H,s); 4.15-4.3(1H,m); 7.0(1H,s); 7.15(1H,s);

（油）。

以下の本発明化合物を上記実施例ＶＩＩＩの方法で、別途明記しない限り２当量のオキシダントを適宜な出発チオエーテルと共に用いて製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．２）

MH^+=223; ^{1}H NMR: δ 2.4-2.6(2H,m); 3.4-3.45(2H,t); 4.1-4.3(1H,m); 7.3-7.4(3H,br s);

（白色固体、融点１１３－１１４℃）。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１－フェニルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．４）

M^+=298; ^{1}H NMR: δ 2.45-2.55(2H,m); 3.45-3.55(2H,t); 4.15-4.3(1H,m); 7.2(1H,d); 7.25(1H,d); 7.45-7.55(5H,m);

（油）。

（iii）１－（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．９）

M^+=312; ^{1}H NMR: δ 2.5-2.65(4H,m); 3.5-3.6(2H,t); 4.1-4.35(2H,m); 4.4-4.45(2H,t); 7.05(1H,s); 7.15(1H,s);

（油）。

（iv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１－エチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．１１）

M^+=250; ^{1}H NMR: δ 1.5(3H,t); 2.5-2.65(2H,m); 3.5-3.6(2H,t); 4.15-4.35(1H,m); 4.4-4.45(2H,q); 7.05(1H,s); 7.15(1H,s);

（油）。

（ｖ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１－プロピルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．１３）

MH^+=265; ^{1}H NMR: δ 0.9-1.0(3H,t); 1.8-2.0(2H,m); 2.5-2.6(2H,m); 3.5-3.6(2H,t); 4.15-4.35(3H,m); 7.05(1H,s); 7.15(1H,s);

（油）。

（vi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１－（１－メチルエチル）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．１５）

M+=264; ^{1}H NMR: δ 1.5(6H,d); 2.55-2.65(2H,m); 3.5-3.6(2H,m); 4.15-4.35(1H,m); 5.15-5.35(1H,m); 7.15(2H,br);

（油）。

（vii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－４－フェニルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．２０）

M+=282; ^{1}H NMR: δ 2.35-2.65(2H,m); 3.25-3.4(2H,t); 4.15-4.3(1H,m); 7.25-7.5(4H,m); 7.6-7.8(2H,m);

（油）、１．５当量のオキシダントを用いて。

（viii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－フェニルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．２１）

M+=298; ^{1}H NMR: δ 2.45-2.6(2H,m); 3.4-3.5(2H,t); 4.1-4.28(1H,m); 7.3-7.55(4H,m); 7.7-7.75(2H,d);

（融点１０９．６－１１０．４℃）、１．５当量のオキシダントを用いて。

（ix）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－１－メチル－４－フェニルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．２３）

M+=296; ^{1}H NMR: δ 2.5-2.65(2H,m); 3.4-3.65(2H,m); 4.0(3H,s); 4.25-4.4(1H,m); 7.25-7.45(4H,m); 7.7-7.75(2H,dd);

（融点１０６－１０６．６℃）、１．５当量のオキシダントを用いて。

（ｘ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１－メチル－４－フェニルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．２４）

M+=312; ^{1}H NMR: δ 2.6-2.7(2H,m); 3.58-3.65(2H,t); 4.02(3H,s); 4.2-4.35(1H,m); 7.25-7.42(4H,m); 7.7-7.75(2H,dd);

（融点７８．６－７９．６℃）、１．５当量のオキシダントを用いて。

（xi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－エチル－５－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．２８）

M+=264; ^{1}H NMR: δ 1.15-1.3(3H,q); 2.25(3H, 2 s (互变异性体)); 2.45-2.7(4H,m); 3.35-3.45(2H,t); 4.1-4.3(1H,m); 11.3(1H,br s);

（油）。

（xii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４，５－ジメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３０）

M+=250; ^{1}H NMR: δ 2.25(6H,two s); 2.45-2.55(2H,m); 3.35(2H,t); 4.1-4.25(1H,m); 10.3-10.6(1H,br s);

（融点１１３．４－１１４．６）。

（xiii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，４，５－トリメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３２）

M+=264; ^{1}H NMR: δ 2.2(6H,br s); 2.5-2.6(2H,m); 3.4-3.5(2H,t); 3.85(3H,s); 4.15-4.3(1H,m);

（油）。

（xiv）１－エチル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４，５－ジメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３４）

M⁺=278; ^{1}H NMR: δ 1.4(3H,t); 2.15(6H,br s); 2.5-2.6(2H,m); 3.5(2H,t); 4.15-4.3(1H,m);

（油）。

（xv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，５－ジメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３６）と２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，４－ジメチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．６１）の混合物；

^{1}H NMR: δ 2.20(3H,s); 2.25(3H,s); 2.5-2.6(4H,m); 3.45-3.55(4H,m); 3.85(3H,s); 3.95(3H,s); 4.15-4.3(2H,m); 6.75(1H,s); 6.95(1H,s);

前記実施例ＶＩＩＩ．５（iv）で製造した化合物ＶＩＩＩ．３５と化合物ＶＩＩＩ．６０の混合物から。

（xvi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－メチル－１－（１－メチルエチル）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．３８）；

^{1}H NMR: δ 1.55(6H,d); 2.4(3H,s); 2.55-2.65(2H,m); 3.6(2H,t); 4.15-4.35(1H,m); 5.15-5.30(1H,m); 6.85(1H,s);

と２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－メチル－１－（１－メチルエチル）イミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．６３）

^{1}H NMR: δ 1.45(6H,d); 2.25(3H,s); 2.55-2.65(2H,m); 3.55(2H,t); 4.15-4.35(1H,m); 5.15-5.30(1H,m); 6.90(1H,s);

の１８：８２混合物；前記実施例ＶＩＩＩ．５（ｖ）で製造した化合物ＶＩＩＩ．３７と化合物ＶＩＩＩ．６２の混合物から。

（xvii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－エトキシカルボニル－１－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．５３）

M⁺=308; ^{1}H NMR: δ 1.37-1.42(3H,t); 2.55-2.67(2H,m); 3.6-3.65(2H,t); 4.2-4.35(1H,m); 4.25(3H,s); 4.32-4.4(2H,q); 7.7(1H,s);

（油）。

（xviii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．５９）；M^+＝２３６；

^{1}H NMR: δ 2.3-2.4(3H,br); 2.45-2.55(2H,m); 3.4(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 7.0(1H,br);

（油）。

（xix）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－４－エトキシカルボニル－１－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．６６）

M⁺=292; ^{1}H NMR: δ 1.35-1.4(3H,t); 2.49-2.7(2H,m); 3.35-3.6(2H,m); 4.02(3H,s); 4.2-4.38(1H,m); 4.35-4.42(2H,q); 7.67(1H,s);

（油）、１．５当量のオキシダントを用いて。

（xx）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－４－エトキシカルボニル－１－メチルイミダゾール（化合物ＶＩＩＩ．６７）

M⁺=308; ^{1}H NMR: δ 1.35-1.4(3H,t); 2.55-2.65(2H,m); 3.65-3.70(2H,t); 4.02(3H,s); 4.2-4.38(1H,m); 4.35-4.42(2H,q); 7.65(1H,s);

（油）、１．５当量のオキシダントを用いて。

（xxi）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）イミダゾ－［１．５ａ］－ピリジン（化合物ＶＩＩＩ．１５２）：

M⁺=

272; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.50(2H,t); 4.15(1H,m); 6.90(1H,m); 7.10(1H,m); 7.20(1H,s); 7.65(1H,m); 8.95(1H,dd);

（油）。

実施例ＩＸ．１

この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３－ジメチル－４－ニトロピラゾール（化合物ＩＸ．８２）の製造につき説明する。

臭化水素酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウム（２．４６ｇ）を周囲温度で水酸化ナトリウム水溶液（水１２ｃｍ^{3}中１．２ｇ）と共に０．３時間撹拌した。臭化テトラ－ｎ－ブチルアンモニウム（０．０１ｇ、触媒）を含有するジクロロメタン（１２ｃｍ^3）中の５－クロロ－１，３－ジメチル－４－ニトロピラゾール（１．７６ｇ）を周囲温度で添加し、反応混合物を窒素雰囲気下で１８時間撹拌した。反応物を水（１００ｃｍ^3）で希釈し、生成物をジクロロメタン（１００ｃｍ^3）中へ抽出した。有機相を合わせて水で洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、淡黄色液体（２．６ｇ）を得た。試料（０．９ｇ）をクロマトグラフィー（シリカ；ヘキサン：酢酸エチル１０：１（容量比））により分画して、化合物ＩＸ．８２（０．７８ｇ）を得た。

M⁺=263; ^{1}H NMR: δ 2.25(2H,m); 2.55(3H,s); 3.08(2H,t); 3.94(3H,s); 4.20(1H,m);

（油）。

実施例ＩＸ．２

この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，３－ジメチル－４－ニトロピラゾール（化合物ＩＸ．８４）の製造につき説明する。

３－クロロ過安息香酸（固体５０重量％のもの１．７４ｇ）を、化合物ＩＸ．８２（０．５２６ｇ）の、ジクロロメタン（１０ｃｍ^3）中における溶液に添加し、反応物を周囲温度で３日間撹拌した。反応物をジクロロメタン（１００ｃｍ^3）で希釈し、炭酸水素ナトリウム水溶液、次いで水で洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、油状固体を得た。粗生成物をクロマトグラフィーにより分画して、化合物ＩＸ．８４（０．１５ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.52(3H,m); 2.60(2H,m); 3.74(2H,t); 4.20(3H,s); 4.25(1H,m);

（ガム）。

実施例ＩＸ．３

この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３－ジメチル－４－ヨードピラゾール（化合物ＩＸ．６１）の３工程製造法につき説明する。

工程１：４－アミノ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３－ジメチルピラゾールの製造

化合物ＩＸ．８２（１．０ｇ）を、水（２ｃｍ^3）および濃塩酸（０．１ｃｍ^3、触媒）を含有するプロパン－２－オール（１０ｃｍ^3）に溶解し、還元した鉄粉末（１．０ｇ）で処理した。混合物を３時間、撹拌および加熱還流し、冷却し、固体炭酸水素ナトリウムで中和し、ケイソウ土で濾過した。不溶分をプロパン－２－オールで洗浄し、濾液を減圧下で蒸発させて、アミノピラゾール中間体を赤褐色の油（１．０ｇ）として得た。M^+＝２３３。

工程２：

工程１からの生成物（4.6g）を乾燥ジクロロメタン（２５ｃｍ^3）に溶解し、三フッ化ホウ素ジエチルエーテレート（４．２６ｇ）の、乾燥ジクロロメタン（２５ｃｍ^3）中における撹拌された溶液に－１５℃で添加した。ジクロロメタン（１０ｃｍ^3）中の亜硝酸ｔ－ブチルを混合物に滴加した。反応物を０．３時間で５℃にまで昇温させ、ヘキサンで希釈し、目的とするジアゾニウムテトラフルオロホウ酸塩を溶液から褐色固体（６．７ｇ）

として濾過した。

工程３：化合物ＩＸ．６１

工程１からの生成物（１．３３ｇ）をヨウ化カリウム（１．７ｇ）の、水（５ｃｍ^3）中における撹拌された溶液に３５℃で少量ずつ添加した。反応混合物は処理に際してガスを発生し、赤褐色の油となった。３５℃で１時間後に混合物を冷却し、水で希釈し、ジエチルエーテル（１００ｃｍ^3）で抽出し、有機相を順次、メタ重亜硫酸ナトリウム、次いで水で洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で除去し、残留する油をクロマトグラフィー（シリカ；ヘキサン：酢酸エチル１０：１（容量比））により分画して、化合物ＩＸ．６１を褐色の油（０．２ｇ）として得た。M^+＝３４４

実施例ＩＸ．４

この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３－ジメチル－ピラゾール（化合物ＩＸ．５５）の製造につき説明する。

実施例ＩＸ．３の工程２から得たジアゾニウム塩（２．０ｇ）をメタノール（２０ｃｍ^3）中で０℃において撹拌し、水素化ホウ素ナトリウム（粉末、０．２５ｇ）を少量ずつ添加した。ガスが発生し、溶液は無色から橙褐色へと変化した。混合物を０．５時間で１５℃にまで昇温させ、周囲温度で１８時間保存し、水で希釈し、ジエチルエーテルで抽出し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて、赤褐色液体を得た。この液体をクロマトグラフィー（シリカ；ヘキサン：ジエチルエーテル１：１（容量比））により分画して、化合物ＩＸ．５５（０．４２ｇ）を得た。

M^+=218; ^{1}H NMR: δ 2.20-2.30(5H,m); 2.74(2H,m); 3.75(3H,s); 4.23(2H,m); 6.12(1H,s);

（油）。

実施例ＩＸ．５

この実施例は、エチル５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－メチルピラゾール－４－イルカルボキシレート（化合物ＩＸ．３４）の製造につき説明する。

アセトニトリル（４０ｃｍ^3）中のビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）ジスルフィド（２．９０ｇ）および亜硫酸ｔ－ブチル（１．２２ｇ）を窒素雰囲気下で６０℃に加熱した。この撹拌された溶液に、アセトニトリル（１０ｃｍ^3）中の５－アミノ－１－メチルピラゾール－４－イルカルボン酸エチル（１．００ｇ）を滴加した。添加が終了した時点で反応溶液を６０℃に２時間加熱し、減圧下で蒸発させ、クロマトグラフィー（シリカ；ヘキサン：ジエチルエーテル５：１（容量比））により分画して、化合物ＩＸ．３４（収率４２％）を得た。

M^+=276; ^{1}H NMR: δ 1.38(3H,t); 2.20(2H,m); 3.05(2H,t); 3.97(3H,s); 4.25(1H,m); 4.34(2H,q); 7.98(1H,s);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法および適宜なアミノ－ピラゾールを用いて製造した：

（ｉ）４－ブロモ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－メチルピラゾール（化合物ＩＸ．３１）

M^+=282; ^{1}H NMR: δ 2.32(2H,m); 2.95(2H,t); 3.88(3H,s); 4.30(1H,m); 7.38(1H,s);

（油）。

（ii）４－シアノ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３－ジメチルピラゾール（化合物ＩＸ．７３）；

^{1}H NMR: δ 1.38(3H,t); 2.20(2H,m); 2.38(3H,s); 3.02(2H,t); 3.97(3H,s); 4.25(1H,m);

（油）。

（iii）エチル５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－フェニルピラゾール－４－イルカルボキシレート（化合物ＩＸ．１２４）

M^+=338; ^{1}H NMR: δ 1.40(3H,t); 2.05(2H,m); 2.88(2H,t); 3.97(1H,m); 4.37(2H,q); 7.50(5H,m); 8.16(1H,s);

（油）。

実施例ＩＸ．６

この実施例は、４－シアノ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，３－ジメチルピラゾール（化合物ＩＸ．７５）の製造につき説明する。

ジクロロメタン（１２０ｃｍ^3）中の化合物ＩＸ．７３（１．３２ｇ）を、周囲温度において３－クロロ過安息香酸（過酸５０％を含有するもの３．９４ｇ）で処理した。混合物を１８時間撹拌し、さらにジクロロメタンで希釈し、順次、炭酸ナトリウム水溶液、メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液で洗浄した。さらに水、炭酸ナトリウム、および水による洗浄を行ったのち、有機相を乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させ、残渣をクロマトグラフィー（シリカ；ヘキサン：ジエチルエーテル１：１（容量比））により分画して、化合物ＩＸ．７５（０．４７ｇ）を得た。

M^+=275; ^{1}H NMR: δ 2.42(3H,s); 2.30(2H,m); 2.58(3H,s); 3.38(2H,t); 4.14(3H,s); 4.36(1H,m);

（融点７８－８１℃）。

以下の本発明化合物を上記方法および適宜なピラゾールを用いて製造した：

（ｉ）４－ブロモ－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１－メチルピラゾール（化合物ＩＸ．３３）

^{1}H NMR: δ 2.54(2H,m); 3.35(2H,t); 4.00(3H,s); 4.27(1H,m); 7.55(1H,s);

（融点４２．６－４３．６℃）、化合物ＩＸ．３１から。

（ii）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１－メチルピラゾール－４－カルボン酸エチル（化合物ＩＸ．３６）

^{1}H NMR: δ 1.38(3H,t); 2.50(2H,m); 3.78(2H,t); 4.15-4.30(1H,m); 4.36(2H,q); 7.95(1H,s);

（油）、化合物ＩＸ．３４から。

（iii）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１－フェニルピラゾール－４－カルボン酸エチル（化合物ＩＸ．１２６）

^{1}H NMR: δ 1.42(3H,t); 2.45(2H,m); 3.72(2H,t); 4.18(1H,m); 4.40(2H,q); 7.35-7.55(5H,m); 8.13(1H,s);

（融点６２．５－６３．０℃）、化合物ＩＸ．１２４から。

実施例ＩＸ．７

この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－メチルピラゾール－４－カルボン酸（化合物ＩＸ．４０）および５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－メチルピラゾール－４－カルボン酸プロパン－２－イル（化合物ＩＸ．３７）の製造につき説明する。

化合物ＩＸ．３４（１．５ｇ）をプロパン－２－オール（４０ｃｍ^3）に溶解し、２Ｍ水酸化ナトリウム水溶液（８ｃｍ^3）で処理し、周囲温度で１８時間撹拌した。混合物を水（１００ｃｍ^3）で希釈し、２Ｍ塩酸水溶液で酸性化し、酢酸エチルで抽出した（５０ｃｍ^{3}で３回）。有機相を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させると黄色の油が得られ、これはヘキサン／ジエチルエーテルで処理すると凝固した。この固体を溶液から濾過し、ヘキサンで洗浄し、吸引乾固して化合物ＩＸ．４０（０．７６ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.24(2H,m); 3.06(2H,t); 4.00(3H,s); 4.20(1H,m); 8.08(1H,s);

（融点５９．４－６０．０℃）。
ヘキサン／ジエチルエーテル濾液を減圧下で蒸発させ、油（化合物ＩＸ．３７を、工程１からのエチルエステル出発物質約１０％と共に含有する）を、ナトリウムメトキシド（エステル交換触媒、１０ｍｇ）を含有するプロパン－２－オール（２０ｃｍ^3）で処理し、混合物を５時間加熱還流した。反応物を冷却し、水で希釈し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した。有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて化合物ＩＸ．３７（０．１ｇ）を得た。

MH^+=291;

^{1}H NMR: δ 1.35(6H,d); 2.22(2H,m); 3.05(2H,t); 3.97(3H,s); 4.20(1H,m); 5.20(1H, septuplet); 7.95(1H,s);

（油）。
実施例ＩＸ．８
この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１－メチルピラゾール－４－カルボン酸（化合物ＩＸ．４２）の製造につき説明する。
化合物ＩＸ．３６（０．８３ｇ）をエタノール（３５ｃｍ^3）に溶解し、水（７ｃｍ^3）中の水酸化リチウム・１水和物（０．３４ｇ）で周囲温度において処理した。反応混合物を１８時間撹拌し、エタノールを減圧下で蒸発させ、水相を２Ｍ塩酸で酸性化し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、溶剤を減圧下で蒸発させるとガムが得られ、これをジエチルエーテル／ヘキサンで摩砕処理して化合物ＩＸ．４２（０．４３ｇ）を得た。
$M(NH4)^+$=298; ^{1}H NMR: δ 2.52(2H,m); 3.72(2H,t); 4.10-4.30(3H,m); 8.05(1H,s);
（融点１１８．４－１２２．０℃）。
実施例Ｘ．１
この実施例は、本発明化合物の製造に中間体として必要なメルカプト－１，２，４－オキサジアゾール類の関連合成法２種類につき説明する。５－メルカプト－１，２，４－オキサジアゾール類を合成するための一般法は、アミドオキシムおよび活性化チオカルボニル化合物、たとえばチオホスゲンまたは１，１－チオカルボニルジイミダゾールの環化によるものである。これらの試薬のうち最初のものを使用することにつき、５－メルカプト－３－フェニル－１，２，４－オキサジアゾールの製造により説明する。
ベンゾニトリル（１５ｇ）、塩酸ヒドロキシルアミン（１０ｇ）、炭酸カリウム（１０ｇ）、エタノール（１５０ｃｍ^3）および水（１５ｃｍ^3）を一緒に６時間加熱還流し、次いで一夜放冷した。反応混合物を濾過し、固体残渣をエタノールで洗浄した。濾液および洗液を合わせて蒸発させ、得られた褐色残渣を酢酸エチルと水の間で分配した。有機相を分離し、ブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。蒸発させると褐色の油が得られ、これは酢酸エチルおよびヘキサンを添加すると結晶化し、灰色固体（１０．３ｇ）が得られた。この固体（４．４ｇ）をエーテル（５０ｃｍ^3）中で撹拌し、チオホスゲン（０．５５ｃｍ^3）を添加すると、重厚な白色沈殿が生じた。反応物を１時間加熱還流し、次いで放冷した。次いで水中の水酸化ナトリウム溶液（５０ｃｍ^3）を添加し、反応物をさらに４時間加熱し、次いで放冷すると、黄色の２相反応混合物が得られた。有機相を分離し、水層をエーテルで２回抽出した。水層をｐＨ１に酸性化すると、黄色沈殿が生じた。水層を酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、蒸発させると５－メルカプト－３－フェニル－１，２，４－オキサジアゾールが橙褐色固体（０．５５４ｇ）として得られ、これをさらに精製せずに使用した。
^{1}H NMR: δ 7.45-7.63(3H,m); 7.70-7.90(2H,m).
別の試薬１，１－チオカルボニルジイミダゾールの使用につき、５－メルカプト－３－メトキシメチル－１，２，４－オキサジアゾールの製造により説明する。
メトキシアセトニトリル（７．１ｇ）、塩酸ヒドロキシルアミン（７ｇ）、炭酸カリウム

（１３．８ｇ）、エタノール（９０ｃｍ^3）および水（９ｃｍ^3）を一緒に５０℃で９時間加熱し、次いで放冷した。反応混合物を濾過し、白色固体残渣を酢酸エチルで洗浄した。濾液および洗液を合わせて蒸発させ、得られた残渣をジクロロメタンに溶解した。不溶性物質を濾去し、濾液を蒸発させて粘稠な油（９．２ｇ）を得た。この油を、１，１－チオカルボニルジイミダゾール（５．６５５ｇ）を含有するトルエン（６０ｃｍ^3）および乾燥ジメチルホルムアミド（４ｃｍ^3）に添加し、混合物を周囲温度で２時間撹拌した。さらに６０時間放置したのち、生じたベージュ色固体を濾過により回収し（５．２ｇが得られた）、これはＮＭＲによりアミドオキシムのヒドロキシル基とチオカルボニル基間の反応の非環化生成物であることが示された。この固体の一部（２ｇ）を水素化ナトリウム（０．３３ｇ）の、乾燥ジメチルホルムアミド（３０ｃｍ^3）中における懸濁液に添加し（泡立つ）、混合物を周囲温度で５時間撹拌し、１８時間放置した。反応生成物を水に注入し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。分離した有機層を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させ、最後に高真空で蒸発させて、痕跡量のジメチルホルムアミドを除去した。粗製５－メルカプト－３－メトキシメチル－１，２，４－オキサジアゾールは

^{1}H NMR: δ 3.2(3H,s); 4.10(2H,s); 6.92-6.98(1H,br s)

を有し、これをさらに精製せずに使用した。

実施例Ｘ．２

この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－置換－１，２，４－オキサジアゾール類を、たとえば上記に従って製造した対応する５－メルカプト中間体を用いて製造するための一般法につき説明する。これを以下の５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メトキシメチル－１，２，４－オキサジアゾール、化合物Ｘ．２６の製造により説明する。

５－メルカプト－３－メトキシメチル－１，２，４－オキサジアゾール（２．７８ｇ）の、アセトン（１５０ｃｍ^3）中における溶液に、４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（４．８７ｇ）および炭酸カリウム（３．１５ｇ）を添加し、混合物を１８時間加熱還流した。ＧＣは反応が完了したことを示した。反応混合物をソルブシル－Ｃ３０シリカのプラグで濾過し、アセトンで洗浄することにより無機固体を除去した。濾液を減圧下で蒸発させ、黄色油状残渣をソルブシル－Ｃ３０上でヘキサン中の５％酢酸エチルで溶離するクロマトグラフィー処理して、化合物Ｘ．２６（１．６ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.47-2.58(2H,m); 3.28-3.35(2H,t); 3.49(3H,s); 4.18-4.36(1H,m); 4.54(2H,s);

（油）。

以下の本発明化合物を、上記方法および指示した適宜な中間体を用いて製造した：

（ｉ）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メトキシメチル－１，２，４－オキサジアゾール（化合物Ｘ．３２）

^{1}H NMR: δ 2.37(3H,s); 2.45-2.55(2H,m); 3.22-3.30(2H,t); 4.16-4.35(1H,m);

（油）、５－メルカプト－３－メチル－１，２，４－オキサジアゾールから。

（ii）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－フェニル－１，２，４－オキサジアゾール（化合物Ｘ．１）；M^+＝２６８；

^{1}H NMR: δ 2.58(2H,m); 3.35(2H,t); 4.31(1H,m); 7.45-7.56(3H,m); 8.07(2H,d);

（油）、５－メルカプト－３－フェニル－１，２，４－オキサジアゾールから。

実施例Ｘ．３

この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メトキシメチル－１，２，４－オキサジアゾール（化合物Ｘ．２７）を化合物Ｘ．２６から製造する方法につき説明する。

化合物Ｘ．２６（０．６ｇ）をジクロロメタン（５０ｃｍ^3）中で０℃に冷却し、３－クロロ過安息香酸（２．１９ｇ、２．５当量）を５分間にわたって添加した。混合物を周囲温度で１時間撹拌し、４０時間放置した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に

注入し、生成物をジクロロメタン中へ抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水および飽和ブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させると淡褐色固体が得られ、これをシリカ上でヘキサン中の１０％酢酸エチルからヘキサン中の２０％酢酸エチルまで漸増させて溶離するクロマトグラフィー処理して、

^1H NMR: δ 2.6-2.71(2H,m); 3.51(3H,s); 3.58-3.65(2H,t); 4.21- 4.37(1H,m); 4.69(2H,s);

を有する化合物Ｘ．２７を得た；（油）。この物質は不安定であり、周囲温度で６０時間放置すると、かなり加水分解することが認められた。

実施例ＸＩ．１Ａ

この実施例は、以下の塩酸クロロアセトアミジンからの５－クロロ－３－クロロメチル－１，２，４－チアジアゾールの製造により証明されるように、５－クロロ－３－置換－１，２，４－チアジアゾール類を製造するための一般法につき説明する。

塩酸クロロアセトアミジン（１２．９ｇ）の、ジクロロメタン（１００ｃｍ^3）中における懸濁液を－５℃に冷却し、過塩化メチルメルカプタン（２０．４４ｇ）を添加した。反応混合物の温度を５℃より低く維持しながら、水中の水酸化ナトリウム（３０ｃｍ^{3}中２０ｇ）を滴加した（発熱）。添加が完了したのち、反応物を周囲温度にまで昇温させ、一夜撹拌した。混合物を水およびジクロロメタンで希釈し、全体をセライトのパッドにより濾過して、不溶性物質を除去した。有機相を分離し、飽和ブラインで洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させた。次いで生成物の溶液を濾過し、減圧下で蒸発させると褐色の油（９．７２ｇ）が得られ、これをさらに精製せずに使用した。M^+＝１６８；^1H ＮＭＲ；δ 4.75(s)。

以下の中間化合物を実施例ＸＩ．１Ａの方法により製造した。出発物質は既知化合物であった。

（ｉ）５－クロロ－３－トリフルオロメチル－１，２，４－チアジアゾール。M^+＝１８８（沸点、１２ｍｍＨｇで５０℃）。

（ii）５－クロロ－３－メチルメルカプト－１，２，４－チアジアゾール。M^+＝１６６。

（iii）５－クロロ－３－メトキシ－１，２，４－チアジアゾール。M^+＝１５０。

（iv）５－クロロ－３－（2-ピラジニル）－１，２，４－チアジアゾール。M^+＝１９８。

以下のとおり関連方法を用いて本発明化合物ＸＩ．１０２を製造した。

５－クロロ－３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，４－チアジアゾールの製造

ラウリル硫酸ナトリウム（０．１ｇ、触媒量）および過塩化メチルメルカプタン（７．１７ｇ）を含有する水（２００ｃｍ^3）中の臭化水素酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウム（８．６８ｇ）の懸濁液を０℃に冷却し、反応混合物の温度を５℃より低く維持しながら水中の水酸化ナトリウム（２００ｃｍ^{3}中５．６ｇ）を滴加した。添加が完了したのち、反応物を周囲温度にまで昇温させ、一夜撹拌した。混合物を酢酸エチルで２回抽出し、有機相を分離し、飽和ブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。次いで生成物の溶液を濾過し、減圧下で蒸発させると淡褐色の油（８．２ｇ）が得られ、これをシリカゲル（ソルブシルＣ３０）上で溶離剤としてヘキサン中の３％酢酸エチルを用いて、クロマトグラフィー処理し、化合物ＸＩ．１０２（２．８２ｇ）を得た。

M^+=242; ^1H NMR: δ 2.4-2.6(2H,m); 3.2-3.3(3H,t); 4.2- 4.4(1H,m);

（油）。

実施例ＸＩ．１Ｂ

５－［（４－メチルフェニル）スルホニル］－３－置換－１，２，４－チアジアゾール類を製造するための一般法を、メトキシアセトアミドから３－メトキシメチル－５－［（４－メチルフェニル）スルホニル］－１，２，４－チアジアゾールを製造する以下の２工程法により説明する。

工程１：５－メトキシメチル－１，３，４－チアジアゾール－２－オンの製造
塩化クロロカルボニルスルフェニル（７．３５ｇ）を、メトキシアセトアミド（５ｇ）の、トルエン（３０ｃｍ^3）中における懸濁液に添加した。反応混合物を９０－１００℃で５時間、撹拌および加熱し、次いで冷却した。溶剤を減圧下での蒸発により除去して、褐色のガム（６．６ｇ）を得た。
M^+ =147; ^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 3.30(3H,s); 4.30(2H,s)

これをさらに精製せずに次の工程に使用した。
工程２：３－メトキシメチル－５－［（４－メチルフェニル）スルホニル］－１，２，４－チアジアゾールの製造
シアン化４－メチルベンゼンスルホニル（１６．２６ｇ）を、５－メトキシメチル－１，３，４－オキサチアゾール－２－オン（６．６ｇ）の、ドデカン（６０ｃｍ^3）中におけるエマルションに添加した。反応混合物を１５０℃で１８時間、撹拌および加熱し、次いで冷却した。水を添加し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。有機相を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、酢酸エチルを減圧下での蒸発により除去した。残渣を褐色液体と透明なドデカン層とに分配し、ドデカン層を分離し、廃棄した。褐色液体をシリカゲル（ソルブシルＣ３０）上で溶離剤として３：７酢酸エチル：ヘキサンを用いてクロマトグラフィー処理すると淡橙色の油が得られ、これは放置すると凝固した（６．９４ｇ）。
M^+=284; ^{1}H NMR: δ 2.40(3H,s); 3.45(3H,s); 4.7(2H,s); 7.4(2H,d); 8.0(2H,d);

（融点４３．４－４５．４℃）。
以下の中間化合物を実施例ＸＩ．１Ｂの２工程法により製造した。出発物質は既知化合物であった。
（ｉ）３－エチル－５－［（４－メチルフェニル）スルホニル］－１，２，４－チアジアゾール。
M^+=268; ^{1}H NMR: δ 1.3-1.4(3H,t); 2.45(3H,s); 2.95-3.05(2H,q); 7.4(2H,m); 8.0(2H,m)

プロピオンアミドから。
（ii）３－（Ｅ－プロプ－１－エニル）－５－［（４－メチルフェニル）スルホニル］－１，２，４－チアジアゾール。
M^+=280; ^{1}H NMR: δ 1.95(3H,dd); 2.45(3H,s); 6.5-6.6(1H,m); 7.0-7.1(1H,m); 7.4(2H,m); 8.0(2H,m)

クロトンアミドから。
実施例ＸＩ．２
この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－置換－１，２，４－チアジアゾール類を、前記で製造した対応する５－クロロ－または５－［（４－メチルフェニル）スルホニル］－１，２，４－チアジアゾール中間体を用いて製造する方法につき説明する。この一般法を、以下の５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メトキシメチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．３４）の製造により説明する。
水中の水酸化ナトリウム（１０ｃｍ^{3}中０．８４８ｇ）を臭化水素酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウム（１．７５ｇ）に添加し、混合物を周囲温度で２０分間撹拌した。３－メトキシメチル－５－［（４－メチルフェニル）スルホニル］－１，２，４－チアジアゾール（２．０１ｇ）の、ジクロロメタン（１０ｃｍ^3）中における溶液および臭化テトラブチルアンモニウム（０．１ｇ、触媒）を添加し、混合物を２０分間撹拌した。ＴＬＣは生成物が形成されたことを示した。混合物を追加量のジクロロメタン（１０ｃｍ^3）で希釈し、有機相を分離し、飽和ブラインで洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて、橙黄色液体を得た。粗生成物をシリカゲル（ソルブシ

ルＣ３０）上で溶離剤として１：４酢酸エチル：ヘキサンを用いてクロマトグラフィー処理して、化合物ＸＩ．３４（１．６７ｇ）を得た。

M^+=252; ^{1}H NMR: δ 2.45-2.55(2H,m); 3.25-3.35(2H,t); 3.5(3H,s); 4.15-4.35(1H,m); 4.65(2H,s);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で、ただし適宜な中間体を用いて製造した。

（ｉ）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－トリフルオロメチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．９）

M^+=276; ^{1}H NMR: δ 2.5-2.6(2H,m); 3.3-3.4(2H,t); 4.2-4.4(1H,m);

（油）。

（ii）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－（Ｅ－プロプ－１－エニル）－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．１１）

M^+=248; ^{1}H NMR: δ 1.95(3H,dd); 2.5-2.6(2H,m); 3.3(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 6.45-6.55(1H,m); 6.9-7.1(1H,m);

（油）。

（iii）３－エチル－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．２３）；M^+＝２３６；

^{1}H NMR: δ 1.3-1.4(3H,t); 2.45-2.55(2H,m); 2.9-3.0(2H,q); 3.3(2H,t); 4.2-4.4(1H,m);

（油）。

（iv）３－クロロメチル－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．２５）

M^+=256; ^{1}H NMR: δ 2.45-2.55(2H,m); 3.35(2H,t); 4.2-4.35(1H,m); 4.7(2H,s);

（油）。この反応ではさらに２種の生成物が生成し、これらをクロマトグラフィーに際して分離し、解明した。これらは以下のものであった：３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオメチル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．３８）

M^+=344; ^{1}H NMR: δ 2.25-2.35(2H,m); 2.45-2.55(2H,m); 2.65(2H,t); 3.3(2H,t); 3.9(2H,s); 4.15-4.35(2H,m);

（油）、および５－クロロ－３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオメチル）－１，２，４－チアジアゾール

M^+=256; ^{1}H NMR: δ 2.2-2.3(2H,m); 2.65(2H,t); 3.9(2H,s); 4.1-4.3(1H,m);

（油）。

（ｖ）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メトキシ－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．８７）

M^+=238; ^{1}H NMR: δ 2.45-2.55(2H,m); 3.3(2H,t); 4.1(3H,s); 4.2-4.35(1H,m);

（油）。

（vi）３，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．１０９）；M^+＝３３０；

^{1}H NMR: δ 2.45-2.6(4H,m); 3.2-3.35(4H,m); 4.2-4.4(2H,m);

（油）、化合物ＸＩ．１０２から。

（vii）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－（２－ピラジニル）－

１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．１２５）
M^+=286; ^{1}H NMR: δ 2.55-2.65(2H,m); 3.35-3.45(2H,t); 4.25-4.40(1H,m); 8.65(1H,d); 8.75(1H,dd); 9.55(1H,d);

（油）。

実施例ＸＩ．３

この実施例は、３－ブトキシメチル－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．３０）の製造につき説明する。

炭酸カリウム（０．４４４ｇ）およびｎ－ブタノール（０．３９７ｇ）を、化合物ＸＩ．２５（０．２７５ｇ）の、ジメチルホルムアミド（２ｃｍ^3）中における溶液に添加し、混合物を周囲温度で１８時間撹拌した。ＴＬＣは混合物中に化合物ＸＩ．２５がなお存在することを示したので、水素化ナトリウム（０．１ｇ）およびｎ－ブタノール（０．４ｇ）を添加し、さらに２４時間撹拌を続けた。

水を添加し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した。有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させると油（０．４４２ｇ）が得られ、これをシリカゲル（ソルブシルＣ３０）上で溶離剤としてヘキサン中の１０％酢酸エチルを用いるクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＸＩ．３０（０．１３１ｇ）を得た。

M^+=294; ^{1}H NMR: δ 0.95-1.0(3H,t); 1.4-1.55(2H,m); 1.75-1.9(2H,m); 2.25-2.45(2H,m); 2.6-2.7(2H,t); 3.75(2H,s); 4.15-4.3(1H,m); 4.4-4.5(2H,t);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で、ｎ－プロパノールをｎ－ブタノールの代わりに用いて製造した。

（ｉ）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－プロポキシメチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．３１）
M^+=280; ^{1}H NMR: δ 1.0-1.1(3H,t); 1.8-1.95(2H,m); 2.25-2.35(2H,m); 2.6-2.7(2H,t); 3.75(2H,s); 4.15-4.4(1H,m); 4.4-4.45(2H,t);

（油）。

実施例ＸＩ．４

この実施例は５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．４０）を製造するための２工程法につき説明する。

工程１：３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５（４Ｈ）－チオンの製造

アセトアミド（５ｇ）の、メタノール（１００ｃｍ^3）中における溶液に、二硫化炭素（４ｇ）、イオウ（１．７ｇ）、およびナトリウムメトキシド（５．７ｇ）を添加し、混合物を６時間加熱還流した。混合物を冷却し、ハイフロ（ｈｉ－ｆｌｏ）濾過助剤により濾過して過剰のイオウを除去し、濾液を水と酢酸エチルの間で分配した。酢酸エチルを蒸発させると褐色固体が得られ、水層を酸性化すると赤色固体が生成し、これを濾別した。濾液から得られた固体は両方とも３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５（４Ｈ）－チオンとイオウの混合物であると思われた。これら２固体を合わせて次の工程に使用した。

工程２：化合物ＸＩ．４０の製造

３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５（４Ｈ）－チオン（１．２ｇ）の、アセトン（１００ｃｍ^3）中における溶液に、４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（２．４ｇ）および炭酸カリウム（１．２ｇ）を添加し、混合物を４時間還流したのち、ＴＬＣは出発物質が完全に消費されたことを示した。反応物を酢酸エチルおよび水に注入し、層を分離した。水層を酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせて乾燥させた（$MgSO_4$）。次いで生成物の溶液を濾過し、減圧下で蒸発させると褐色の油が得られ、これをフラッシュクロマトグラフィー（シリカ、ヘキサン中の７％酢酸エチル

）により精製して、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メチル－１，２，４－チアジアゾールを褐色の油（０．６４５ｇ）として得た。
M+=222; ^{1}H NMR: δ 2.56(2H, br q); 2.63 (3H,s); 3.30(2H,t); 4.30(1H,m).

以下の本発明化合物を上記方法で、ただし出発物質として３－フェニル－１，２，４－チアジアゾール－５（４Ｈ）－チオンを用いて製造した。
（ｉ）５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－フェニル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．５）
^{1}H NMR:
δ 2.53(2H,q); 3.30(2H,t); 4.24(1H,m); 7.38(3H,m); 8.2(2H,m).

実施例ＸＩ．５
この実施例は、３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メトキシ－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．１０８）の製造につき説明する。
水酸化ナトリウム（０．１８２ｇ）を、化合物ＸＩ．１０２（１ｇ）の、メタノール（５ｃｍ^3）中における溶液に添加し、混合物を周囲温度で４５分間撹拌した。この時点でＴＬＣは出発物質が消費されたことを示した。混合物に水およびジエチルエーテルを添加し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した。有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて黄色の油（０．９ｇ）を得た。フラッシュクロマトグラフィー（シリカ、ヘキサン中の５％酢酸エチル）により精製して、化合物ＸＩ．１０８（０．７８ｇ）を得た。
M+ =238; ^{1}H NMR: δ 2.4-2.5(2H,m); 3.2(2H,t); 4.15(3H,s); 4.2- 4.35(1H,m);

（油）。
実施例ＸＩ．６
この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－メチルチオ－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．１１０）の製造につき説明する。
硫化ナトリウム・９水和物（０．５５５ｇ）を、エタノール（１０ｃｍ^3）中の５－クロロ－３－メチルチオ－１，２，４－チアジアゾール（１．５ｇ）に添加し、混合物を１８時間、撹拌および加熱還流した。反応混合物を冷却し、溶剤を減圧下での蒸発により除去すると黄色固体（１．７６ｇ）が得られ、これをアセトン（３０ｃｍ^3）に溶解した。炭酸カリウム（２．２２ｇ）および４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（１．８３ｇ）を添加し、１８時間、撹拌および加熱還流した。反応混合物を冷却し、ハイフロ濾過助剤により濾過して無機物質を除去し、酢酸エチルで洗浄し、溶剤を減圧下での蒸発により除去すると褐色ガムが得られ、これをシリカゲル（ソルブシルＣ３０）上で溶離剤としてヘキサン中の５％酢酸エチルを用いるクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＸＩ．１１０（０．３９２ｇ）を得た。
M+ =254: ^{1}H NMR: δ 2.45-2.55(2H,m); 2.65(3H,s); 3.25- 3.35(2H,t); 4.2-4.4(1H,m);

（油）。
実施例ＸＩ．７
この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－（ニトロフェニル）－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．１２７）の製造につき説明する。
硫化水素ガスを４０分間にわたって、カリウムメトキシド（２．２ｇ）および無水エタノール（２５ｃｍ^3）の撹拌された混合物（ほぼ－１０℃に冷却）に吹き込んだ。フラスコを冷却浴から取り出し、５－クロロ－３－（３－ニトロフェニル）－１，２，４－チアジアゾール（３ｇ）を添加し、混合物を１時間加熱還流した。反応物を冷却し、エーテルに注入し、生じた沈殿を濾別した。５－メルカプト－３－（３－ニトロフェニル）－１，２，４－チアジアゾールを含有する濾液を次いでフラスコに入れ、４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（１．５ｇ）およびほぼ１ｇの炭酸カリウム

を添加し、混合物を３時間加熱還流したのち、ＴＬＣはトシレートが実質的に完全に消費されたことを示した。反応物を酢酸エチルおよび水に注入し、層を分離した。水層を酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせて乾燥させた（$MgSO_4$）。減圧下で蒸発させると褐色液体が得られ、これをフラッシュクロマトグラフィー（シリカ；溶離剤、ヘキサン中の５％酢酸エチル）により精製して、化合物ＸＩ．１２７（０．９０１ｇ）を得た。

M^+=329; ^{1}H NMR: δ 2.60(2H,broad q) 3.44(2H,t); 4.34(1H,m); 7.65(1H,t); 8.32(1H,dd); 8.6(1H,d); 9.1(1H,d)

（油）。

実施例ＸＩ．８

この実施例は、酸化されていない対応する化合物（前記の各実施例の方法により製造）の４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ置換基のイオウ原子を酸化してスルホキシド（スルフィニル）またはスルホン（スルホニル）となすことによる、本発明化合物の製造に適した方法につき説明する。

化合物ＸＩ．３４からの化合物ＸＩ．３５およびＸＩ．３６の製造

化合物ＸＩ．３４（０．８５ｇ）を周囲温度でジクロロメタン（１０ｃｍ^3）中において撹拌し、３－クロロ過安息香酸（０．８１４ｇ、１．４当量）を添加した。３．５時間後にＴＬＣは、出発物質が消費され、２種の生成物が形成されたことを示した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液の添加により反応を停止し、生成物をジクロロメタン中へ抽出した。有機相を分離し、飽和ブラインで洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させた。濾過し、減圧下での蒸発により濃縮したのち、白色固体（１．２ｇ）が得られ、これをシリカゲル上で溶離剤として３：７酢酸エチル：ヘキサンを用いるクロマトグラフィーにより精製して、まず５－［（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）スルホニル］－３－メトキシメチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．３６）（０．２９８ｇ）を得た。

M^+=284; ^{1}H NMR: δ 2.55-2.65(2H,m); 3.55(3H,s); 3.5-3.6(2H,t); 4.2-4.35(1H,m); 4.80(2H,s);

（油）。さらに溶離して、５－［（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）スルフィニル］－３－メトキシメチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．３５）（０．４０２ｇ）を得た。

M^+=268; ^{1}H NMR: δ 2.3-2.75(2H,m); 3.15-3.4(2H,m); 3.55(3H,s); 4.15-4.35(1H,m); 4.75(2H,s);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で、２当量のオキシダントを用いて製造した。

（ｉ）５－［（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）スルホニル］－３－エチル－１，２，４－チアジアゾール（化合物ＸＩ．２４）

M^+=268; ^{1}H NMR: δ 1.4-1.5(3H,t); 2.55-2.65(2H,m); 3.05-3.15(2H,q); 3.5-3.55(2H,t); 4.2-4.4(1H,m);

（油）。

実施例ＸＩＩ．１

本発明化合物の製造に際して中間体として用いられるメルカプト１，３，４－オキサジアゾール類の合成方法は当技術分野で周知である。代表的な２方法を以下に示す。

方法Ａ　２－メルカプト－５－メチル－１，３，４－オキサジアゾールの製造

アセトヒドラジド（５ｇ）の、エタノール（１０ｃｍ^3）中における溶液に、二硫化炭素（７．７ｇ）、次いでエタノール中の水酸化カリウム溶液（２０ｃｍ^{3}中５．７ｇ）を添加すると、白色沈殿が生じた。次いで反応物を周囲温度で２時間撹拌し、一夜放置した。反応物を濾過して白色固体（１１ｇ）を得た。この塩（５ｇ）をピリジン（１０ｃｍ^3）に装入し、混合物を合計１４時間、加熱還流した。冷却後、反応物を酸性化し、ジエチル

エーテルで２回抽出した。エーテル層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させて橙色固体を得た。これを酢酸エチルから再結晶して、２－メルカプト－５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール（０．６５５ｇ）を得た。
M^+=116; ^{1}H NMR: δ 2.43(3H,s); 10.9(1H,br s).

方法Ｂ　５－（４－メトキシベンジル）－１，３，４－オキサジアゾール－２（３Ｈ）－チオンの製造

工程１：（４－メトキシフェニル）酢酸ヒドラジドの製造
ヒドラジン水和物（４．７ｃｍ^3）を（４－メトキシフェニル）酢酸エチル（３．７３ｇ）に滴加し、次いでメタノール（２０ｃｍ^3）を添加して均質な反応混合物を調製した。この混合物を周囲温度で１８時間撹拌すると、その間に白色沈殿が生じた。沈殿を濾過により単離し、メタノールおよび水で洗浄し、次いで風乾して（４－メトキシフェニル）酢酸ヒドラジド（２ｇ）を得た。
M^+=180; ^{1}H NMR: δ 3.50(2H,s); 3.80(3H,s); 3.85(2H,br s); 6.70(1H,br s); 6.90(2H,d); 7.20(2H,d);

（固体）。
以下の中間化合物を上記方法で製造した：
（ｉ）２－メチルプロパン酸ヒドラジド。M^+＝１０２；（固体）。
（ii）シクロプロピル酢酸ヒドラジド。M^+：＝１００；（固体）。
（iii）ブタン酸ヒドラジド。
^{1}H NMR: δ 0.95(3H,t); 1.60-1.75(2H,m); 2.15(2H,t); 3.90(2H,br s); 6.95(1H,br s);

（固体）。
（iv）プロパン酸ヒドラジド。M^+＝８８；（固体）。
（ｖ）ペンタン酸ヒドラジド。
^{1}H NMR: δ 0.90(3H,t); 1.30-1.40(2H,m); 1.60-1.70(2H,m); 2.20(2H,t); 3.90(2H,br s); 6.80(1H,br s);

（固体）。
（vi）ヘキサン酸ヒドラジド。
^{1}H NMR: δ 0.90(3H,t); 1.20-1.35(4H,m); 1.60-1.70(2H,m); 2.15(2H,t); 3.90(2H,br s); 6.70(1H,br s);

（固体）。
（vii）（４－ニトロフェニル）酢酸ヒドラジド。
^{1}H NMR: δ (DMSO-d_6) 3.50(2H,s); 7.50(2H,d); 8.10(2H,d);

（固体）。
（viii）（２，６－ジフルオロフェニル）酢酸ヒドラジド。
M^+=186; ^{1}H NMR: δ 3.60(2H,s); 6.90- 7.00(2H,m); 7.20-7.30(1H,m);

（固体）。
（ix）２－メチル安息香酸ヒドラジド。
M^+= 150; ^{1}H NMR: δ 2.45(3H,s); 4.10(2H,br s); 7.00(1H,br s); 7.20-7.40(4H,m);

（固体）。
工程２：５－（４－メトキシベンジル）－１，３，４－オキサジアゾール－２（３Ｈ）－チオンの製造

水酸化カリウム（０．７ｇ）の、水（２ｃｍ^3）中における溶液を、（４－メトキシフェニル）酢酸ヒドラジド（１．９９ｇ）の、エタノール（３０ｃｍ^3）中における撹拌された溶液に添加した。二硫化炭素（０．７ｃｍ^3）を添加し、反応物を６時間加熱還流し、次いで放冷した。反応混合物を減圧下で蒸発乾固させ、固体残渣を水に溶解した。濃塩酸でｐＨを１に調整すると、白色沈殿が生じた。沈殿を濾過により単離し、水およびエーテルで洗浄し、風乾して、５－（４－メトキシベンジル）－１，３，４－オキサジアゾール－２（３Ｈ）－チオン（１．９６ｇ）を得た。

M^+=222; ^{1}H NMR: δ 3.80(3H,s); 3.95(2H,s); 6.90(2H,d); 7.20(2H,d);

（固体）。

以下の化合物を上記方法で、適宜な中間体（既知化合物または工程１と同様にして製造したもの）を用いて製造した：

（ｉ）１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン－５－カルボキシアミド。M^+＝１４５；（固体）。

（ii）５－チエニル－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。M^+＝１８４；（固体）。

（iii）５－イソプロピル－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。M^+＝１４４；（ガム）。

（iv）５－シクロプロピル－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。M^+＝１４２；（ガム）。

（ｖ）５－プロピル－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。M^+＝１４４；（油）。

（vi）５－エチル－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。M^+＝１３０；（油）。

（vii）５－（４－ピリジル）－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。

M^+= 179; ^{1}H NMR: δ 7.75(2H,d); 8.75(2H,d);

（固体）。

（viii）５－ブチル－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。

^{1}H NMR: δ 0.95(3H,t); 1.35-1.50(2H,m); 1.65-1.75(2H,m); 2.70(2H,t); 2.90(1H,br s);

（油）。

（ix）５－ペンチル－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。

^{1}H NMR: δ 0.90(3H,t); 1.25-1.45(4H,m); 1.75(2H,m); 2.70(2H,m);

（油）。

（ｘ）５－（４－ニトロベンジル）－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。

M^+=237; ^{1}H NMR: δ 4.20(2H,s); 7.50(2H,d); 8.25(2H,d);

（固体）。

（xi）５－（２，６－ジフルオロベンジル）－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。

^{1}H NMR: δ 4.10(2H,s); 6.90- 7.00(2H,m); 7.25-7.40(1H,m);

（固体）。

（xii）５－（４－メトキシフェニル）－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。

^{1}H NMR: δ 3.80(3H,s); 7.10(2H,d); 7.75(2H,d);

（固体）。

（xiii）５－（２－メチルフェニル）－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオ

ン。

^{1}H NMR: δ (DMSO-d_6)

2.50(3H,s); 7.30-7.40(2H,m); 7.40-7.50(1H,m); 7.55(1H,br d);

（固体）。

（xiv）５－（２－メトキシフェニル）－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。M^+＝２０８；（固体）。

（xv）５－（４－ニトロフェニル）－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。

M^+=223; ^{1}H NMR: δ 8.05(2H,d); 8.30(2H,d);

（固体）。

（xvi）５－ベンジル－１，３，４－オキサジアゾール－２（３Ｈ）－チオン。

^{1}H NMR: δ 4.00(2H,s); 7.25-7.40(5H,m);

（固体）。

実施例ＸＩＩ．２

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－フェニル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．３）の製造につき説明する。

２－メルカプト－５－フェニル－１，３，４－オキサジアゾール（０．４９９ｇ）の、アセトン（１５ｃｍ^3）中における溶液に、炭酸カリウム（０．３８７ｇ）および４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（０．７ｇ）を添加し、混合物を１．５時間加熱還流したのち、すべての出発物質が消費された。反応物をジエチルエーテルおよび水に注入し、層を分離した。水層をエーテルで抽出し、有機層を合わせて水で洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させると淡黄色液体が得られ、これをフラッシュクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＸＩＩ．３を無色の油として得た。これは放置すると凝固した（０．２９３ｇ）。

M^+=268; ^{1}H NMR: δ 2.58(2H,m); 3.32(2H,t); 4.31(1H,m); 7.45-7.57(3H,m);

8.01(2H,d);

（融点３８－４０℃）。

以下の本発明化合物を適宜な中間体（既知化合物または実施例ＸＩＩ．１と同様にして製造したもの）から上記方法で、ただしアルキル化剤として４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンを４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルの代わりに用いて製造した：

（ｉ）５－シクロプロピル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１）。

^{1}H

NMR: δ 1.10-1.15(4H,m); 2.10-2.20(1H,m); 2.45-2.55(2H,m); 3.20(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－イソプロピル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．８）。

M^+=234; ^{1}H NMR: δ 1.19(6H,d); 2.50-2.60(2H,m); 3.15(1H,septet); 3.30(2H,t);

4.30(1H,m);

（油）。

（iii）５-(2,6-ジフルオロベンジル)-２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１１）。

^{1}H NMR: δ 2.45-2.55(2H,m); 3.25(2H,t); 4.20(2H,s); 4.25(1H,m); 6.90-7.00(2H,m); 7.25-7.35(1H,m);

（油）。
（iv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（４－ニトロベンジル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１２）。
^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.30(2H,t); 4.20(1H,m); 4.30(2H,s); 7.50(2H,d); 8.20(2H,d);

（油）。
（ｖ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－イソブチル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．２３）。
^{1}H NMR: δ 1.00(6H,d); 2.10-2.20(1H,m); 2.50-2.60(2H,m); 2.70(2H,d); 3.25(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（vi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－ペンチル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．２５）。
^{1}H NMR: δ 0.90(3H,t); 1.30-1.40(4H,m); 1.70-1.80(2H,m); 2.50-2.55(2H,m); 2.80(2H,t); 3.25(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（vii）５－ブチル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．２８）。
^{1}H NMR δ 0.95(3H,t); 1.35-1.50(2H,m); 1.70-1.80(2H,m); 2.50-2.60(2H,m); 2.80(2H,t); 3.25(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（viii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－プロピル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．３１）。
^{1}H NMR: δ 1.00(3H,t); 1.75-1.90(2H,m); 2.50-2.60(2H,m); 2.80(2H,t); 3.25(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（ix）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－エチル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．３５）。
^{1}H NMR δ 1.40(3H,t); 2.50-2.60(2H,m); 2.85(2H,t); 3.25(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（ｘ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．４９）。

M+=206; ^{1}H NMR: δ 2.51(2H,m); 2.73(3H,s); 3.27(2H,t); 4.25(1H,m);

（油）。
（xi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－オキサジアゾール－５－カルボキシアミド（化合物ＸＩＩ．５５）。
M+=235; ^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.35(2H,t); 4.30(1H,m);
（融点１１３℃）
（xii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（２－メチルフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１２８）。
^{1}H NMR: δ 2.55-2.65(2H,m); 2.70(3H,s); 3.35(2H,t); 4.30(1H,m); 7.30-7.45(3H,m); 7.90(1H,d);

（油）。
（xiii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（２－フリル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１３１）。
M+=258; ^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.35(2H,t); 4.30(1H,m); 6.60(1H,m); 7.10(1H,d); 7.60(1H,d);

（油）。
（xiv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（２－メトキシフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１３２）。
^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.30(2H,t); 3.95(3H,s); 4.30(1H,m); 7.10(2H,m); 7.50(1H,dt); 7.90(1H,dd);

（融点３５－３７℃）。
（xv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（２－チエニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１３３）。
M+=274; ^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.30(2H,t); 4.30(1H,m); 7.10-7.20(1H,m); 7.55(1H,d); 7.70(1H,d);

（油）。
（xvi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（３－フリル）１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１３４）。
^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.30(2H,t); 4.30(1H,m); 6.90(1H,m); 7.50-7.55(1H,m); 8.05(1H,br s);

（油）。
（xvii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（４－メトキシフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１４４）。
^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.30(2H,t); 3.90(3H,s); 4.30(1H,m); 7.00(2H,d); 8.00(2H,d);

（油）。
（xviii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（４－ピリジル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１４８）。
M+=269; ^{1}H NMR: δ 2.50-2.65(2H,m); 3.40(2H,t); 4.30(1H,m); 7.90(2H,d); 8.80(2H,d);

（油）。

実施例ＸＩＩ．３

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－フェニル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．４）の製造につき説明する。

化合物ＸＩＩ．３（１ｇ）の、乾燥ジクロロメタン中における溶液（０℃で撹拌）に、３－クロロ過安息香酸（固体５０重量％のもの１．３ｇ、１当量）を添加した。反応物を周囲温度にまで昇温させ、３時間撹拌し、一夜放置した。ＴＬＣは出発物質が完全に消費されたことを示した。反応混合物を濾過し、濾液をジクロロメタンと炭酸水素ナトリウム溶液との間で分配した。水層をジクロロメタンで抽出し、有機相を合わせて硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶剤を減圧下で蒸発させると黄色の油が得られ、これをシリカゲル上でヘキサン中の２５％酢酸エチルで溶離するフラッシュクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＸＩＩ．４（０．４７４ｇ）を得た。

M+=284; ^{1}H NMR: δ 2.67(2H,m); 3.52(2H,m); 4.32(1H,m); 7.50(3H,m); 8.12(2H,d);

（油）。

以下の本発明化合物を適宜なチオエーテルから上記方法で製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－（４－メトキシベンジル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１４）。

^{1}H NMR: δ 2.45-2.70(2H,m); 3.30-3.50(2H,m); 3.80(3H,s); 4.25(1H,m); 4.25(2H,s); 6.90(2H,d); 7.25(2H,d);

（油）。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－ペンチル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．２６）。

^{1}H NMR: δ 0.95(3H,t); 1.30-1.40(4H,m); 1.80-1.90(2H,m); 2.50-2.75(2H,m); 2.95(2H,t); 3.35-3.55(2H,m); 4.30(1H,m);

（油）。

（iii）５－ブチル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．２９）。

^{1}H NMR: δ 1.00(3H,t); 1.40-1.50(2H,m); 1.80-1.90(2H,m); 2.50-2.75(2H,m); 3.00(2H,t); 3.35-3.55(2H,m); 4.30(1H,m);

（油）。

（iv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－プロピル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．３２）。

^{1}H NMR: δ 1.05(3H,t); 1.80-1.95(2H,m); 2.50-2.75(2H,m); 2.95(2H,t); 3.35-3.55(2H,m); 4.30(1H,m);

（油）。

（ｖ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－（２－メチルフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１２９）。

^{1}H NMR: δ 2.55-2.80(2H,m); 2.70(3H,s); 3.40-3.60(2H,m); 4.30(1H,m); 7.30-7.40(1H,m); 7.45-7.50(1H,m); 8.00(1H,d);

（油）。

（vi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－（４－ニトロフ

ェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１４２）。
^{1}H NMR: δ 2.55-2.80(2H,m); 3.45-3.70(2H,m); 4.35(1H,m); 8.35(2H,d);
8.45(2H,d);
（油）。
（vii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－（４－メトキシフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１４５）。
^{1}H NMR: δ 2.50-2.80(2H,m); 3.40-3.60(2H,m); 3.90(3H,s); 4.30(1H,m);
7.05(2H,d); 8.05(2H,d);
（油）。
以下の本発明化合物を適宜なチオエーテルから上記一般法により、ただし２当量の３－クロロ過安息香酸をオキシダントとして用いて製造した。
（viii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－フェニル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．５）。
M^+=300; ^{1}H NMR: δ 2.71(2H,m); 3.67(2H,m); 4.33(1H,m); 7.52-7.70(3H,m);
8.25(2H,d);
（融点１０４－１０６℃）。
（ix）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－イソプロピル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．９）。
^{1}H NMR: δ 1.50(6H,d); 2.60-2.70(2H,m); 3.20-3.40(1H,m); 3.60(2H,t); 4.30(1H,m);
（ガム）。
（ｘ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－（4-ニトロベンジル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１３）。
^{1}H NMR: δ 2.60-2.70(2H,m); 3.60(2H,t); 4.30(1H,m); 4.40(2H,s);
7.55(2H,d); 8.25(2H,d);
（油）。
（xi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－（４－メトキシベンジル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１５）。
^{1}H NMR: δ 2.60-2.70(2H,m); 3.65(2H,t); 3.80(3H,s); 4.20(1H,m);
4.25(2H,s); 6.90(2H,d); 7.25(2H,d);
（融点６０－６３℃）
（xii）５－ベンジル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１９）。
^{1}H NMR: δ 2.60(2H,m); 3.60(2H,t); 4.25(1H,m); 4.30(2H,s); 7.25-7.40(5H,m);
（油）。
（xiii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－ペンチル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．２７）。
^{1}H NMR: δ 0.95(3H,t); 1.30-1.45(4H,m); 1.80-1.90(2H,m); 2.60-2.70(2H,m); 3.00(2H,t);
3.60(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（xiv）５－ブチル－２－（４，４－ジフルオロブト３－エニルスルホニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．３０）。
^{1}H NMR: δ 1.00(3H,t); 1.40-1.50(2H,m); 1.80-1.90(2H,m); 2.60-2.70(2H,m); 3.00(2H,t); 3.60(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（xv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－プロピル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．３３）。
^{1}H NMR: δ 1.10(3H,t); 1.85-2.00(2H,m); 2.60-2.70(2H,m); 2.95(2H,t); 3.60(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（xvi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．５１）。
^{1}H NMR: δ 2.20-2.30(2H,m); 2.30(3H,s); 3.60(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（xvii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－（２－メチルフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１３０）。
^{1}H NMR: δ 2.70-2.80(2H,m); 2.75(3H,s); 3.70(2H,t); 4.30(1H,m); 7.40(1H,d); 7.50(1H,d); 8.00(1H,d);

（融点９０－９３℃）。
（xviii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－（４－ニトロフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１４３）。
M$^+$=345; ^{1}H NMR: δ 2.70-2.80(2H,m); 3.70(2H,t); 4.35(1H,m); 8.35(2H,d); 8.45(2H,d);

（油）。
（xix）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－（４－メトキシフェニル）－１，３，４－オキサジアゾール（化合物ＸＩＩ．１４６）。
^{1}H NMR: δ 2.70-2.80(2H,m); 3.65(2H,t); 3.90(3H,s); 4.30(1H,m); 7.05(2H,d); 8.10(2H,d);

（融点６０℃）
実施例ＸＩＩＩ．１
この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－置換－１，３，４－チアジアゾール類を、当技術分野で周知の化合物である対応するチアジアゾール－２（３Ｈ）－チオンから製造するための一般法につき説明する。
２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メチルアミノ－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．７０）を対応するチオンおよび４－メチル－ベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルから製造することにより、この方法を説明する。他のアルキル化剤、たとえば４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンも使

用しうる。

化合物ＸＩＩＩ．７０の製造

５－メチルアミノ－１，３，４－チアジアゾール－２（３Ｈ）－チオン（０．３９３ｇ）の、アセトン（１０ｃｍ^3）中における溶液に、炭酸カリウム（０．３６９ｇ）および４－メチル－ベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（０．７ｇ）を添加し、混合物を３時間加熱還流したのち、ＧＣ分析は出発物質が完全に消費されたことを示した。反応混合物をハイフロ濾過助剤により濾過し、パッドをジエチルエーテルで十分に洗浄した。濾液をエーテルおよび水に注入し、層を分離した。水層をエーテルで２回抽出し、有機層を合わせて乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させると褐色の油が得られ、これをシリカゲル上で１：１酢酸エチル：ヘキサンにより溶離するフラッシュクロマトグラフィーによって精製して、化合物ＸＩＩＩ．７０（０．２７３ｇ）を得た。

M^+=237; ^{1}H NMR: δ 2.43(2H,m); 3.04(3H,s); 3.15(2H,t); 4.29(1H,m); 5.36(1H,br s);

（融点５２．５－５３．５℃）。

以下の本発明化合物を上記一般法で、適宜なメルカプトチアジアゾール類、および場合により４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンをアルキル化剤として用いて製造した：

（ｉ）５－シクロプロピル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．６）。

M^+=248; ^{1}H NMR: δ 1.10-1.30(4H,m); 2.30-2.40(1H,m); 2.45-2.55(2H,m); 3.30(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－フェニル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．９）。M^+＝２８４；

^{1}H NMR: δ 2.50-2.65(2H,m); 3.40(2H,t); 4.50(1H,m); 7.40-7.50(3H,m); 7.85-7.95(2H,m);

（融点３９℃）。

（iii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－イソプロピル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１６）。

M^+=250; ^{1}H NMR: δ 1.40(3H,s); 1.45(3H,s); 2.45-2.60(2H,m); 3.35(2H,t); 3.35-3.50(1H,m); 4.30 (1H,m);

（油）。

（iv）５－ベンジル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．２０）。

M^+=298; ^{1}H NMR: δ 2.45-2.55(2H,m); 3.30(2H,t); 4.30(1H,m); 4.40(2H,s); 7.25-7.40(5H,m);

（油）。

（ｖ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．４０）。

M^+=222; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 2.73(3H,s); 3.35(2H,t); 4.29(1H,m);

（油）。

（vi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール－５－カルボキシアミド（化合物ＸＩＩＩ．４５）。

M⁻=151; ^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.45(2H,t); 4.30(1H,m); 6.80(1H,br s); 7.15(1H,br s);

（融点１６８℃）。
（vii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．６３）。
M⁻=208; ^{1}H NMR: δ 2.54(2H,m); 3.43(2H,t); 4.30(1H,m); 9.03(1H,s);

（油）。
（viii）５－アミノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．６９）。
M⁻=223; ^{1}H NMR: δ 2.45(2H,m); 3.20(2H,t); 4.30(1H,m); 5.20(2H,br s);

（融点１３８℃）。
（ix）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（トリフルオロメチルベンジルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１１０）。
M⁻=304; ^{1}H NMR: δ 2.51(2H,m); 3.31(2H,t); 4.27(1H,m); 4.56(2H,s); 7.42-7.70(4H,m);

（油）。
（ｘ）５－シクロプロピルメチルチオ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１１４）。
M⁺=294; ^{1}H NMR: δ 0.35(2H,m); 0.65(2H,m); 1.25(1H,m); 2.50(2H,m); 3.25(2H,d); 3.30(2H,t); 4.25(1H,m);

（油）。
（xi）２，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１１７）。M^+＝３３０；
^{1}H NMR: δ 2.51(4H,m); 3.32(4H,t); 4.29(2H,m);
（油）
（xii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メチルチオ－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１１９）。
M⁺=254; ^{1}H NMR: δ 2.51(2H,m); 2.77(3H,s); 3.31(2H,t); 4.20(1H,m);

（油）。
（xiii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（スルホンアミドフェニル）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１４３）。
M⁺=363; ^{1}H NMR: δ 2.55-2.65(2H,m); 3.50(2H,t); 4.30(1H,m); 4.95(2H,br s); 8.05(4H,m);

（融点１５４℃）。
実施例ＸＩＩＩ．２
この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－置換－１，３，４－チアジアゾール類を、２－アミノ－５－置換－チアジアゾール類から製造するための一般法につき説明する。２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－エチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．２７）を２－アミノ－５－エチル－１，３，４－チアジアゾールから製造することにより、この方法を説明する。
化合物ＸＩＩＩ．２７の製造
２－アミノ－５－エチル－１，３，４－チアジアゾール（０．７８６ｇ）およびジ－４，

４－ジフルオロブト－３－エニルジスルフィド（１．５ｇ）の、ジクロロメタン（２５ｃｍ^3）中における溶液を撹拌し、氷水浴中で冷却した。亜硝酸ｔ－ブチル（１．２ｇ）を添加し、冷却浴を取り除き、反応物を１．３時間加熱還流した。次いで混合物をジエチルエーテル／水に注入し、層を分離した。水層をエーテルで抽出し、有機層を合わせて乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて褐色の油を得た。シリカゲル上で溶離剤として１：９および２：８酢酸エチル：ヘキサンを用いるカラムクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＸＩＩＩ．２７（０．９５９ｇ）を得た。

M^+=236; ^{1}H NMR: δ 1.40(3H,t); 2.45- 2.60(2H,m); 3.10(2H,q); 3.35(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で、適宜な中間体を用いて製造した：

（ｉ）５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１）。M^+＝２８６；

^{1}H NMR: δ 2.45-2.60(2H,m); 3.40(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－ｔ－ブチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．３）。

M^+=264; ^{1}H NMR: δ 1.48(9H,s); 2.45-2.60(2H,m); 3.35(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。

（iii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－トリフルオロメチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＩＩＩ．１４）。

M^+=276; ^{1}H NMR: δ 2.50-2.60(2H,m); 3.45(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。

実施例ＸＩＩＩ．３

この実施例は、３－クロロ過安息香酸をオキシダントとして用いて２，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１３３）を製造することにつき説明する。

化合物ＸＩＩＩ．１１７（０．４９ｇ）の、ジクロロメタン（３０ｃｍ^3）中における溶液をメタノール氷浴中でほぼ－１０℃に冷却し、３－クロロ過安息香酸（固体５０重量％のもの１ｇ、２当量）を添加し、反応物を撹拌し、徐々に周囲温度にまで昇温させ、次いで７時間撹拌し、１８時間放置した。次いで混合物を炭酸水素ナトリウム溶液に注入し、生成物をジエチルエーテル中へ抽出した。有機層を合わせて炭酸水素ナトリウム溶液で洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させると淡黄色液体が得られ、これをシリカゲル上でヘキサン中の３０％酢酸エチルで溶離するフラッシュクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＸＩＩＩ．１３３（０．１６８ｇ）を得た。

M^+=362; ^{1}H NMR: δ 2.58(4H,m); 3.36(4H,m); 4.26(2H,m).

（融点４６－４８℃）。

以下の本発明化合物を上記一般法で、適宜な当量数の３－クロロ過安息香酸をオキシダントとして用いて製造した：

（ｉ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－フェニル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１０）。

M^+=300; ^{1}H NMR: δ 2.40-2.80(2H,m); 3.30-3.40(2H,m); 4.30(1H,m); 7.45-7.60(3H,m); 7.95-8.00(2H,m);

（融点６７℃）。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－フェニル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１１）。

M+=316; ^{1}H NMR: δ 2.60-2.75(2H,m); 3.65(2H,t); 4.30(1H,m); 7.45-7.65(3H,m); 7.95-8.05(2H,m);

（融点８０℃）。
（iii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－メチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．４１）。
M+=238; ^{1}H NMR: δ 2.35-2.55(1H,m); 2.55-2.75(1H,m); 2.90(3H,s); 3.20-3.40(2H,m); 4.30(1H,m);

（油）。
（iv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－メチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．４２）。
M+=255; ^{1}H NMR: δ 2.55-2.70(2H,m); 2.95(3H,s); 3.60(2H,t); 4.30(1H,m);

（油）。
（ｖ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．６４）。
M+=225; ^{1}H NMR: δ 2.35-2.50(1H,m); 2.60-2.75(1H,m); 3.25-3.45(2H,m); 4.30(1H,m); 9.35(1H,s);

（油）。
（vi）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．６５）。M^+＝２４１；
^{1}H NMR: δ 2.60-2.70(2H,m); 3.70(2H,t); 4.30(1H,m); 9.40(1H,s);

（油）
（vii）２，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１２４）。
M+=394; ^{1}H NMR: δ 2.69(4H,m); 3.70(4H,t); 4.30(2H,m);

（融点８８－９１℃）
（viii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１３４）。
M+=378; ^{1}H NMR: δ 2.38-2.55(1H,m); 2.60-2.79(3H,m); 3.38(2H,m); 3.62-3.74(2H,m); 4.19-4.39(2H,m);

（融点４５－４７℃）。
以下の本発明化合物を上記一般法で、ただし適宜な当量数のモノペルオキシフタル酸マグネシウムをオキシダントとして用いて製造した。
（ix）５－ブロモ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．２）。
MH+=319; ^{1}H NMR: δ 2.60-2.70(2H,m); 3.65(2H,t); 4.30(1H,m);

（ｘ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－ｔ－ブチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．４）。
MH+=297; ^{1}H NMR: δ 1.55(9H,s); 2.60-2.70(2H,m); 3.65(2H,t); 4.30(1H,m);

（融点３７℃）
（xi）５－シクロプロピル－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－

１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．７）。
MH^+=281; ^{1}H NMR: δ 1.25-1.45(4H,m); 2.40-2.55(1H,m); 2.55-2.65(2H,m); 3.60(2H,t); 4.30(1H,m);

（ガム）
（xii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－トリフルオロメチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１５）。
$M-SO_2H^+$=243; ^{1}H NMR: δ 2.60-2.75(2H,m); 3.75(2H,t); 4.20-4.40(1H,m);

（ガム）。
（xiii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－イソプロピル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１７）。
M^+=283; ^{1}H NMR: δ 1.50(3H,s); 1.55(3H,s); 2.60-2.70(2H,m); 3.50-3.70(3H,m); 4.30(1H,m);

（融点４３℃）。
（xiv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－エチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．２８）。
^{1}H NMR: δ 1.50(3H,t); 2.40-2.50(1H,m); 2.60-2.70(1H,m); 3.20(2H,q); 3.25-3.35(2H,m); 4.25(1H,m);

（ガム）
（xv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－エチル－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．２９）。
M^+=269; ^{1}H NMR: δ 1.50(3H,t); 2.60-2.70(2H,m); 3.20(2H,q); 3.65(2H,t); 4.30(1H,m);

（ガム）。
実施例ＸＩＩＩ．４
この実施例は、化合物ＸＩＩＩ．１から２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メトキシ－１，３，４－チアジアゾール（化合物ＸＩＩＩ．１０１）を製造することにつき説明する。
水素化ナトリウム（０．０３０ｇ）の、トルエン（３ｃｍ^3）中における撹拌された懸濁液にメタノール（０．０２２ｇ）を添加すると泡立った。１０分間撹拌したのち、化合物ＸＩＩＩ．１（０．２０ｇ）を添加し、反応物を周囲温度で１１８時間撹拌した。反応物をＧＣにより分析し、出発物質の完全な消失が認められるまで追加量の水素化ナトリウムおよびメタノールを添加した。反応物を水に注入し、層を分離した。生成物をジエチルエーテル中へ抽出し、有機層を合わせて乾燥（$MgSO_4$）、濾過、減圧下で蒸発させて淡黄色の油を得た。シリカゲル上で３：１７エーテル：ヘキサンを溶離剤として用いるカラムクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＸＩＩＩ．１０１（０．０６９ｇ）を得た。
M^+=238; ^{1}H NMR: δ 2.40- 2.55(2H,m); 3.25(2H,t); 4.20(3H,s); 4.30(1H,m);

（油）。
実施例ＸＩＶ．１
この実施例は、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１－メチルテトラゾール（化合物ＸＩＶ．１）の製造につき説明する。
５－メルカプト－１－メチルテトラゾールのナトリウム塩を実施例ＸＩＩＩ．１の方法で４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンによりアルキル化して、化合物ＸＩＶ．

１を得た。M^+＝２０６；
^1H NMR: δ 2.53(2H,m); 3.38(2H,t); 3.92(3H,s); 4.28(1H,m);

（油）。

実施例ＸＶ．１

この実施例は、１－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－４－ニトロベンゼン（化合物ＸＶ．１）の製造につき説明する。

４－ニトロチオフェノール（０．５ｇ）、炭酸カリウム（０．４４８ｇ）、４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（０．８４６ｇ）、およびヨウ化カリウム（０．３８８ｇ）をアセトン（１５ｃｍ^3）中で合計６時間、撹拌および加熱還流したのち、ＴＬＣにより出発トシレートは検出されなかった。反応混合物を水に注入し、酢酸エチルで３回抽出した。有機層を合わせて２Ｍ　ＭａＯＨおよび飽和水性ブラインで３回洗浄し、次いで乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下での蒸発により除去すると濃黄色の油が得られ、これをシリカゲル上でヘキサン中の５％酢酸エチルを溶離剤として用いるフラッシュクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＸＶ．１（０．４７４ｇ）を得た。
M^+=245; ^1H NMR: δ 2.42(2H,m); 3.09(2H,t); 4.30(1H,m); 7.35(2H,d); 8.14(2H,d);

（油）。

実施例ＸＶＩ．１

この実施例は、２－クロロ－４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピリジン（化合物ＸＶＩ．１）の製造につき説明する。

ジクロロメタン（２０ｃｍ^3）中の亜硝酸ｔ－ブチル（０．４４２ｇ）を、４－アミノ－２－クロロピリジンおよびビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）ジスルフィド（１．９ｇ）の、ジクロロメタン（２０ｃｍ^3）中における溶液に、混合物を０℃で撹拌しながら滴加した。反応混合物を４時間撹拌し、次いで周囲温度で１８時間放置した。水を添加し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。有機層を合わせて飽和ブラインで洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて橙褐色のガムを得た。ソルブシル－Ｃ３０上でヘキサン中の４％酢酸エチルを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、化合物ＸＶＩ．１（０．１３４ｇ）を得た。

（油）。

M^+=235; ^1H NMR: δ 2.35-2.46(2H,m);

2.98-3.7(2H,t); 4.18(1H,m); 7.02(1H,d); 7.11(1H,d); 8.14-8.21(1H,d);

実施例ＸＶＩ．２

この実施例は、４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－２，３，５，６－テトラフルオロピリジン（化合物ＸＶＩ．２）の２工程製造法につき説明する。

工程１：２，３，５，６－テトラフルオロピリジン－４－チオールのナトリウム塩の製造

４－クロロ－－２，３，５，６－テトラフルオロピリジン（２ｇ）および硫化水素ナトリウム・２水和物をイソプロパノール（４０ｃｍ^3）中で３時間、撹拌および加熱還流した。次いで混合物を周囲温度で１８時間撹拌した。沈殿した固体を濾別し、ジエチルエーテルで洗浄し、廃棄した。有機溶液を合わせて減圧下で蒸発させて、２，３，５，６－テトラフルオロピリジン－４－チオールをそのナトリウム塩（２．２１ｇ）として得た。これをさらに精製せずに第２工程に使用した。

工程２：（化合物ＸＶＩ．２）の製造

工程２からの中間体（１．７ｇ）、４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（１．９９ｇ）、および炭酸カリウム（１．５３ｇ）をアセトン（３０ｃｍ^3）中で１８時間、撹拌および加熱還流した。無機沈殿を濾別し、濾液を減圧下で蒸発させて、濃褐色の油を得た。ソルブシル－Ｃ３０上でヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーによ

り、化合物ＸＶＩ．２（１．８２ｇ）を得た。
M⁺=273; ¹H NMR: δ 2.3-2.42(2H,m); 3.15- 3.25(2H,t); 4.15-4.34(1H,m);

（油）。
以下の本発明化合物を上記工程２の方法で製造した。アルキル化剤は４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンまたは４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルであった。
（ｉ）４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピリジン（化合物ＸＶＩ．５）。
M⁺=201; ¹H NMR: δ
2.40(2H,m); 3.04(2H,t); 4.30(1H,m); 7.11(2H,d); 8.41(2H,d);

（油）、４－メルカプトピリジンから。
（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピリジン－３－カルボン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（化合物ＸＶＩ．１０）。
M⁺=335; ¹H NMR: δ 2.43(4H,m); 3.22(2H,t); 4.29(2H,m); 4.36(2H,t);
7.09(1H,dd); 8.20(1H,dd); 8.57(1H,dd);

（油）、２－メルカプトピリジン－３－カルボン酸から。この反応の場で、ヨウ化カリウムを用いて２当量の４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルをより反応性の高い４－ヨード－１，１－ジフルオロブト－１－エンに変換した。
（iii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－トリフルオロメチルピリジン（化合物ＸＶＩ．１１）。
¹H
NMR: δ 2.40(2H,m); 3.25(2H,t); 4.25(1H,m); 7.25(1H,dd); 7.45(1H,dd); 8.40(1H,d);

（油）、２－メルカプト－５－トリフルオロメチルピリジンから。
（iv）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピリジン（化合物ＸＶＩ．１９）。
M⁺=201; ¹H NMR: δ
2.40(2H,m); 3.20(2H,t); 4.30(1H,m); 6.90(1H,dd); 7.20(1H,dd); 7.45(1H,td);
8.40(1H,dd);

（油）。
（ｖ）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－ニトロピリジン（化合物ＸＶＩ．２１）。
M⁺=246; ¹H
NMR: δ 2.45(2H,m); 3.30(2H,t); 4.28(1H,m); 7.30(1H,d); 8.23(1H,dd); 9.25(1H,d);

（油）、２－メルカプト－５－ニトロピリジンから。

実施例ＸＶＩ．３
この実施例は２－クロロ－５－置換ピリジン類から２-（４，４-ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－置換ピリジン類を製造するための一般法を示す。５－クロロ-２-（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピリジン（化合物ＸＶＩ．１３）を２，５－ジクロロピリジンから製造することにより、この方法を説明する。
硫化水素ナトリウム・２水和物（０．６７２ｇ）を２，５－ジクロロピリジン（１．４８ｇ）の、ジメチルホルムアミド（２０ｃｍ^3）中における溶液に添加すると混合物が青色となり、次いで１００℃に加熱すると緑色になった。反応物を７時間加熱し、次いで４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（１．７１ｇ）および炭酸カリウム（１．３８ｇ）を添加した。反応物を２時間加熱し、次いで放冷した。反応混合物をジエチルエー

テルおよび２Ｍ　ＨＣｌに注入し、層を分離した。水層をエーテルで抽出した。次いで有機層を合わせて２Ｍ　ＨＣｌ、水およびブラインで洗浄し（交互に３回ずつ）、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて褐色の油を得た。シリカゲル上で溶離剤としてヘキサン中の２％ジエチルエーテルを用いるカラムクロマトグラフィーにより、化合物ＸＶＩ．１３（０．８０５ｇ）を得た。

M^+=235; ^{1}H NMR: δ 2.40(2H,m); 3.20(2H,t); 4.25(1H,m);

7.15(1H,dd); 7.45(1H,dd); 8.40(1H,d);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した：

（ｉ）５－シアノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピリジン（化合物ＸＶＩ．１５）。

^{1}H NMR: δ

2.40(2H,m); 3.25(2H,t); 4.25(1H,m); 7.25(1H,dd); 7.70(1H,dd); 8.65(1H,d);

（融点３４℃）。

実施例ＸＶＩ．４

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－置換－ピリジン類を２－クロロ－３置換－ピリジン類および臭化水素酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウムから製造するための一般法を示す。２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－３－ニトロピリジン（化合物ＸＶＩ．２４）を２－クロロ－３－ニトロピリジンから製造することにより、この方法を説明する。

臭化水素酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルイソチオウロニウム（１．２４ｇ）を、水酸化ナトリウム（０．６ｇ）の、水（１０cm^3）中における溶液に添加し、反応物を周囲温度で２０分間、激しく撹拌した。２－クロロ－３－ニトロピリジン（０．７９５ｇ）の、ジクロロメタン（１０cm^3）中における溶液を反応物に添加したのち、臭化テトラ－ｎ－ブチルアンモニウム（触媒量）を添加した。反応物を３時間、激しく撹拌した。混合物をジクロロメタンで希釈し、層を分離した。有機層をブラインで洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて黄色の油を得た。シリカゲル上で溶離剤としてヘキサン中の１５％ジエチルエーテルを用いるカラムクロマトグラフィーにより、化合物ＸＶＩ．２４（０．８４７ｇ）を得た。

M^+=246; ^{1}H NMR: δ 2.40(2H,m); 3.25(2H,t); 4.30(1H,m);

7.20(1H,dd); 8.50(1H,dd); 8.70(1H,dd);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した：

（ｉ）３－シアノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピリジン（化合物ＸＶＩ．８）。

M^+=226; ^{1}H

NMR: δ 2.40(2H,m); 3.30(2H,t); 4.25(1H,m); 7.10(1H,dd); 7.80(1H,dd); 8.55(1H,dd);

（油）。

実施例ＸＶＩ．５

この実施例は、酸化されていない対応する化合物（前記の各実施例の方法により製造）の４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ置換基のイオウ原子を酸化してスルホキシド（スルフィニル）またはスルホン（スルホニル）となすことによる、本発明化合物の製造に適した方法につき説明する。

化合物ＸＶＩ．２から１当量のオキシダントを用いた化合物ＸＶＩ．３の製造

化合物ＸＶＩ．２（０．８１８ｇ）をジクロロメタン（３０cm^3）中で０℃に冷却し、３－クロロ過安息香酸（０．９９ｇ）を５分間にわたって添加した。混合物を周囲温度で

６時間撹拌し、４０時間放置した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注入し、生成物をジクロロメタン中へ抽出した。有機相を水で洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させると黄色の油が得られ、これをソルブシル－Ｃ３０上でヘキサン中の１５％酢酸エチルにより溶離するクロマトグラフィー処理して、４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－２，３，５，６－テトラフルオロピリジン（０．７１１ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.45-2.8(2H,m); 3.15-3.3(1H,m); 3.5- 3.65(1H,m); 4.2-4.4(1H,m);

（油）。

化合物ＸＶＩ．１５から２当量のオキシダントを用いた５－シアノ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）ピリジン（化合物ＸＶＩ．１６）の製造

３－クロロ過安息香酸（固体５０％のもの３．１４ｇ）を、化合物ＸＶＩ．１５（１．０３ｇ）の、ジクロロメタン（３０cm^3）中における撹拌された溶液（０℃）に少量ずつ添加した。次いで反応物を周囲温度にまで昇温させ、４時間撹拌した。混合物を２Ｍ　水酸化ナトリウム水溶液に注入し、層を分離した。水層をジクロロメタンで抽出し、有機相を合わせて硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させると黄色の油が得られ、これは放置すると結晶化した。シリカゲル上で３：７酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるカラムクロマトグラフィーにより化合物ＸＶＩ．１６（０．７８５ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.40(2H,m); 3.25(2H,t); 4.25(1H,m); 7.25(1H,dd); 7.70(1H,dd); 8.65(1H,d);

（融点３４℃）。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した。

（ｉ）４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）ピリジン（化合物ＸＶＩ．６）。

^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.20(2H,t); 4.25(1H,m); 7.80(2H,d); 8.95(2H,d);

（油）。

（ii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－トリフルオロメチルピリジン（化合物ＸＶＩ．１２）。

^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.50(2H,t); 4.25(1H,m); 8.25(2H,d); 9.00(1H,br s);

（融点６０℃）

（iii）２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）ピリジン（化合物ＸＶＩ．２０）。

^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.50(2H,t); 4.25(1H,m); 7.55-7.50(1H,m); 8.00(1H,dt); 8.10(1H,d); 8.75(1H,d);

（油）。

実施例ＸＶＩＩ．１

この実施例は、３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－６－メチルピリダジン（化合物ＸＶＩＩ．１）の２工程製造法につき説明する。

工程１：３－メルカプト－６－メチルピリダジンの製造

３－クロロ－６－メチルピリダジン（５ｇ）およびチオ尿素（２．９６ｇ）をエタノール（５０cm^3）中で７．５時間、一緒に撹拌および加熱還流した。反応物を冷却し、１８時間放置した。生じた固体沈殿を濾別し、ジエチルエーテルで洗浄すると３－メルカプト－６－メチルピリダジン（２．３ｇ）が得られ、これをさらに精製せずに次ぎの工程に使

用した。
^{1}H NMR: δ 2.40(3H,s); 7.30(1H,d); 7.63(1H,d); 14.5- 14.7(1H,br s).

工程２：化合物ＸＶＩＩ．１の製造
工程１からの生成物（０．３３７ｇ）、４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（０．７０ｇ）、ヨウ化カリウム（０．４４４ｇ）および炭酸カリウム（０．３６９ｇ）の混合物をアセトン（２０ｃｍ^3）中で１１時間、一緒に撹拌および加熱還流した。無機固体を濾去し、濾液を減圧下で蒸発させて、褐色の油を得た。シリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、化合物ＸＶＩＩ．１（０．１５ｇ）を得た。
M$^+$=216; ^{1}H NMR: δ 2.48(2H,m); 2.62(3H,s); 3.36(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 7.10(1H,d); 7.21(1H,d);
（油）。
以下の本発明化合物および対応する中間化合物を上記工程１および２の方法で製造した。
（ｉ）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－６－クロロピリダジン（化合物ＸＶＩＩ．２）。
M$^+$=236; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.39(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 7.27(2H,s);
（油）、３，６－ジクロロピリダジンから。
（ii）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－６－メトキシピリダジン（化合物ＸＶＩＩ．３）。
M$^+$=232; ^{1}H NMR: δ 2.47(2H,m); 3.31(2H,t); 4.09(3H,s); 4.20-4.40(1H,m); 6.83(1H,d); 7.20(1H,d);
（固体、融点３９．３－４０．１℃）、３－クロロ－６－メトキシピリダジンから。
（iii）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－６－フェニルピリダジン（化合物ＸＶＩＩ．４）。
M$^+$=278; ^{1}H NMR: δ 2.54(2H,m); 3.46(2H,t); 4.25-4.42(1H,m); 7.39(1H,d); 7.51(3H,m); 7.69(1H,d); 8.05(2H,m);
（固体、融点９１．７－９２．１℃）、３－クロロ－６－フェニルピリダジンから。
（iv）１－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）フタラジン（化合物ＸＶＩＩ．７）。
M$^+$=252; ^{1}H NMR ($CDCl_3$): δ 2.59(2H,m); 3.55(2H,t); 4.28-4.45(1H,m); 7.89(3H,m); 8.12(1H,m); 9.25(1H,s);
（油）、１（２Ｈ）－フタラジンチオンから上記工程２の方法で。
実施例ＸＶＩＩ．２
この実施例は、化合物ＸＶＩＩ．４からの化合物ＸＶＩＩ．５および化合物ＸＶＩＩ．６の製造につき説明する。
化合物ＸＶＩＩ．４（０．５ｇ）を周囲温度でイソプロパノール（２０ｃｍ^3）中において撹拌し、マグネシウムモノペルオキシフタル酸・６水和物（水１０ｃｍ^{3}中０．８９ｇ）を添加した。混合物を周囲温度で２０時間撹拌した。沈殿した固体を濾別し、水で洗浄

した。濾液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注入し、追加の生成物を酢酸エチル中へ抽出した。有機層を合わせて飽和ブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させると灰白色固体が得られ、これを最初に沈殿した物質と合わせてシリカゲル上でヘキサン中の３０％酢酸エチルにより溶離してクロマトグラフィー処理した。最初に回収された生成物が３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－６－フェニルピリダジン（化合物ＸＶＩＩ．６）（０．２ｇ）であった。

M^+=310; ^{1}H NMR: δ 2.60(2H,m); 3.75(2H,t);

4.20-4.40(1H,m); 7.60(3H,m); 8.11(1H,d); 8.15(2H,m); 8.22(1H,d);

（固体、融点１４１．７－１４４．３℃）。さらに溶離して、３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－６－フェニルピリダジン（化合物ＸＶＩＩ．５）（０．２５ｇ）を得た。

M^+=294; ^{1}H NMR: δ 2.40 および 2.65(2H,m); 3.20-3.40(2H,m); 4.18-4.32(1H,m);

7.59(3H,m); 8.11(1H,d); 8.15(2H,m); 8.21(1H,d);

（融点１３３－１３４℃）。

実施例ＸＶＩＩＩ．１

この実施例は、２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）キノキサリン（化合物ＸＶＩＩＩ．１）の３工程製造法につき説明する。

工程１：キノキサリン－２－チオンの製造

２－キノキサリノール（１０ｇ）、五硫化リン（１６．７２ｇ）およびピリジン（２００cm^3）を７時間、一緒に撹拌および加熱還流した。反応混合物を放冷し、大部分のピリジンを減圧下での蒸発により除去した。残渣を酢酸エチルと水の間で分配し、有機層を分離した。水層を酢酸エチルでさらに３回抽出し、有機相を合わせて飽和ブライン水溶液で洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させると褐色の油性固体が得られ、これを高温の酢酸エチル：ヘキサン（１：１）で摩砕処理して生成物を溶解させると不溶性残渣が残った。溶剤を減圧下で除去すると橙色固体が得られ、その一部をさらに精製せずに工程２に使用した。

工程２：２－（４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルチオ）キノキサリンの製造

工程１からの生成物（１ｇ）、メタンスルホン酸４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチル（１．６５ｇ）および炭酸カリウム（０．８５２ｇ）の混合物をアセトン（３０cm^3）中で周囲温度において７時間、一緒に撹拌した。無機固体を濾去し、濾液を減圧下で蒸発させて、褐色の油を得た。シリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、２－（４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルチオ）キノキサリン（１．３７５ｇ）を得た。

M^+=332; ^{1}H NMR: δ 2.19(2H,m); 2.50-2.70(2H,m); 3.43(2H,t); 7.60-

7.73(2H,m); 7.93(1H,dd); 8.03(1H,dd); 8.60(1H,s);

（油）。

工程３：（化合物ＸＶＩＩＩ．１）の製造

１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン（ＤＢＵ）（１．１４cm^3）および工程２からの生成物（１．２７５ｇ）をトルエン（３０cm^3）中で撹拌し、５時間加熱還流した。混合物を冷却し、次いで過剰の酢酸エチルおよび２Ｍ塩酸水溶液を添加し、有機相を分離した。水相を酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせて飽和ブラインで洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて褐色の油を得た。シリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、化合物ＸＶＩＩＩ．１（０．６５ｇ）を得た。

M^+=252; ^{1}H NMR: δ

2.51(2H,m); 3.39(2H,t); 4.30-4.40(1H,m); 7.60-7.75(2H,m); 7.90(1H,dd); 8.03(1H,dd); 8.60(1H,s);

（油）。

以下の本発明化合物および対応する中間化合物を上記工程２および３の方法で製造した：

（ｉ）６－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）キノキサリン（化合物ＸＶＩＩＩ．４）。

M^+=286; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.35(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 7.65(1H,dd); 7.86(1H,d); 8.01(1H,d); 8.59(1H,s);

（油）、６－クロロキノキサリン－２－チオンから２－（４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルチオ）－６－クロロキノキサリンを経て。

^{1}H NMR: δ 2.08-2.21(2H,m); 2.48-2.68(2H,m); 3.40(2H,t); 7.65(1H,dd); 7.88(1H,d); 8.00(1H,d); 8.60(1H,s);

（油）。

実施例ＸＶＩＩＩ．２

この実施例は、２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピラジン（化合物ＸＶＩＩＩ．７）の２工程製造法につき説明する。

工程１：２－メルカプトピラジンの製造

２－クロロピラジン（５ｇ）およびチオ尿素（３．３２ｇ）をエタノール（５０ｃｍ^3）中で８時間加熱還流した。反応混合物を冷却し、エタノールを減圧下で除去すると褐色のガム（８．３１ｇ）が得られ、これを２Ｍ水酸化ナトリウム水溶液（５０ｃｍ^3）中で１６時間撹拌した。沈殿した固体を濾別し、水およびアセトンで洗浄し、真空乾燥した。これにより黄色固体（０．７２ｇ）

^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 7.69(1H,d); 7.89(1H,d); 8.6(1H,s),

が得られ、これをさらに精製せずに工程２に使用した。

工程２：化合物ＸＶＩＩＩ．７の製造

工程１からの生成物（０．２１３ｇ）、４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（０．５ｇ）、炭酸カリウム（０．２６３ｇ）およびヨウ化カリウム（０．３１７ｇ）をアセトン（１０ｃｍ^3）中で混合し、９時間加熱還流し、次いで週末にわたって放冷した。生じた沈殿を濾去し、濾液を減圧下で蒸発させて、褐色の油を得た。シリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、化合物ＸＶＩＩＩ．７（０．３ｇ）を得た。

M^+=202; ^{1}H NMR: δ 2.40(2H,m); 3.21(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 8.20(1H,d); 8.38(1H,t); 8.48(1H,s);

（油）。

実施例ＸＶＩＩＩ．３

この実施例は、３－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピラジン（化合物ＸＶＩＩＩ．１０）の２工程製造法につき説明する。

工程１：２－クロロ－３－メルカプトピラジンおよび２，３－ジメルカプトピラジンの製造

２，３－ジクロロピラジン（１ｇ）および硫化水素ナトリウム・２水和物（２．５ｇ）をイソプロパノール（２０ｃｍ^3）中で混合し、混合物を１時間加熱還流した。反応物を冷

却し、３６時間放置した。沈殿した黄色固体を濾取し、ジエチルエーテルで洗浄し、真空下に乾燥させた。濾液を廃棄した。固体を熱エタノールに溶解し、冷却して、沈殿した少量の硫化水素ナトリウムを濾取した。残されたエタノール溶液をジエチルエーテルで希釈すると黄色固体（０．３ｇ）が沈殿した。これは２，３－ジメルカプトピラジンの二ナトリウム塩と同定された。

MH^+(FAB)=188; ^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 7.35(1H,d); 7.50(1H,d).

母液を蒸発させると黄色固体（０．８ｇ）が得られ、これは２－クロロ－３－メルカプトピラジンのナトリウム塩と同定された。

M^+(FAB)=145; ^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 7.35(1H,d); 7.80(1H,d)

工程２：３－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピラジンの製造

工程１からのモノチオレート生成物（０．８ｇ）、４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（１．２４ｇ）および炭酸カリウム（０．６５５ｇ）を、ジメチルホルムアミド（５cm^3）を含有するアセトン（２５cm^3）中で混合し、１５時間加熱還流し、次いで放冷した。沈殿を濾去し、濾液を減圧下で蒸発させて、褐色の油を得た。シリカゲル上で９５：５ヘキサン：酢酸エチル混合物を溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、化合物ＸＶＩＩＩ．１０（０．４５ｇ）を得た。

M^+=236; ^{1}H NMR: δ 2.41(2H,m); 3.20(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 8.05(1H,d); 8.30(1H,d)

（油）。これは５％の化合物ＸＶＩＩＩ．１３を不純物として含有していた（ＧＣ）。

化合物ＸＶＩＩＩ．１３は工程１からのビスチオレート化生成物を、この実施例の工程２と同じ条件下に２当量の４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルで処理することにより独立して純粋に得られた。シリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサン混合物を溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、２，３－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピラジンを得た。

M^+=324; ^{1}H NMR: δ 2.40(4H,m); 3.22(4H,t); 4.20-4.40(2H,m); 8.07(2H,s)

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で製造した：

（ｉ）６－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）ピラジン（化合物ＸＶＩＩＩ．１４）。

M^+=236; ^{1}H NMR: δ 2.42(2H,m); 3.21(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 8.20(1H,s); 8.35(1H,s)

（油）、２，６－ジクロロピラジンから。

実施例ＸＶＩＩＩ．４

この実施例は、化合物ＸＶＩＩＩ．１からの化合物ＸＶＩＩＩ．２および化合物ＸＶＩＩＩ．３の製造につき説明する。

化合物ＸＶＩＩＩ．１（０．２５ｇ）を周囲温度でエタノール（１０cm^3）中において撹拌し、マグネシウムモノペルオキシフタル酸・６水和物（水５cm^3中０．５８９ｇ）を５分間にわたって添加した。３０分後に混合物を７０℃に１時間加熱した。反応混合物を冷却し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注入し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した。有機層を水で洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。溶剤を減圧下で蒸発させると灰白色固体（０．１５ｇ）が得られ、これをシリカゲル上でヘキサン中の１０％酢酸エチルにより溶離してクロマトグラフィー処理した。回収された主生成物が２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）キノキサリン（化合物ＸＶＩＩＩ．３）（０．１ｇ）であった。（融点８６．５－８７．５℃）。

M⁺=284; ^{1}H NMR: δ 2.61(2H,m); 3.62(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 8.00(2H,m); 8.25(2H,m); 9.51(1H,s).

ＴＬＣは、粗反応生成物中にこれより低いＲｆの物質２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）キノキサリン（化合物ＸＶＩＩＩ．２）が存在することを示したが、これは純粋な形では単離されなかった。
以下の本発明化合物を上記方法で製造した：
（ｉ）６－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）ピラジン（化合物ＸＶＩＩＩ．１５）。

M⁺=253;

^{1}H NMR: δ 2.30-2.70(2H,m); 3.00-3.30(2H,m); 4.19-4.35(1H,m); 8.70(1H,s); 9.10(1H,s)

（油）、化合物ＸＶＩＩＩ．１４から。
（ii）６－クロロ－２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）ピラジン（化合物ＸＶＩＩＩ．１６）。

M⁺=268;

^{1}H NMR: δ 2.55(2H,m); 3.50(2H,t); 4.20-4.35(1H,m); 8.90(1H,s); 9.19(1H,s)

（油）、化合物ＸＶＩＩＩ．１４から。

実施例ＸＩＸ．１

この実施例は、４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，３－ベンゾトリアジン（化合物ＸＩＸ．１）の３工程製造法につき説明する。

工程１：４－メルカプト－１，２，３－ベンゾトリアジンの製造

２－アミノベンゾニトリル（５ｇ）をピリジン（３０ｃｍ^3）中で撹拌し、トリエチルアミン（６ｃｍ^3）を添加し、硫化水素ガスを反応物に４時間にわたって吹き込んだ。次いで混合物を水（２０ｃｍ^3）に注入し、振盪して分離した油を分取し、エタノールおよびトルエンとの共沸により乾燥させた。これにより黄色固体（２－アミノチオベンズアミド、３ｇ）が得られ、これを２Ｍ塩酸（３０ｃｍ^3）中で０℃において撹拌した。水（１０ｃｍ^3）中の亜硝酸ナトリウム（１．６５ｇ）を滴加し、反応混合物を低温で１時間撹拌し、次いで周囲温度にまで昇温させ、さらに１時間撹拌した。生じた固体を濾別し、水で洗浄し、ジエチルエーテルで洗浄することにより乾燥させて、褐色固体（２．１５ｇ）を得た。

工程２：４－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，３－ベンゾトリアジンの製造

工程１の生成物（１ｇ）、メタンスルホン酸４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチル（１．６５ｇ）および炭酸カリウム（０．８５２ｇ）をアセトン（３０ｃｍ^3）中で周囲温度において３６時間、一緒に撹拌した。無機固体を濾去し、濾液を減圧下で蒸発させて、褐色の油を得た。シリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、２種類の黄色油（約０．５ｇ）を得た。最初に溶出した油はＮ－アルキル化された物質と同定され、２番目のものが目的とするＳ－アルキル化された中間体４－（４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルチオ）－１，２，３－ベンゾトリアジンであった。

^{1}H NMR: δ 2.18-2.31(2H,m); 2.58-2.71(2H,m); 3.63(2H,t); 7.95(1H,t); 8.09(2H,m); 8.40(1H,d).

工程３：化合物ＸＩＸ．１の製造

１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン（ＤＢＵ）（０．４５ｃｍ^3）および工程２からの生成物（０．５ｇ）をトルエン（１５ｃｍ^3）中で撹拌し、６時間加熱還流した。混合物を冷却し、次いで過剰の酢酸エチルおよび２Ｍ塩酸水溶液を添加し

、有機相を分離した。水相を酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせて飽和ブラインで洗浄し、無水硫酸マグネシウム乾燥させ、濾過し、減圧下で蒸発させて黄色の油を得た。シリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、化合物ＸＩＸ．１（０．２５ｇ）を得た。

MH^+=254; ^{1}H NMR: δ 2.60(2H,m); 3.60(2H,t); 4.30-4.40(1H,m); 7.93(1H,t); 8.09(2H,m); 8.39(1H,d);

（油）。

実施例ＸＸ．１

本発明化合物を製造するための中間体として必要なメルカプト－１，２，４－トリアジン類を製造する２方法（ＡおよびＢ）を以下に記載する。

方法Ａ

３－メルカプト－１，２，４－トリアジン類の一般的合成法はチオセミカルバジドと１，２－ジカルボニル化合物の反応によるものである。これを３－メルカプト－５－メチル－１，２，４－トリアジンの製造により説明する。

水（１００ｃｍ^3）中における炭酸水素ナトリウム（８ｇ）の溶液を、水（１００ｃｍ^3）中におけるチオセミカルバジド（８ｇ）の懸濁液に添加した。得られた溶液を５℃より低温に冷却し、ピルビンアルデヒド（水中の４０重量％溶液（２０ｃｍ^3））を添加した。溶液を５℃に１８時間保持し、次いでクロロホルムで洗浄した（５０ｃｍ^{3}で１０回）。濃塩酸で水層のｐＨを２に調整した。得られた沈殿を濾別し、大量の水で洗浄し、乾燥させて、橙色固体（４．０３６ｇ）を得た。この３－メルカプト－５－メチル－１，２，４－トリアジンをさらに精製せずに次の工程に使用した。

以下の中間体メルカプトトリアジンを上記方法で製造した。場合により水の代わりにエタノールを溶剤として用いた。出発物質は市販されていた。

（ｉ）３－メルカプト－１，２，４－トリアジン、グリオキサールから。

（ii）３－メルカプト－５－プロピル－６－メチル－１，２，４－トリアジン、ヘキサン－２，３－ジオンから。

^{1}H NMR: δ 0.98(3H,t); 1.54-1.68(2H,m); 2.08(3H,s); 3.04(2H,t); 8.2(1H,br s).

（iii）３－メルカプト－５－フェニル－６－メチル－１，２，４－トリアジン、１－フェニルプロパン－１，２－ジオンから。

方法Ｂ

メルカプト－１，２，４－トリアジン類を製造するための代替法は、対応するヒドロキシトリアジン類（種々の互変異性体の形で存在しうる）をチオール化剤、たとえば五硫化リンで処理することによる。これを以下に１，２，４－トリアジン－３，５（２Ｈ，４Ｈ）－ジオン（６－アザウラシル）からの１，２，４－トリアジン－３，５（２Ｈ，４Ｈ）－ジチオンの製造により説明する。

６－アザウラシル（２ｇ）、五硫化リン（１５．７２ｇ）およびピリジン５０ｃｍ^{3}を一緒に５６時間、撹拌および加熱還流した。反応混合物を放冷し、大部分のピリジンを減圧下での蒸発により除去した。残渣をジエチルエーテルおよび水と共に撹拌し、有機層を分離した。水層をジエチルエーテルでさらに３回抽出し、有機層を合わせて飽和ブライン水溶液で洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、減圧下で蒸発させて褐色の油を得た。これをシリカゲル上で１：５酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いてクロマトグラフィー処理した。これにより橙色固体（１ｇ）が得られ、これをさらに精製せずに使用した。

^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 7.95(1H,s); 13.8-14.1(1H,br s); 14.3-14.6(1H,br s)

３－メルカプト－１，２，４－ベンゾトリアジンを３－ヒドロキシ－１，２，４－ベンゾトリアジンから、また６－メチル－１，２，３－トリアジン－５（４Ｈ）－チオンを６－メチル－１，２，３－トリアジン－５（４Ｈ）－オンから、本質的に上記方法で製造した。

実施例ＸＸ．２

この実施例は３、５または６－位において４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ基で

置換された１，２，４－トリアジン類を含む本発明化合物を、対応して置換されたメルカプトトリアジンおよび適宜なアルキル化剤ジフルオロブト－１－エンから出発して製造することにつき説明する。これを以下に６－アザ－２－チオウラシルおよび４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニルからの３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－ヒドロキシ－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２２７）の製造により示す。

４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（１．５ｇ）およびヨウ化カリウム（０．９５ｇ）をエタノール（５ｃｍ^3）中で撹拌し、３時間加熱還流し、次いで放冷した。この方法のこの部分で出発物質が化学的にいっそう反応性の高いチオ選択性アルキル化剤４－ヨード－１，１－ジフルオロブト－１－エンに変換される。６－アザ－２－チオウラシル（０．７４４ｇ）を１Ｍ水酸化ナトリウム水溶液（５．７３ｃｍ^3）中の溶液として添加し、反応混合物を周囲温度で７０時間撹拌した。反応物を過剰の１Ｍ水酸化ナトリウム水溶液および酢酸エチルの添加により仕上げ処理した。酢酸エチル層を分離し、水層をさらに酢酸エチルで洗浄した。これらの抽出液を廃棄した。次いで水層を２Ｍ塩酸水溶液でｐＨ４に酸性化した。生成物を酢酸エチル中へ抽出し（３回）、これらの有機層を合わせて水および飽和ブライン水溶液で洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。生成物を減圧下での蒸発により溶液から回収してクリーム色固体（０．６５９ｇ）を得た。一部を熱酢酸エチルに溶解し、若干の不溶性物質を濾過去した。溶液から蒸発により回収した化合物ＸＸ．２２７は融点１０２－１０３℃を有していた。

M^+=219; ^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 2.41(2H,m); 3.25(2H,t); 4.55-4.75(1H,m); 7.69

および7.79（全1H,ea s,互変異性プロトン）。

以下の関連法を用いて化合物ＸＸ．２４７を製造した。

６－メチル－１，２，３－トリアジン－５（４Ｈ）－チオン（０．５ｇ）、４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エン（０．６７３ｇ）および炭酸カリウム（０．５４３ｇ）を一緒にアセトン（５ｃｍ^3）中で周囲温度において６０時間撹拌した。次いで無機物質を濾別し、アセトンで洗浄した。合わせたアセトン溶液から減圧下での蒸発により溶剤を除去し、残留する褐色のガムをシリカ上でヘキサン中の２０％酢酸エチルにより溶離してクロマトグラフィー処理し、５－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－６－メチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２４７）（０．０７５ｇ）を得た。

M^+=217; ^{1}H NMR: δ 2.45(2H,m); 2.60(3H,s); 3.29(2H,t); 4.20- 4.40(1H,m); 9.11(1H,s);

（油）。

実施例ＸＸ．３

メルカプトトリアジンがアセトンに完全に溶解し、かつ妨害の可能性がある他の求核基を保有しない場合、実施例ＸＸ．２の代替法を採用しうる。

これを以下に１，２，４－トリアジン－３，５（２Ｈ，４Ｈ）－ジチオンおよび４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロ－３－ブテニルからの３，５－ビス－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２３１）の製造により説明する。

１，２，４－トリアジン－３，５（２Ｈ，４Ｈ）－ジチオン（１ｇ）、４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（３．６ｇ）、ヨウ化カリウム（１．１４ｇ）および炭酸カリウム（０．９５２ｇ）をアセトン（２０ｃｍ^3）中で７時間、撹拌および加熱還流した。溶液を冷却し、固体を濾別した。濾液と固体の追加アセトン洗液とを合わせて減圧下で蒸発させて、褐色の油を得た。シリカゲル上で１５：８５酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、化合物ＸＸ．２３１（１ｇ）を橙色の油として得た。

M^+=325; ^{1}H NMR: δ 2.40-2.55(4H,m); 3.25(4H,m); 4.15-4.40(2H,m); 8.70(1H,s).

実施例ＸＸ．４

この実施例はメルカプト置換１，２，４－トリアジンとメタンスルホン酸４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルの反応、続いて得られた中間体の脱臭化水素により本発明化合物を２工程製造するための一般法につき説明する。これを以下に３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－フェニル－６－メチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．４）の製造により示す。

工程１：３－（４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルチオ）－５－フェニル－６－メチル－１，２，４－トリアジン

メタンスルホン酸４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチル（０．７ｇ）、３－メルカプト－５－フェニル－６－メチル－１，２，４－トリアジン（０．５ｇ）および炭酸カリウム（０．７ｇ）の混合物を一緒にアセトン（４０ｃｍ^3）中で１４時間、撹拌および加熱還流した。無機固体を濾去し、濾液を減圧下で蒸発させて褐色の油（１．０５８ｇ）を得た。シリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、橙色の油（０．５７６ｇ）を得た。これをトリフルオロ酢酸（３ｃｍ^3）中で６時間、撹拌および加熱還流し、部分加水分解および開環処理した若干の物質を再循環させた。減圧下での溶剤の蒸発とシリカゲル上でのクロマトグラフィーにより生成物を回収し、３－（４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルチオ）－５－フェニル－６－メチル－１，２，４－トリアジン（０．５０９ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.12-2.24(2H,m); 2.48-2.68(2H,m); 2.78(3H,s); 3.36(2H,t); 7.50-7.58(3H,m); 7.68-7.74(2H,m);

（油）

工程２：３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－フェニル－６－メチル－１，２，４－トリアジン

１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン（ＤＢＵ）（１ｃｍ^3）を、工程１からの生成物（０．５ｇ）の、トルエン（１０ｃｍ^3）中における撹拌された溶液に滴加した。混合物を周囲温度に２０時間保持し、次いで過剰の酢酸エチルおよび飽和塩化アンモニウム水溶液を添加し、有機相を分離した。水相を酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせて飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて橙色の油（０．４３ｇ）を得た。シリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより、化合物ＸＸ．４（０．２８１ｇ）を得た。

M^+=293; ^{1}H NMR: δ 2.48-2.58(2H,m); 2.76 (3H,s); 3.32(2H,t); 4.22-4.40(1H,m); 7.48-7.58(3H,m); 7.68-7.76(2H,m);

（油）。

実施例ＸＸ．５

この実施例は、トリアジン環の５－位にアルコキシまたは置換アルコキシ基を保有する本発明化合物を、３および５－位の両方にアルケニルチオ基を保有する化合物から製造するのに適した方法につき説明する。これを以下に、化合物ＸＸ．２３１からの３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メトキシ－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２２１）の製造により示す。

化合物ＸＸ．２３１（０．５ｇ）をナトリウムメトキシド（０．０８３ｇ）と共にメタノール（１５ｃｍ^3）中で周囲温度で１時間撹拌した。溶剤を減圧下での蒸発により除去し、残渣をシリカゲル上で１５：８５酢酸エチル：ヘキサンにより溶離してクロマトグラフィー処理し、０．１２ｇの化合物ＸＸ．２２１

M^+=233; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.29(2H,t); 4.02(3H,s); 4.22-4.42(1H,m); 8.55(1H,s)

を単一異性体として得た。それが５－メトキシ化合物であることはＮＭＲにより確認された。

以下の本発明化合物を上記方法で、適宜なアルコキシドを用いて溶剤としての対応するアルコール中で製造した。

（ｉ）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（１－メチル－エトキシ－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２０５）。

M^+=261; ^{1}H NMR: δ 1.4(6H,d); 2.5(2H,m); 3.25(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 5.4(1H,m); 8.45(1H,s).

（ii）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－エトキシ－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２１８）。

M^+=247; ^{1}H NMR: δ 1.43(3H,t); 2.50(2H,m); 3.26(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 4.46(2H,q); 8.5(1H,s)

実施例ＸＸ．６

この実施例は１：１混合物としての化合物ＸＸ．５２およびＸＸ．１１６の製造に用いられる２工程法につき説明する。

工程１：３－（４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルチオ）－５－メチル－１，２，４－トリアジンおよび３－（４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチルチオ）－６－メチル－１，２，４－トリアジン

メタンスルホン酸４－ブロモ－４，４－ジフルオロブチル（１ｇ）およびチオセミカルバジド（０．４７５ｇ）を一緒にエタノール（２０cm^3）中で５時間、撹拌および加熱還流した。ＧＣはメタンスルホネートが完全に消費されたことを示した。混合物を放冷し、水（３cm^3）および炭酸水素ナトリウム（１ｇ）を添加した（泡立つ）。次いでピルビンアルデヒド（１cm^3）の４０重量％溶液を添加し、混合物を周囲温度で４時間撹拌した。ＴＬＣは生成物が形成されたことを示した。それを酢酸エチル中へ抽出し、有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、蒸発させて油（１．２０９ｇ）を得た。この中間生成物をシリカゲル上で１：４酢酸エチル：ヘキサンにより溶離するクロマトグラフィーによって精製して、黄色の油（０．４６４ｇ）を得た。これは^{1}Ｈ ＮＭＲ：δ2.08-2.20（2H,m）；2.48-2.62（2H,m）；2.52および2.66（全3H,ea s）；3.28-3.38（2H,m）；8.28および8.84（全1H,ea s）を有し、５－および６－メチル異性体のほぼ１：１混合物であることが示された。

工程２：３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－メチル－１，２，４－トリアジンおよび３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－６－メチル－１，２，４－トリアジン

工程１からの生成物の混合物（０．４６ｇ）を実施例ＸＸ．４の工程２と同様な方法でＤＢＵ中により脱臭化水素し、生成物（０．２５３ｇ）をシリカゲル上でジクロロメタンにより溶離するクロマトグラフィーによって精製した。これらの条件下では５－メチル異性体と６－メチル異性体を分離することができず、０．２３２ｇの黄色油が得られた。これはM^+＝217；^{1}Ｈ ＮＭＲ；δ2.44-2.54（2H,m）；2.50および2.66（全3H,ea s）；3.26-3.34（2H,m）；4.22-4.40（1H,m）；8.28および8.82（全1H,ea s）を有し；これは化合物ＸＸ．５２およびＸＸ．１１６の１：１混合物であることを示した。

本発明によるＸＸ．２５１を上記方法で、ただし工程１でピルビンアルデヒドの代わりにシクロヘキサン－１，２－ジオンを用いて製造した。

^{1}Ｈ ＮＭＲ；δ 1.86-1.98(4H,m); 2.42-2.54(2H,m); 2.84-2.92(2H,m); 3.04-3.12(2H,m); 3.28(2H,t); 4.22-4.38(1H,m);

（油）。

実施例ＸＸ．７

この実施例はクロマトグラフィーにより分離しうる混合物としての化合物ＸＸ．５２およびＸＸ．１１６の製造に用いられる代替法につき説明する。

４－メチルベンゼンスルホン酸４，４－ジフルオロブト－３－エニル（１ｇ）およびチオセミカルバジド（０．４ｇ）を一緒にエタノール（２０ｃｍ^3）中で６時間、撹拌および加熱還流した。混合物を一夜放冷すると、Ｓ－アルキル化された化合物の結晶質黄色沈殿が生じた。これを分離せず、減圧下での蒸発により溶剤を除去し、残渣（１．３ｇ）を炭酸水素ナトリウム（０．９２８ｇ）、水（３ｃｍ^3）およびエタノール（２０ｃｍ^3）で処理した。次いでピルビンアルデヒドの４０重量％溶液（０．９ｃｍ^3）を添加し（わずかに泡立つ）、混合物を周囲温度で１時間撹拌した。反応物を水に注入し、生成物を酢酸エチル中へ抽出した（３回）。有機相を乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、蒸発させて褐色のガム（０．８５ｇ）を得た。シリカゲル上でヘキサン中の１０％酢酸エチルにより溶離するクロマトグラフィーによって、化合物ＸＸ．１１６と同定された画分（０．０５ｇ）（ＮＭＲによれば１０％の化合物ＸＸ．５２を含有）を得た。溶離を続けて、化合物ＸＸ．５２およびＸＸ．１１６のほぼ１：１混合物を含有する混合画分（０．１６ｇ）、次いで化合物ＸＸ．５２と同定された画分（０．１ｇ）（ＮＭＲによれば１５％の化合物ＸＸ．１１６を含有）を得た。

実施例ＸＸ．８

この実施例は、チオセミカルバジドと４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンの反応、次いで中間体と１，２－ジカルボニル化合物の環化により本発明化合物を２工程製造するための一般法につき説明する。これを以下に３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．１３７）の製造により示す。

チオセミカルバジド（２．６ｇ）を４－ブロモ－１，１－ジフルオロブト－１－エンと共にエタノール（７５ｃｍ^3）中で撹拌し、混合物を７時間加熱還流し、周囲温度にまで放冷した。グリオキサール（４０％水溶液４．２ｇ）および炭酸水素ナトリウム（７．３７ｇ）を添加し、得られた混合物を周囲温度で１８時間撹拌した。水を添加し、生成物を酢酸エチル中へ３回抽出した。有機相を合わせて飽和ブラインで洗浄し、乾燥させ（$MgSO_4$）、濾過し、減圧下で蒸発させて褐色のガムを得た。シリカゲル上でヘキサン中の２０％酢酸エチルにより溶離してクロマトグラフィーし、化合物ＸＸ．１３７を得た。

M^+=203; ^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.30(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 8.39(1H,d); 8.95(1H,d)

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で、適宜な１，２－ジカルボニル化合物をグリオキサールの代わりに用いて製造した：

（ｉ）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－プロピル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２７）。２－オキソペンタナールから。

M^+=245; ^{1}H NMR: δ 1.0(3H,t); 1.7-1.85(2H,m); 2.45-2.55(2H,m); 2.6(2H,t); 3.3(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 8.8(1H,s)

（油）。この製造により異性体化合物ＸＸ．１０９も得られた；

M^+=245; ^{1}H NMR: δ 1.0(3H,t); 1.75-1.9(2H,m); 2.45-2.55(2H,m); 2.9(2H,t); 3.3(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 8.25(1H,s)

（油）；

クロマトグラフィーにおいてより速やかに走行する後者の異性体は製造された混合物の約８％であった。

（ii）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－エチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．３０）。２－オキソブタナールから。

M^+=231; ^{1}H NMR: δ 1.3-1.4(3H,t); 2.45-2.55(2H,m); 2.75-2.85(2H,q); 3.25-3.35(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 8.85(1H,s)

（油）。

異性体化合物ＸＸ．１１０が反応混合物中に検出されたが、単離されなかった。しかしそ

れは２－オキソブタナールの代わりに１，１－ジエトキシブタン－２－オンを用いた場合には環化の主生成物であった。最初に水中でイミンを形成し、次いでアセトン水溶液中でピリジニウムトシレート触媒により環化して、化合物ＸＸ．１１０を得た。

M^+=231; ^{1}H NMR: δ 1.4(3H,t); 2.50(2H,m); 2.95(2H,q); 3.3(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 8.29(1H,s)

（油）。

（iii）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－６－メチル－１，２，４－トリアジン－５（４Ｈ）オン（化合物ＸＸ．２２６）。ピルビン酸から。

M^+=233; ^{1}H NMR (DMSO-d_6): δ 2.05(3H,s); 2.30(2H,m); 3.12(2H,t); 4.4-4.6(1H,m)

（ガム）。

以下の本発明化合物を上記方法で、２，２－ジクロロアルデヒドをグリオキサールの代わりに用いて製造した：

（iv）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－５－（１－メチル－エチル）－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．１５）。

M^+=245; ^{1}H NMR: δ 1.32(6H,d); 2.50(2H,m); 3.0(1H,m); 3.3(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 8.82(1H,s)

（油）；およびクロマトグラフィーにおいてより速やかに走行する異性体３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－６－（１－メチル－エチル）－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．９８）。

M^+=245; ^{1}H NMR: δ 1.4(6H,d); 2.50(2H,m); 3.18-3.35(3H,m); 4.20-4.40(1H,m); 8.30(1H,s)

（油）。２，２－ジクロロ－３－メチルブタナールから。

実施例ＸＸ．９

この実施例は化合物ＸＸ．５２からの５－ジクロロメチル－３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．６５）の製造につき説明する。

化合物ＸＸ．５２（３．１ｇ）およびＮ－クロロスクシンイミド（２ｇ）を四塩化炭素（４０ｃｍ^3）中で一緒に１時間、撹拌および加熱還流した。混合物を放冷し、周囲温度で４時間撹拌した。減圧下での蒸発により溶剤を除去し、黒色タール状残渣をジエチルエーテル（４０ｃｍ^3）に懸濁し、ハイ－フロ濾過助剤床に導通した。不溶性物質をさらにジエチルエーテルで洗浄し、溶液を合わせて減圧下で蒸発させた。残渣をシリカ上でジエチルエーテル：ヘキサン１：１により溶離するクロマトグラフィーによって精製し、生成物を含有する画分を減圧下で蒸発させ、ヘキサン中の３０％ジエチルエーテルで溶離する調製用ＴＬＣによりさらに精製して、化合物ＸＸ．６５（０．２ｇ）を得た。

^{1}H NMR: δ 2.50(2H,m); 3.3(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 6.50(1H,s); 9.37(1H,s);

（油）。

実施例ＸＸ．１０

この実施例は化合物ＸＸ．２７からの３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－プロピル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．２８）の製造につき説明する。

化合物ＸＸ．２７（０．２ｇ）を５℃においてジクロロメタン（５ｃｍ^3）中で撹拌し、３－クロロ過安息香酸（０．２８２ｇ、２当量）を添加した。周囲温度で１８時間撹拌を続けた。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液の添加により反応を停止し、生成物をジクロロメタン中へ抽出した。有機相を分離し、飽和ブラインで洗浄し、乾燥させた（$MgSO_4$）。濾過および減圧下での蒸発による濃縮ののち油が得られ、これをシリカゲル上で３：７

酢酸エチル：ヘキサンを溶離剤として用いるクロマトグラフィーにより精製して、化合物ＸＸ．２８（０．１８７ｇ）を得た。

M^+=277; ^{1}H NMR: δ 1.0-1.1(3H,t); 1.8-1.95(2H,m); 2.6-2.7(2H,m); 2.9-3.0(2H,t); 3.7-3.8(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 9.3(1H,s);

（油）。

以下の本発明化合物を上記方法で、１．７５当量のオキシダントを用いて製造した：

（ｉ）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－５－メチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．５３）

M^+=233; ^{1}H NMR: δ 2.35-2.7(2H,m); 2.75(3H,s); 3.2-3.4(2H,m); 4.2-4.35(1H,m); 9.25(1H,s);

（油）、および３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－５－メチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．５４）

MH^+=250; ^{1}H NMR: δ 2.6-2.7(2H,m); 2.8(3H,s); 3.7-3.8(2H,t); 4.25-4.4(1H,m); 9.35(1H,s);

（油）、化合物ＸＸ．５２から。

（ii）３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルフィニル）－６－メチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．１１７）

MH^+=234; ^{1}H NMR: δ 2.3-2.75(2H,m); 2.85(3H,s); 3.2-3.4(2H,m); 4.15-4.3(1H,m); 8.7(1H,s);

（油）、および３－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルスルホニル）－６－メチル－１，２，４－トリアジン（化合物ＸＸ．１１８）

MH^+=250; ^{1}H NMR: δ 2.6-2.7(2H,m); 2.9(3H,s); 3.65-3.75(2H,t); 4.2-4.4(1H,m); 8.75(1H,s);

（油）、化合物ＸＸ．１１６から。

実施例ＸＸＩ．１

この実施例は２－（４，４－ジフルオロブト－３－エニルチオ）－１，３，５－トリアジン（化合物ＸＸＩ．１）の製造につき説明する。

（４，４－ジフルオロブト－３－エニル）－チオ尿素（その４－メチル－ベンゼンスルホン酸塩として）（０．９ｇ）および１，３，５－トリアジン（０．２１６ｇ）をエタノール（２０ｃｍ^3）中で４時間、一緒に加熱還流した。反応混合物を冷却し、溶剤を蒸発により除去して固体となし、これをヘキサンで摩砕処理した。ヘキサン可溶性物質を減圧下での蒸発により回収した。これにより化合物ＸＸＩ．１（０．４ｇ）を得た。

M^+=203; ^{1}H NMR: δ 2.45(2H,m); 3.20(2H,t); 4.20-4.40(1H,m); 8.82(2H,s);

（油）。

式（Ｉ）の化合物は殺線虫性であり、植物における線虫を防除するために使用しうる。したがって本発明の他の観点においては、式（Ｉ）の化合物を線虫に適用することを含む、線虫の撲滅または防除方法が提供される。

“防除”という語は、宿主植物に対する損傷を防止し、線虫集団の増加を制限する結果をもたらす、非致死的効果をも包含する。この効果は化学薬品誘発性の見当識障害、非可動化、または孵化の阻害もしくは誘導の結果であると考えられる。この化学薬品処理は線虫の生育または繁殖にも有害な作用を及ぼす可能性がある。

本発明化合物は植物寄生性線虫および土壌中の自由生活性線虫の双方に対して使用しうる。

植物寄生性線虫はたとえば以下のものである：外部寄生虫、たとえばＸｉｐｈｉｎｅｍａ

ｓｐｐ．、Ｌｏｎｇｉｄｏｒｕｓ ｓｐｐ．およびＴｒｉｃｈｏｄｏｒｕｓ ｓｐｐ．；半寄生虫、たとえばＴｙｌｅｎｃｈｕｌｕｓ ｓｐｐ．；遊走性内部寄生虫、たとえばＰｒａｔｙｌｅｎｃｈｕｓ ｓｐｐ．、Ｒａｄｏｐｈｏｌｕｓ ｓｐｐ．およびＳｃｕｔｅｌｌｏｎｅｍａ ｓｐｐ．；定住性寄生虫、たとえばＨｅｔｅｒｏｄｅｒａ ｓｐｐ．、Ｇｌｏｂｏｄｅｒａ ｓｐｐ．およびＭｅｌｏｉｄｏｇｙｎｅ ｓｐｐ．；ならびに幹および葉の内部寄生虫、たとえばＤｉｔｙｌｅｎｃｈｕｓ ｓｐｐ．、Ａｐｈｅｌｅｎｃｈｏｉｄｅｓ ｓｐｐ．およびＨｉｒｓｈｍａｎｉｅｌｌａ ｓｐｐ．。

式（Ｉ）の化合物は、シスト線虫を含めた種々のタイプの線虫に対しても活性を示す。

本発明化合物は、生育中および貯蔵中の農作物、森林、温室作物、鑑賞植物、苗床作物、貯蔵中の食品および繊維製品における他の害虫に対しても活性を示す。これらの害虫には以下のものが含まれる：

異翅亜目／同翅亜目：Ｍｙｚｕｓ ｐｅｒｓｉｃａｅ、Ａｐｈｉｓ ｇｏｓｓｙｐｉｉ、Ａｐｈｉｓ ｆａｂａｅ、Ｒｈｏｐａｌｏｓｉｐｈｕｍ ｐａｄｉ、Ａｏｎｉｄｉｅｌｌａ ｓｐｐ．、Ｔｒｉａｌｅｕｒｏｄｅｓ ｓｐｐ．、Ｂｅｍｉｓｉａ ｔａｂａｃｉ、Ｎｉｌａｐａｒｖａｔａ ｌｕｇｅｎｓ、Ｎｅｐｈｏｔｅｔｔｉｘ ｃｉｎｃｔｉｃｅｐｓ、Ｎｅｚａｒａ ｖｉｒｉｄｕｌａ、Ｄｙｓｄｅｒｃｕｓ ｓｕｔｕｒｅｌｌｕｓ、Ｄｙｓｄｅｒｃｕｓ ｆａｓｃｉａｔｕｓおよびＬｙｇｕｓ ｌｉｎｅｏｒａｌｉｓを含む。

双翅目：Ｃｅｒａｔｉｔｉｓ ｃａｐｉｔａｔａ、Ｔｉｐｕｌａ ｓｐｐ．、Ｏｓｃｉｎｅｌｌａ ｆｒｉｔ、Ｌｉｒｉｏｍｙｚａ ｓｐｐ．、Ｄｅｌｉａ ｓｐｐ．およびＰｅｒｏｍｙａ ｓｐｐ．を含む。

りん翅目：Ｐｉｅｒｉｓ ｂｒａｓｓｉｃａｅ、Ｐｌｕｔｅｌｌａ ｘｙｌｏｓｔｅｌｌａ、Ｓｐｏｄｏｐｔｅｒａ ｌｉｔｔｏｒａｌｉｓその他のＳｐｏｄｏｐｔｅｒａ ｓｐｐ．、Ｈｅｌｉｏｔｈｉｓ ｖｉｒｅｓｃｅｎｓその他のＨｅｌｉｏｔｈｉｓおよびＨｅｌｉｃｏｖｅｒｐａ ｓｐｐ．、ならびにＣｈｉｌｏ ｐａｒｔｅｌｌｕｓを含む。

甲虫類：Ｐｈａｅｄｏｎ ｃｏｃｈｌｅａｒｉａｅ、Ｄｉａｂｒｏｔｉｃａｓｐｐ．、Ａｇｒｏｔｉｓ ｓｐｐ．およびＬｅｐｔｉｎｏｔａｒｓａ ｄｅｃｅｍｌｉｎｅａｔａを含む。

ゴキブリ類：Ｂｌａｔｔｅｌｌａ ｇｅｒｍａｎｉｃａ、Ｐｅｒｉｐｌａｎｅｔａ ａｍｅｒｉｃａｎａおよびＢｌａｔｔａ ｏｒｉｅｎｔａｌｉｓを含む。

直翅目：Ｃｈｏｒｔｉｏｃｅｔｅｓ ｔｅｒｍｉｎｉｆｅｒａ、Ｓｃｈｉｓｔｏｃｅｒｃａ ｓｐｐ．、Ｌｏｃｕｓｔａ ｓｐｐ．およびＳｃａｐｔｅｒｉｓｃｕｓ ｓｐｐ．を含む。

ダニ目：Ｐａｎｏｎｙｃｈｕｓ ｕｌｍｉ、Ｐａｎｏｎｙｃｈｕｓ ｃｉｔｒｉ、Ｔｅｔｒａｎｙｃｈｕｓ ｕｒｔｉｃａｅ、Ｔｅｔｒａｎｙｃｈｕｓ ｃｉｎｎａｂａｒｉｎｕｓ、Ｐｈｙｌｌｏｃｏｐｔｒｕｔａ ｏｌｅｉｖｏｒａおよびＢｒｅｖｉｐａｌｐｕｓ ｓｐｐ．を含む。

本発明化合物は、たとえば以下の家畜、家庭内、公衆および動物の衛生害虫に対しても使用しうる：

隠翅目：Ｃｔｅｎｏｃｅｐｈａｌｉｄｅｓ ｆｅｌｉｓ、Ｃｔｅｎｏｃｅｐｈａｌｉｄｅｓ ｃａｎｉｓ、Ｘｅｎｏｐｓｙｌｌａ ｃｈｅｏｐｉｓおよびＰｕｌｅｘ ｉｒｒｉｔａｎｓを含む。

ハジラミ目：Ｍｅｎｏｐｏｎ ｇａｌｌｉｎａｅおよびＣｕｃｌｏｔｏｇａｓｔｅｒ ｈｅｔｅｒｏｇｒａｐｈｕｓを含む。

シラミ属：Ｐｅｄｉｃｕｌｕｓ ｈｕｍａｎｕｓ ｃａｐｉｔｉｓ、Ｐｅｄｉｃｕｌｕｓ ｈｕｍａｎｕｓ ｈｕｍａｎｕｓ、およびＰｈｔｈｉｒｕｓ ｐｕｂｉｓを含む。

双翅目：Ｍｕｓｃａ ｄｏｍｅｓｔｉｃａ、Ａｅｄｅｓ ａｅｇｙｐｔｉ、Ａｎｏｐｈｅｌｅｓ ｇａｍｂｉａｅ、Ｃｕｌｅｘ ｑｕｉｎｑｕｅｆａｓｃｉａｔｕｓ、Ｃｈｒｙｓｏｐｓ ｄｉｓｃａｌｉｓおよびＴａｂａｎｕｓ ｎｉｇｒｏｖｉｔｔａｔｕｓを含む。

ニクバエ科：Ｓａｒｃｏｐｈａｇａ ｈａｅｍｏｒｒｈｏｉｄａｌｉｓおよびＷｏｈｌｆ

ａｈｒｔｉａ　ｍａｇｎｉｆｉｃａを含む。
クロバエ科：Ｌｕｃｉｌｉａ　ｃｕｐｒｉｎａおよびＣｏｒｄｙｌｏｂｉａ　ａｎｔｈｒｏｐｏｐｈａｇａを含む。
ヒツジバエ科：Ｏｅｓｔｒｕｓ　ｏｖｉｓを含む。
一般に本発明化合物は、ヒトおよび動物に有害な、および／またはその疾病の媒介に付随する害虫の撲滅および防除に使用しうる。本発明化合物の使用により撲滅および防除しうる害虫には哺乳類を含めた動物の寄生性線虫が含まれ、これらは胃腸管、呼吸管および心臓の気道または血管、並びにそれに付随する血管中に見出される。
式（Ｉ）の化合物は脊椎動物、たとえば哺乳類（たとえば、ヒト、ブタ、ヒツジ、ウシ、ウマ、ネコおよびイヌ）、鳥類（たとえばニワトリ、アヒル、シチメンチョウ、ガチョウ、カナリアおよびセキセイインコ）、および魚（たとえばサケ、マスおよび鑑賞魚）の処理に使用しうる。
線虫その他の害虫は、有効量の１種類または２種類以上の本発明化合物を、害虫の環境に、保護すべき区域に、また害虫に直接に適用することにより撲滅／防除することができる。
本発明化合物を線虫、昆虫またはダニなどの害虫が存在する部位に、または線虫、昆虫もしくはダニなどの害虫による攻撃を受けやすい植物に適用するためには、本発明化合物を通常は、式（Ｉ）の化合物のほかに適切な不活性希釈剤またはキャリヤー物質および／または界面活性剤を含有する組成物中に配合する。したがって本発明の他の２観点においては、本明細書に定める式（Ｉ）の化合物の有効量および不活性希釈剤またはキャリヤー物質および所望により界面活性剤を含有する、殺線虫性、殺虫性または殺ダニ性組成物が提供される。
有害線虫の防除のために一般に適用される組成物の量は、０．０１－１０ｋｇ／ｈａ、好ましくは０．１－６ｋｇ／ｈａの割合の有効成分を与える。
組成物は保護すべき土壌、植物、種子もしくは他の区域に、害虫の存在部位に、または害虫の生息環境に、散布剤、湿潤性散剤、顆粒剤（徐放性または即時放出性）、乳剤または懸濁剤濃縮液、液剤、乳剤、種子処理剤（ｓｅｅｄ　ｄｒｅｓｓｉｎｇ）、煙霧／くん煙配合物、または制御放出組成物、たとえばマイクロカプセル化された顆粒剤または懸濁剤の形で適用することができる。
散布剤は、有効成分を１種類または２種類以上の微細な固体キャリヤーおよび／または希釈剤、たとえば天然のクレー、カオリン、葉ろう石、ベントナイト、アルミナ、モンモリロナイト、多孔質けいそう土（ｋｉｓｅｌｇｕｈｒ）、チョーク、けいそう土（ｄｉａｔｏｍａｃｅｏｕｓ　ｅａｒｔｈ）、リン酸カルシウム、炭酸カルシウムおよびマグネシウム、イオウ、石灰、穀粉、タルク、ならびに他の有機および無機固体キャリヤーと混合することにより調製される。
顆粒剤は、有効成分を多孔質顆粒材料、たとえば軽石、アタパルジャイトクレー、フラー土、多孔質けいそう土、けいそう土、粉砕トウモロコシ穂軸などに、または堅いコア材料、たとえば砂、シリケート、鉱物カーボネート、スルフェート、ホスフェートなどに吸収させることにより調製される。有効成分による固体キャリヤーの含浸、結合またはコーティングを助成するために慣用される物質には、脂肪族および芳香族の石油系溶剤、アルコール類、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、エーテル類、ケトン類、エステル類、デキストリン類、糖類および植物油が含まれる。他の添加物、たとえば乳化剤、湿潤剤または分散助剤が含有されてもよい。
マイクロカプセル化配合物（マイクロカプセル化懸濁剤ＣＳ）または他の制御放出配合物も、特に一定期間にわたる緩徐な放出のために、または種子処理のために使用しうる。
あるいは組成物は浸漬剤、潅漑添加物または噴霧剤として使用する液剤の形であってもよく、それらは一般に１種類または２種類以上の既知の湿潤剤、分散助剤または乳化剤（界面活性剤）の存在下における有効成分の水性分散剤または乳剤である。水性分散剤または乳剤の形で使用される組成物は、一般に高い割合の有効成分（１種類または２種類以上）を含有する乳化性濃縮液（ＥＣ）または懸濁剤濃縮液（ＳＣ）の形で供給される。ＥＣは

、通常は実質的に不揮発性の有機溶剤に溶解した有効成分を含有する均質な液体組成物である。ＳＣは水中における固体有効成分の微粒状分散液である。濃縮液を適用するためには、それらを水に希釈し、通常は処理すべき区域に噴霧器で適用する。農業または園芸用としては、０．０００１－０．１重量％（ほぼｇ／ｈａに相当）の有効成分を含有する水性調製物が特に有用である。

ＥＣに適した液体溶剤には、メチルケトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン、キシレン類、トルエン、クロロベンゼン、パラフィン類、ケロシン、ホワイト油、アルコール類（たとえばブタノール）、メチルナフタリン、トリメチルベンゼン、トリクロロエチレン、Ｎ－メチル－２－ピロリドンおよびテトラヒドロフルフリルアルコール（ＴＨＦＡ）が含まれる。

湿潤剤、分散助剤および乳化剤は、カチオン型、アニオン型または非イオン型のいずれであってもよい。カチオン型の適切な物質には、たとえば第四級アンモニウム化合物、たとえばセチルトリメチルアンモニウムブロミドが含まれる。アニオン型の適切な物質には、たとえば石けん、硫酸の脂肪族モノエステルの塩、たとえばラウリル硫酸ナトリウム、スルホン化芳香族化合物の塩、たとえばドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、リグノスルホン酸ナトリウム、カルシウムもしくはアンモニウム、またはナフタリンスルホン酸ブチル、ならびにナフタリンスルホン酸ジイソプロピルおよび－トリイソプロピルのナトリウム塩混合物が含まれる。非イオン型の適切な物質には、たとえばエチレンオキシドと脂肪アルコール、たとえばオレイルアルコールもしくはセチルアルコールとの、またはアルキルフェノール、たとえばオクチルフェノール、ノニルフェノールおよびオクチルクレゾールとの縮合物が含まれる。他の非イオン性物質は、長鎖脂肪酸と無水ヘキシトールから誘導される部分エステル、この部分エステルとエチレンオキシドの縮合物、およびレシチンである。

これらの濃縮液は、長期間の貯蔵に耐え、かっこの貯蔵後に水で希釈して通常の噴霧装置でそれらを適用するのに十分な期間均質に保持される水性調製物を形成しうることがしばしば要求される。濃縮液は１－８５重量％の有効成分（１種類または２種類以上）を含有しうる。希釈して水性調製物を形成した場合、それらは使用目的に応じて種々の量の有効成分を含有しうる。

式（Ｉ）の化合物は散剤（無水（ｄｒｙ）種子処理剤ＤＳまたは水分散性散剤ＷＳ）、または液剤（流動性濃縮液ＦＳ、液体種子処理剤ＬＳ）、またはマイクロカプセル化懸濁剤ＣＳとして種子処理用に配合することもできる。これらの配合物は標準法により、一般的な種子処理装置で種子に適用することができる。使用に際しては、組成物を線虫に、線虫の存在部位に、線虫の生息環境に、または線虫の侵入を受けやすい、生育中の植物に、殺虫薬組成物適用のための任意の既知の手段で、たとえば顆粒の散布、噴霧または混和により適用する。

本発明化合物は組成物の唯一の有効成分であってもよく、あるいはそれらを１種類または２種類以上の付加的な有効成分、たとえば殺線虫薬、または線虫の挙動を変化させる薬剤、たとえば孵化因子、殺虫薬、相乗作用薬、除草剤、殺真菌薬もしくは植物生長調節薬と適宜混合してもよい。

本発明化合物と混合含有させるのに適した付加的な有効成分は、本発明化合物の活性スペクトルを拡大するか、または害虫の存在部位におけるそれらの持続性を高める化合物であってもよい。それらは本発明化合物の活性を相乗的に高めるか、またはたとえば効果速度の増大もしくは忌避性の克服により活性を補足することができる。さらに、この種類の多成分混合物は個々の成分に対する耐性の発現を克服または阻止するのに役立つであろう。含有される具体的な付加的有効成分は、混合物の意図する用途および要求される補足作用の種類に依存するであろう。適切な殺虫薬の例には以下のものが含まれる：

ａ）ピレトロイド類、たとえばパーメトリン(permethrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、デルタメトリン(deltamethrin)、サイハロトリン(cyhalothrin)、特にラムダサイハロトリン、ビフェントリン(bifenthrin)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、サイフルトリン(cyfluthrin)、テフルトリン(tefluthrin)、魚類に対して安全なピレトロ

イド系化合物、たとえばエトフェンプロックス(ethofenprox)、天然ピレトリン、テトラメトリン、ｓ－バイオアレトリン(bioallethrin)、フェンフルトリン(fenfluthrin)、プラレトリン(prallethrin)および５－ベンジル－３－フリルメチル－（Ｅ）－（１Ｒ，３Ｓ）－２，２－ジメチル－３－（２－オキソチオラン－３－イリデンメチル）シクロプロパンカルボキシレート；
ｂ）有機リン化合物、たとえばプロフェノフォス(profenofos)、スルプロフォス(sulprofos)、メチルパラチオン、アジンフォス－メチル(azinphos-methyl)、デメトン－ｓ－メチル、ヘプテノフォス(heptenophos)、チオメトン(thiometon)、フェナミホス(fenamiphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、トリアゾホス(triazophos)、メタミドホス(methamidophos)、ダイメトエート(dimethoate)、ホスファミドン(phosphamidon)、マラチオン(malathion)、クロロピリフォス(chloropyrifos)、ホサロン、テルビュフォス(terbufos)、フェンスルホチオン(fensulfothion)、フォノフォス(fonofos)、ホレート(phorate)、ホキシム(phoxim)、ピリミホス－メチル(pyrimiphos-methyl)、ピリミホス－エチル、フェニトロチオン(fenitrothion)またはダイアジノン；
ｃ）カルバメート類（アリールカルバメートを含む）、たとえばピリミカーブ(pirimicarb)、クレトカーブ(cloethocarb)、カーボフラン(carbofuran)、フラチオカーブ(furathiocarb)、エチオフェンカーブ(ethiofencarb)、アルディカーブ(aldicarb)、チオフロックス(thiofurox)、カーボスルファン(carbosulfan)、ベンジオカーブ(bendiocarb)、フェノブカーブ(fenobucarb)、プロポクスル(propoxur)またはオキサミル；
ｄ）ベンゾイル尿素、たとえばトリフルムロン(triflumuron)またはクロロフルアズロン(chlorofluazuron)；
ｅ）有機スズ化合物、たとえばサイヘキサチン(cyhexatin)、フェンブタチンオキシド、アゾサイクロチン(azocyclotin)；
ｆ）マクロライド類、たとえばアベルメクチン類またはミルベマイシン類、たとえばアバメクチン(abamectin)、イベルメクチン(ivermectin)およびミルベマイシン(milbemycin)；
ｇ）ホルモン類、たとえばフェロモン類；
ｈ）有機塩素化合物、たとえば六塩化ベンゼン、ＤＤＴ、エンドスルファン、クロルダンまたはジエルドリン；
ｉ）アミジン類、たとえばクロルジメフォルム(chlordimeform)またはアミトラツ(amitraz)；
ｊ）燻煙剤；
ｋ）ニトロメチレン類、たとえばイミダクロプリド(imidacloprid)。
前記の主要な化合物群の殺虫薬のほかに、混合物の目的用途に適切である場合には、特定の標的をもつ他の殺虫薬を混合物中に使用しうる。たとえば特定の作物に対して選択的な殺虫薬、たとえばイネに使用するための穿孔虫（ｓｔｅｍｂｏｒｅｒ）特異性殺虫薬、たとえばカルタップ(cartap)またはブプロフェジン(buprofezin)を使用しうる。あるいは特定の昆虫種／期に特異的な殺虫薬、たとえば卵－幼虫駆除薬、たとえばクロフェンテジン(clofentezine)、フルベンズイミン(flubenzimine)、ベキシチアゾックス(hexythiazox)およびテトラジフォン(tetradifon)、モーチリサイド(motilicide)、たとえばダイコフォル(dicofol)またはプロパルギット、一般的殺ダニ薬、たとえばブロモプロピレート、クロロベンジレート、または生長調節薬、たとえばヒドラメチルノン(hydramethylnon)、サイロマジン(cyromazine)、メトプレン(methoprene)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)およびジフルベンズロン(diflubenzuron)が組成物に含有されてもよい。
組成物中に使用するのに適した相乗作用薬の例には、ピペロニルブトキシド、セサマックス(sesamax)、サフロキサン(safroxan)およびドデシルイミダゾールが含まれる。
組成物に含有させるのに適した除草剤、殺真菌薬および植物生長調節薬は、目標とする標的および要求される効果に依存するであろう。
含有させうる、イネの選択的除草剤の例はプロパニルであり、ワタに使用するための植物生長調節薬の例は“ピックス(Pix)”であり、イネに使用するための殺真菌薬の例には、

ブラスチサイド類、たとえばブラスチサイジン－Ｓが含まれる。組成物中の本発明化合物と他の有効成分の比率は多数の因子に依存し、これには標的の種類、混合物から得ることが要求される効果などが含まれる。しかし一般に組成物の付加的な有効成分はそれが通常使用される割合で、または相乗作用が起こる場合にはそれよりわずかに低い量で用いられる。

実施例１

本発明による式（Ｉ）の化合物の活性を、種々の害虫を用いて測定した。別途記載しない限り５００ｐｐｍ（重量）の化合物を液体組成物を用いて害虫を処理した。組成物は、化合物をアセトン：エタノール（５０：５０）混合物に溶解し、これらの溶液を商品名“シンペロニック（Ｓｙｎｐｅｒｏｎｉｃ）”ＮＰ８で販売される湿潤剤０．０５重量％を含有する水で、液体組成物が必要な濃度の化合物を含有するまで希釈することにより調製された。“シンペロニック”は登録商標である。

各害虫に関して適用した試験法は基本的には同じであり、多数の害虫を培地、すなわち通常の宿主植物またはそれらの害虫が食用とする食物上で飼育し、そして培地および害虫のいずれかまたは両方を組成物で処理することよりなっていた。次いで害虫の致死率を通常は処理後に１－３日の期間で評価した。

試験の結果を各化合物につき表Ａに提示する。これらの結果はＡ、ＢまたはＣと表示した致死率の等級を示し、その際Ａは４０％未満の致死率、Ｂは４０－７９％の致死率、Ｃは８０－１００％の致死率を示し；－はその化合物を試験しなかったか、または有意の結果が得られなかったことを示す。

害虫の種、飼育培地または食物、ならびに試験の種類および期間に関する情報を表Ｂに示す。害虫の種は文字コードで表示する。

表　A

化合物	種（表Ｂ参照）					
No.	TU	MPa	MD	HV	SE	DB
II.1	B	A	A	A	A	-
II.2	C	C	A	A	A	-
II.3	A	A	A	A	A	-
II.4	A	A	A	A	A	-
II.5	A	C	A	A	A	-
II.6	C	A	A	A	A	-
II.7	A	A	A	B	A	-
II.8	C	C	A	C	B	-
II.9	B	C	A	A	A	-
III.1	A	C	A	A	A	B
III.2	C	C	A	C	A	-

III.3	A	C	A	A	A	-
III.4	A	A	A	A	A	-
III.5	A	A	A	A	A	-
III.6	A	A	A	C	A	-
III.7	A	A	A	B	A	-
III.8	A	A	A	A	A	-
III.9	B	C	A	A	A	-
III.10	A	C	A	B	A	-
III.11	A	A	A	A	A	-
III.12	B	A	A	A	A	-
IV.1	C	C	A	C	B	C
IV.2	C	C	A	C	B	C
IV.3	C	C	A	B	A	B
IV.7	C	C	A	C	A	-
IV.8	C	C	A	C	A	-
IV.9	C	C	A	C	A	-
IV.10	C	C	-	B	A	-
IV.23	C	C	A	C	B	-
IV.24	C	C	A	A	A	-
IV.26	C	C	A	A	A	-
V.2	C	C	A	C	C	-
V.12	C	C	A	C	A	-
V.15	C	C	A	A	A	-
VI.1	A	C	A	A	A	-
VI.4	A	A	A	A	A	-
VI.5	C	C	A	A	A	-
VI.6	C	A	A	A	A	-
VI.13	B	C	-	A	A	-
VI.14	C	C	-	A	A	-
VI.15	A	C	-	A	A	-
VI.16	C	C	-	B	A	-
VI.18	C	C	A	B	A	C
VI.19	C	C	B	B	A	A

VI.20	C	C	A	A	A	C
VI.25	C	C	A	B	A	-
VI.31	C	C	A	A	A	-
VI.32	C	C	A	A	A	-
VI.36	C	A	A	A	A	-
VI.37	C	C	A	A	A	-
VI.38	C	C	A	A	A	-
VI.40	C	C	A	C	A	-
VII.1	C	C	B	A	A	B
VII.2	C	C	A	C	B	-
VII.3	C	A	A	B	A	-
VII.4	A	B	A	A	A	-
VII.6	C	C	A	B	A	-
VII.7	C	C	A	C	A	-
VII.8	C	C	A	A	A	-
VII.9	C	C	A	B	A	-
VII.10	C	B	A	B	A	-
VII.11	C	C	A	B	A	-
VII.13	C	C	A	B	A	-
VII.14	C	C	A	A	A	-
VII.15	C	C	A	B	A	-
VII.16	C	C	A	A	A	-
VII.17	C	C	A	A	A	C
VII.21	B	C	A	A	A	-
VII.23	A	B	A	A	A	-
VII.24	A	C	A	A	A	-
VII.25	C	C	A	C	A	-
VII.26	C	C	A	B	A	-
VII.27	C	C	-	A	A	-
VII.28	C	C	-	A	A	-
VII.32	C	C	A	C	A	-
VII.36	C	C	A	B	A	-
VII.41	C	C	A	C	A	-

VII.43	C	C	A	B	A	-
VII.45	C	C	A	C	A	-
VII.47	C	C	A	C	A	-
VII.52	C	C	A	A	B	-
VII.53	C	C	A	A	A	-
VII.56	C	C	A	C	A	-
VII.82	C	C	A	B	A	-
VII.83	A	C	-	C	A	-
VII.84	A	C	-	A	A	-
VII.90	C	C	A	B	A	-
VII.94	C	C	A	C	A	-
VII.98	C	C	A	C	A	-
VII.102	A	A	A	A	A	-
VII.114	C	A	A	A	A	-
VII.115	A	C	A	A	A	-
VII.116	B	A	A	A	A	-
VII.128	C	C	A	A	A	-
VII.130	C	C	-	A	A	-
VII.134	A	A	A	C	A	A
VIII.1	C	C	A	B	A	-
VIII.2	A	C	A	A	A	-
VIII.3	C	C	A	B	A	-
VIII.4	A	A	A	A	C	-
VIII.5	C	C	A	C	A	C
VIII.7	C	C	A	A	A	-
VIII.8	C	A	A	A	A	-
VIII.9	A	A	A	A	A	-
VIII.10	C	C	A	A	A	-
VIII.11	C	C	A	B	A	-
VIII.12	C	C	A	B	A	-
VIII.13	A	C	A	A	A	-
VIII.14	C	C	A	A	A	-
VIII.15	C	B	A	A	A	-

VIII.18	C	C	A	A	A	-
VIII.19	C	C	A	A	A	-
VIII.20	C	C	A	A	A	-
VIII.21	A	A	A	A	A	-
VIII.22	C	C	A	A	A	-
VIII.23	C	C	A	A	C	-
VIII.24	C	C	A	A	B	-
VIII.27	C	C	A	B	A	-
VIII.28	A	C	A	A	A	-
VIII.29	C	C	A	C	A	-
VIII.30	A	C	A	A	A	-
VIII.31	C	C	A	A	A	-
VIII.32	B	C	A	A	A	-
VIII.33	C	C	A	A	A	-
VIII.34	B	B	A	A	A	-
VIII.36	C	C	A	A	A	-
VIII.52	A	C	-	A	A	-
VIII.53	A	C	A	A	A	-
VIII.58	C	C	A	C	A	-
VIII.59	C	C	A	A	A	-
VIII.61	C	C	A	A	A	-
VIII.63	A	A	A	A	C	-
VIII.64	C	C	A	A	A	-
VIII.65	A	B	-	A	A	-
VIII.66	A	A	A	A	A	-
VIII.67	A	A	A	A	A	-
VIII.68	C	C	A	A	A	-
VIII.151	C	C	A	B	A	-
VIII.152	C	C	-	A	A	-
IX.31	C	C	A	A	A	-
IX.33	A	A	A	A	A	-
IX.34	B	C	A	A	A	-
IX.36	A	C	A	A	A	-

IX.37	C	C	A	A	B	-
IX.40	A	A	A	A	A	-
IX.42	A	A	A	A	A	-
IX.55	C	A	A	A	A	-
IX.61	A	C	A	A	A	-
IX.73	C	C	A	A	C	-
IX.75	C	C	A	A	A	-
IX.82	C	C	A	C	B	-
IX.84	C	A	A	C	A	-
IX.124	C	A	A	A	A	-
IX.126	A	A	A	A	A	-
X.3	C	C	A	C	C	-
X.26	C	C	A	C	A	-
X.32	C	A	A	A	A	-
XI.5	C	C	A	C	C	C
XI.9	A	A	A	A	A	-
XI.11	C	C	A	C	A	-
XI.23	C	C	A	C	A	-
XI.24	A	C	A	A	A	-
XI.25	C	C	A	B	A	-
XI.30	A	C	A	A	A	-
XI.31	A	C	A	A	A	-
XI.34	C	C	A	B	A	-
XI.35	C	C	A	C	A	-
XI.36	C	C	A	C	A	-
XI.38	C	C	A	C	A	-
XI.40	C	C	A	A	A	C
XI.87	C	C	A	C	A	-
XI.102	B	C	A	A	A	-
XI.108	B	C	A	B	A	-
XI.109	C	A	A	C	B	-
XI.110	C	C	A	B	A	-
XI.125	C	C	A	C	A	-

XI.127	C	C	A	B	B	B
XII.1	C	C	A	C	B	-
XII.3	C	C	A	C	C	B
XII.4	C	C	A	B	A	C
XII.5	C	C	A	A	A	B
XII.8	C	C	A	A	A	-
XII.9	A	B	A	B	A	-
XII.11	C	C	A	B	A	-
XII.12	C	C	A	B	A	-
XII.13	C	C	A	B	A	-
XII.14	C	C	A	C	A	-
XII.15	C	C	A	A	A	-
XII.19	C	C	A	A	B	-
XII.23	C	C	A	C	A	-
XII.25	C	C	A	C	A	-
XII.26	C	C	A	B	A	-
XII.27	C	C	A	A	A	-
XII.28	C	C	A	C	A	-
XII.29	C	C	A	C	A	-
XII.30	C	C	A	B	A	-
XII.31	C	C	A	A	A	-
XII.32	C	C	A	C	A	-
XII.33	C	C	A	C	A	-
XII.35	C	C	A	A	A	-
XII.49	C	C	A	C	A	-
XII.51	C	C	A	C	A	-
XII.54	C	C	A	C	A	-
XII.55	C	A	A	C	A	-
XII.68	C	A	A	A	A	-
XII.128	C	C	A	B	C	-
XII.129	C	C	A	C	A	-
XII.130	B	C	A	A	A	-
XII.131	C	C	A	C	A	-

XII.132	C	C	A	B	C	-
XII.133	C	C	A	A	A	-
XII.134	C	C	A	C	B	-
XII.142	C	C	A	C	A	-
XII.143	C	B	A	A	A	-
XII.144	C	C	A	B	A	-
XII.145	C	C	A	C	A	-
XII.146	B	C	A	A	A	-
XII.147	C	C	A	A	A	-
XII.148	C	C	A	C	A	-
XIII.1	C	A	A	B	A	-
XIII.2	C	C	A	C	A	-
XIII.3	C	C	A	B	A	-
XIII.4	C	C	A	A	A	-
XIII.6	C	A	A	C	A	-
XIII.7	C	C	A	C	A	-
XIII.9	C	C	A	C	A	-
XIII.10	C	C	A	B	A	-
XIII.11	C	C	A	A	A	-
XIII.14	A	A	A	A	A	-
XIII.15	C	C	A	A	A	-
XIII.16	C	A	A	B	A	-
XIII.17	C	C	A	C	A	-
XIII.18	C	C	A	B	A	-
XIII.20	C	C	A	B	A	-
XIII.24	C	C	A	B	A	-
XIII.27	C	A	A	C	A	-
XIII.28	C	C	A	B	A	-
XIII.29	C	C	A	B	A	-
XIII.40	C	C	A	C	A	B
XIII.41	C	C	A	C	A	-
XIII.42	C	C	A	C	A	-
XIII.45	C	C	A	A	A	-

XIII.63	A	A	A	A	A	B
XIII.64	C	C	A	C	A	-
XIII.65	C	C	A	C	A	-
XIII.66	C	C	A	B	A	-
XIII.69	C	B	A	B	A	-
XIII.70	A	C	A	B	A	A
XIII.101	C	C	A	A	A	-
XIII.110	C	C	A	C	A	C
XIII.114	C	C	A	C	A	-
XIII.115	C	C	A	C	A	-
XIII.116	A	C	A	C	A	-
XIII.117	C	C	B	A	B	B
XIII.119	B	C	C	C	A	C
XIII.122	C	C	A	A	A	-
XIII.124	C	C	B	B	A	B
XIII.133	C	C	A	C	A	C
XIII.134	C	C	A	B	A	B
XIII.143	C	A	A	C	A	-
XIV.1	C	C	A	C	A	C
XV.1	C	C	A	C	C	C
XVI.1	A	C	A	C	B	-
XVI.2	A	A	A	A	A	-
XVI.3	C	A	A	C	A	-
XVI.5	C	C	A	C	B	-
XVI.6	C	C	A	C	A	-
XVI.7	A	A	A	A	A	-
XVI.8	C	C	A	C	A	-
XVI.9	C	B	A	A	A	-
XVI.10	C	C	A	C	B	C
XVI.11	A	B	A	A	A	A
XVI.12	C	C	A	A	C	-
XVI.13	A	A	A	A	A	-
XVI.14	A	A	A	A	A	-

XVI.15	B	C	A	A	A	-
XVI.16	C	C	A	A	A	-
XVI.17	C	C	A	A	A	-
XVI.18	C	C	A	A	A	-
XVI.19	C	A	A	A	A	B
XVI.20	A	A	A	A	A	-
XVI.21	C	C	A	C	A	-
XVI.22	C	A	A	B	A	-
XVI.23	A	A	A	B	A	-
XVI.24	C	C	A	B	A	-
XVII.1	C	C	A	A	A	C
XVII.2	C	C	A	A	A	C
XVII.3	B	B	C	C	C	C
XVII.4	C	C	A	A	A	B
XVII.5	C	C	A	A	A	B
XVII.6	A	A	A	A	A	A
XVII.7	C	C	A	A	A	C
XVIII.1	C	C	A	C	A	C
XVIII.3	A	C	B	A	A	C
XVIII.4	C	C	A	A	C	C
XVIII.7	A	A	A	A	A	C
XVIII.10	C	C	A	B	A	-
XVIII.13	C	C	A	C	C	-
XVIII.14	C	C	A	A	A	-
XVIII.15	C	C	A	B	A	-
XVIII.16	C	C	A	B	B	-
XIX.1	C	C	B	C	A	C
XX.4	C	B	A	C	A	C
XX.15	C	A	A	A	A	-
XX.27	C	C	A	B	A	-
XX.28	C	C	A	A	B	-
XX.30	C	C	A	A	A	-
XX.52	C	C	A	B	A	-

XX.53	C	C	A	C	A	-
XX.54	C	C	A	B	A	-
XX.65	C	C	A	A	A	-
XX.98	C	C	A	A	A	-
XX.109	C	C	A	C	A	-
XX.110	C	C	A	A	A	-
XX.116	C	C	A	B	A	-
XX.117	C	C	A	C	A	-
XX.118	C	C	A	C	A	-
XX.137	C	C	A	B	A	-
XX.205	C	C	A	C	A	-
XX.218	C	C	A	C	A	-
XX.221	C	C	A	C	A	-
XX.226	C	A	A	C	C	-
XX.227	C	C	B	A	A	A
XX.231	C	C	A	C	A	-
XX.247	C	C	A	C	A	-
XX.251	C	C	A	A	A	B
XXI.1	C	C	B	A	A	A

表 B

コード文字	被験種	飼育 培地／食物	試験の種類	期間（日）
ＴＵ	Tetranychus urticae（ハダニ）	サヤインゲンの葉	接触	3
ＭＰａ	Myzus persicae（ミドリモモアカアブラムシ）	チャイニーズキャベツの葉	接触	3
ＭＤ	Musca domestica（イエバエ-成体）	原綿/砂糖	接触	2
ＨＶ	Heliothis virescens（タバコバッドワーム-幼虫）	ダイズの葉	残留	5
ＳＥ	Spodoptera exigua（レッサーアワヨトウ-幼虫）	ワタの葉	残留	5
ＤＢ	Diabrotica balteata（シマウリハムシ-幼虫）	濾紙/トウモロコシ種子	残留	2

“接触”試験は害虫と培地の両方を処理したことを示し、“残留”は害虫の侵入前に培地を処理したことを示す。

実施例２

この実施例はさらに、本発明による式（Ｉ）の化合物の殺虫活性を示す。

表Ｃに、４種に対する種々の適用率における被験化合物の活性につき、さらに結果を示す。試験ＴＵ（Ｔｅｔｒａｎｙｃｈｕｓ ｕｒｔｉｃａｅ、接触）、ＭＰａ（Ｍｙｚｕｓ ｐｅｒｓｉｃａｅ、接触）およびＤＢ（Ｄｉａｂｒｏｔｉｃａ ｂａｌｔｅａｔａ、接触）についての試験法および詳細は実施例１および表Ｂに示したとおりである。適用率は各試験タイプにつき表の冒頭に示す。試験ＭＰｂ（Ｍｙｚｕｓ ｐｅｒｓｉｃａｅ、全身）についての試験法は以下のとおりである：

バレイショモモアカアブラムシＭｙｚｕｓ ｐｅｒｓｉｃａｅに対する被験化合物の上行全身性（ｕｐｗａｒｄ ｓｙｓｔｅｍｉｃｉｔｙ）を、２－３週令のハツカダイコン（栽培変種チェリーベレ（Ｃｈｅｒｒｙｂｅｌｌｅ））に１０ｐｐｍまたは２．５ｐｐｍで土壌ドレンチングにより評価した。約２×１ｃｍの最初の本葉を付けた植物を使用した。子葉、生長点および本葉１枚を取り除いた。土壌を透明な覆いでカバーした。12－18匹の成長アブラムシを処理の１日前に各植物に付与した。アブラムシが逃げるのを防止するために、処理した日にそれぞれのポットをフルオンバンド付きの２５０ｃｍ^{3}のプラスチックポットに入れた。各ポットを１０ｃｍ^{3}の水溶液中の化合物（１％エタノールおよびアセトン（１：１）ならびに０．０１％シンペロニックＮＰ８（ＩＣＩケミカルズ・アンド・ポリマーズ）中に調製）で処理した。各処理を３回反復した。処理した植物を２０℃、相対湿度６０％および日照時間１６時間の一定の環境室に移した。処理後３および５日目に致死率を評価した。

ネコブセンチュウ（Ｍｅｌｏｉｄｏｇｙｎｅ ｉｎｃｏｇｎｉｔａ（ＭＩ））に対する活性は、候補の殺線虫薬をドレンチ液として２週令のキウリ植物（栽培変種テレグラフ（Ｔ

ｅｌｅｇｒａｐｈ））に適用し、土壌に線虫を侵入させることにより評価された。１０ｃｍ^{3}の被験化合物水溶液（１％エタノールおよびアセトン（１：１）ならびに０．０５％シンペロニックＮＰ８（ＩＣＩケミカルズ・アンド・ポリマーズ）中に調製）を、最終土壌濃度が２ｐｐｍとなるように各植物に付与した。各処理を２回反復した。キウリ植物に処理の４８時間後に、孵化したばかりの幼虫の懸濁液（線虫３５０匹／ｃｍ^{3}の濃度）２ｃｍ^{3}を接種した。２５℃で日照時間１６時間において９日間、試験を継続した。非処理、侵入対照と比較した各植物の根のネコブセンチュウ病の低下率につき評価し、結果を表Ｃに対照と比較したネコブセンチュウ病の低下率として記録する。

表ＣのＭＩ以外の４種についての結果は、観察した対照に対する％として表示される。ダッシュはその化合物を試験しなかったか、または有意の結果が得られなかったことを示す。

表C

化合物 No.	TU 100 ppm	MPa 100 ppm	MPa 27 ppm	MPb 10ppm	MPb 2.5ppm	DB 25 ppm	MI 2ppm
II.1	-	-	-	-	1	-	95
II.2	88	-	-	-	100	-	100
II.3	-	-	-	-	-	-	0
II.4	-	-	-	-	4	-	96
II.5	-	-	-	-	-	-	96
II.6	39	-	-	-	-	-	88
II.7	-	-	-	-	4	-	98
II.8	74	-	24	-	100	-	97
II.9	-	-	58	-	100	-	98
III.1	-	-	5	-	-	-	98
III.2	60	-	58	-	97	-	93
III.3	-	-	8	-	41	-	83
III.4	-	-	-	-	-	-	0
III.5	-	-	-	-	-	-	30
III.6	-	-	-	-	-	-	47
III.7	-	-	-	-	-	-	48
III.8	-	-	-	-	-	-	0
III.9	-	7	-	-	-	-	88
III.10	-	8	-	-	-	-	51
III.11	-	-	-	-	-	-	0
III.12	-	-	-	-	-	-	0
IV.1	100	-	66	92	-	80	0
IV.2	94	-	82	84	-	17	0
IV.3	60	-	8	100	-	-	96
IV.7	100	100	-	-	100	-	100
IV.8	92	-	81	-	23	-	0
IV.9	93	-	81	-	50	-	0
IV.10	-	-	-	-	-	-	11
IV.23	-	-	-	97	-	-	99
IV.24	-	-	-	-	-	-	88

V.2	100	-	84	-	55	-	0
V.6	-	-	-	-	-	-	72
V.12	100	-	100	-	10	-	0
V.15	49	-	50	-	100	-	92
VI.1	-	-	2	-	-	-	99
VI.4	-	-	-	-	5	-	98
VI.5	84	95	-	-	100	-	100
VI.6	-	-	-	97	-	-	77
VI.13	-	-	-	-	-	-	22
VI.14	-	-	-	-	-	-	0
VI.15	-	-	-	-	-	-	72
VI.16	-	-	-	-	-	-	55
VI.18	73	-	65	60	-	100	95
VI.19	74	-	100	99	-	-	100
VI.20	97	-	100	95	97	53	98
VI.25	77	-	15	-	46	-	88
VI.32	28	-	12	-	28	-	100
VI.36	-	-	-	79	-	-	17
VI.37	93	-	100	-	86	-	97
VI.40	92	-	98	-	100	-	92
VII.1	38	-	0	-	51	-	99
VII.2	36	-	39	-	100	-	99
VII.3	45	-	-	-	-	-	0
VII.4	-	-	7	-	-	-	0
VII.6	100	-	98	-	65	-	95
VII.7	99	-	100	-	45	-	98
VII.8	46	-	16	-	4	-	86
VII.9	90	6	-	-	-	-	0
VII.10	37	7	-	-	-	-	0
VII.12	-	-	-	96	-	-	0
VII.14	-	-	-	-	-	-	91
VII.15	-	-	-	-	-	-	100
VII.16	88	100	-	-	96	-	100

VII.17	90	-	9	-	-	60	0
VII.22	-	-	-	-	-	-	76
VII.23	-	-	-	-	-	-	68
VII.24	-	-	17	-	50	-	98
VII.25	-	-	-	-	98	-	99
VII.26	95	-	30	-	96	-	100
VII.27	-	-	-	-	-	-	83
VII.28	-	-	-	-	-	-	66
VII.32	99	-	79	-	49	-	97
VII.36	100	-	100	-	90	-	92
VII.41	100	-	100	-	49	-	96
VII.43	85	100	-	-	-	-	86
VII.45	100	99	-	-	-	-	95
VII.47	-	-	-	-	-	-	94
VII.52	-	-	-	41	-	-	94
VII.53	-	-	-	67	-	-	99
VII.56	-	-	-	56	-	-	-
VII.83	-	-	-	-	-	-	66
VII.84	-	-	-	-	-	-	0
VII.90	97	-	92	-	93	-	95
VII.94	72	-	5	-	-	-	0
VII.98	56	-	11	-	-	-	0
VII.102	-	-	-	-	-	-	0
VII.114	-	-	-	28	-	-	50
VII.115	-	-	-	-	-	-	50
VII.116	-	-	-	-	-	-	33
VII.128	-	-	-	44	-	-	66
VII.130	-	-	-	-	-	-	28
VII.134	-	-	-	-	-	-	100
VIII.1	100	100	-	-	100	-	98
VIII.2	-	93	-	-	98	-	99
VIII.3	-	-	-	-	-	-	88
VIII.4	-	-	-	18	-	-	39

VIII.5	45	-	26	-	96	87	98
VIII.7	43	90	-	-	90	-	100
VIII.8	-	-	-	-	-	-	59
VIII.9	-	-	-	-	-	-	65
VIII.10	-	-	-	42	-	-	39
VIII.12	-	-	-	-	-	-	48
VIII.13	-	4	-	-	-	-	86
VIII.14	-	-	-	-	-	-	90
VIII.15	-	-	-	-	-	-	97
VIII.18	97	100	-	-	-	-	94
VIII.19	-	-	-	-	-	-	66
VIII.20	-	-	-	4	-	-	0
VIII.21	-	-	-	-	-	-	0
VIII.22	-	-	-	-	-	-	72
VIII.23	-	-	-	76	-	-	44
VIII.24	-	-	-	0	-	-	50
VIII.27	-	-	-	0	-	-	0
VIII.29	-	-	-	-	-	-	11
VIII.30	-	-	-	29	-	-	44
VIII.31	-	-	-	-	-	-	49
VIII.32	-	-	-	-	-	-	99
VIII.33	-	-	-	-	-	-	0
VIII.34	-	-	-	-	-	-	22
VIII.36	-	-	-	-	-	-	66
VIII.52	-	-	-	-	-	-	22
VIII.59	-	-	-	-	-	-	65
VIII.61	-	-	-	-	-	-	66
VIII.63	-	-	-	-	-	-	99
VIII.64	-	-	-	29	-	-	0
VIII.65	-	-	-	48	-	-	72
VIII.66	-	-	-	16	-	-	-
VIII.67	-	-	-	-	-	-	0
VIII.151	100	100	-	-	30	-	99

VIII.152	-	-	-	-	-	-	33
IX.33	-	-	-	0	-	-	44
IX.34	-	-	-	0	-	-	94
IX.36	-	-	-	2	-	-	0
IX.37	-	-	-	-	-	-	61
IX.40	-	-	-	30	-	-	50
IX.42	-	-	-	9	-	-	72
IX.55	-	-	-	-	-	-	83
IX.61	-	-	-	86	-	-	61
IX.73	-	-	-	100	-	-	72
IX.75	-	-	-	-	-	-	99
IX.82	91	100	-	-	-	-	3
IX.84	97	-	-	-	100	-	97
IX.124	-	-	-	-	-	-	65
IX.126	-	-	-	-	-	-	94
IX.127	-	-	-	-	-	-	50
X.3	100	-	100	52	-	-	94
X.26	-	-	-	82	-	-	88
X.32	54	-	-	-	-	-	96
XI.5	100	-	100	30	-	13	100
XI.9	-	-	-	-	26	-	99
XI.11	84	100	-	-	100	-	95
XI.23	40	14	-	-	48	-	98
XI.24	-	-	-	-	95	-	86
XI.25	41	100	-	-	-	-	97
XI.30	-	81	-	-	-	-	4
XI.31	-	29	-	-	-	-	14
XI.34	100	100	-	-	99	-	100
XI.35	97	100	-	-	98	-	98
XI.36	100	100	-	-	100	-	92
XI.38	100	100	-	-	52	-	93
XI.40	36	-	100	100	95	77	100
XI.87	82	100	-	-	92	-	100

XI.102	-	-	2	-	-	-	0
XI.108	-	100	-	-	93	-	92
XI.109	100	-	-	-	35	-	93
XI.110	70	-	96	-	59	-	90
XI.125	100	100	-	-	80	-	97
XI.127	100	-	100	26	-	-	0
XII.1	86	-	9	-	100	-	95
XII.3	100	-	46	9	65	-	88
XII.4	100	-	93	49	-	67	98
XII.5	37	-	0	72	-	-	89
XII.8	59	-	4	-	100	-	96
XII.9	-	42	-	-	-	-	68
XII.11	81	100	-	-	50	-	100
XII.12	73	100	-	-	-	-	97
XII.13	43	20	-	-	-	-	76
XII.14	93	100	-	-	95	-	93
XII.15	47	11	-	-	-	-	94
XII.19	50	30	-	-	-	-	69
XII.23	95	100	-	-	97	-	97
XII.25	100	100	-	-	56	-	99
XII.26	73	100	-	-	77	-	99
XII.27	-	98	-	-	-	-	-
XII.28	100	100	-	-	-	-	84
XII.29	-	100	-	-	100	-	99
XII.30	15	100	-	-	-	-	94
XII.31	73	-	22	-	100	-	95
XII.32	100	100	-	-	98	-	99
XII.33	45	37	-	-	-	-	-
XII.35	100	87	-	-	95	-	98
XII.49	38	-	18	-	97	-	95
XII.51	40	8	-	-	51	-	91
XII.54	100	80	-	-	100	-	98
XII.55	96	-	-	-	100	-	90

XII.68	53	-	-	-	-	-	0
XII.128	100	100	-	-	26	-	61
XII.129	100	100	-	-	86	-	89
XII.130	-	77	-	-	5	-	87
XII.131	87	-	26	-	54	-	86
XII.132	98	100	-	-	-	-	31
XII.133	99	-	85	-	6	-	0
XII.134	75	-	88	-	97	-	0
XII.142	54	100	-	-	92	-	95
XII.143	48	39	-	-	65	-	94
XII.144	100	100	-	-	-	-	53
XII.145	-	100	-	-	32	-	97
XII.146	-	45	-	-	-	-	69
XII.147	39	56	-	-	-	-	37
XII.148	97	97	-	-	-	-	84
XIII.1	35	-	-	-	-	-	89
XIII.2	95	100	-	-	100	-	98
XIII.3	79	84	-	-	88	-	99
XIII.4	100	100	-	-	100	-	96
XIII.6	79	-	-	-	96	-	100
XIII.7	88	100	-	-	100	-	99
XIII.9	91	-	100	-	18	-	93
XIII.10	94	-	100	-	32	-	96
XIII.11	94	-	83	-	96	-	92
XIII.14	-	-	-	-	7	-	95
XIII.15	43	77	-	-	-	-	94
XIII.16	89	-	-	-	89	-	96
XIII.17	74	100	-	-	100	-	97
XIII.18	85	100	-	-	96	-	99
XIII.20	94	-	90	-	48	-	0
XIII.24	89	100	-	-	45	-	100
XIII.27	69	-	-	-	77	-	99
XIII.28	100	100	-	-	100	-	96

XIII.29	95	100	-	-	100	-	97
XIII.40	100	-	5	100	100	-	100
XIII.41	100	-	95	-	100	-	96
XIII.42	98	-	35	-	100	-	95
XIII.45	81	-	44	-	91	-	97
XIII.63	-	-	-	98	-	-	100
XIII.64	85	-	97	-	98	-	97
XIII.65	73	-	42	-	100	-	98
XIII.66	100	93	-	-	-	-	31
XIII.69	84	18	-	-	-	-	63
XIII.70	-	-	22	-	-	-	0
XIII.101	79	98	-	-	99	-	100
XIII.110	100	-	64	27	-	79	94
XIII.114	96	100	-	-	18	-	97
XIII.115	97	100	-	-	45	-	91
XIII.116	-	100	-	-	19	-	100
XIII.117	100	-	100	77	-	-	100
XIII.119	-	-	13	29	82	53	91
XIII.122	95	100	-	-	35	-	100
XIII.124	78	-	12	-	-	-	0
XIII.133	100	-	100	100	-	50	100
XIII.134	97	-	100	100	-	-	100
XIII.143	-	-	-	-	-	-	41
XIV.1	45	-	15	100	-	33	0
XV.1	82	-	18	80	-	70	91
XVI.1	-	34	-	-	-	-	50
XVI.2	-	-	-	-	7	-	82
XVI.3	59	-	-	-	97	-	94
XVI.5	56	-	39	-	62	-	100
XVI.6	88	97	-	-	96	-	100
XVI.7	-	-	-	-	-	-	0
XVI.8	42	100	-	-	-	-	89
XVI.9	68	29	-	-	-	-	12

XVI.10	100	-	65	100	-	53	100
XVI.11	-	-	2	-	-	-	0
XVI.12	20	18	-	-	-	-	81
XVI.13	-	-	-	-	-	-	32
XVI.14	-	-	-	-	-	-	0
XVI.15	-	-	53	-	48	-	94
XVI.16	100	100	-	-	-	-	94
XVI.17	46	45	-	-	-	-	24
XVI.18	25	48	-	-	-	-	43
XVI.19	26	-	-	-	-	-	0
XVI.20	-	-	-	-	-	-	42
XVI.21	82	-	100	-	8	-	100
XVI.22	44	-	-	-	-	-	41
XVI.23	-	-	-	-	-	-	38
XVI.24	81	100	-	-	85	-	97
XVII.1	30	-	7	74	-	50	0
XVII.2	24	-	1	-	-	27	0
XVII.3	-	-	0	-	-	87	0
XVII.4	11	-	0	-	-	-	0
XVII.5	32	-	7	-	-	-	0
XVII.6	-	-	-	-	-	-	0
XVII.7	49	-	7	-	-	30	0
XVIII.1	95	-	100	35	-	80	92
XVIII.3	-	-	45	100	-	23	98
XVIII.4	96	-	100	15	-	93	94
XVIII.7	-	-	-	-	-	83	0
XVIII.10	49	-	65	-	29	-	100
XVIII.13	100	-	74	-	53	-	0
XVIII.14	56	-	7	-	-	-	0
XVIII.15	62	-	38	-	89	-	100
XVIII.16	55	-	5	-	94	-	100
XIX.1	100	-	15	30	-	100	82
XX.4	91	-	71	8	-	97	0

XX.15	100	-	-	-	94	-	100
XX.27	69	96	-	-	91	-	100
XX.28	31	85	-	-	-	-	73
XX.30	69	100	-	-	91	-	99
XX.52	63	-	100	-	93	-	96
XX.53	97	100	-	-	92	-	100
XX.54	43	3	-	-	-	-	61
XX.65	52	34	-	-	-	-	47
XX.98	85	-	-	-	95	-	100
XX.109	50	100	-	-	100	-	99
XX.110	77	100	-	-	95	-	99
XX.116	68	-	71	-	98	-	96
XX.117	100	98	-	-	96	-	100
XX.118	34	7	-	-	-	-	21
XX.137	47	-	100	-	94	-	95
XX.205	79	100	-	-	-	-	94
XX.218	81	100	-	-	-	-	97
XX.221	42	-	79	-	92	-	99
XX.226	94	-	-	-	100	-	97
XX.227	86	-	51	100	-	-	100
XX.231	88	-	100	-	52	-	100
XX.247	90	100	-	-	100	-	94
XX.251	18	-	79	26	-	-	0
XXI.1	28	-	0	-	-	-	0

実施例３

本発明化合物の殺線虫活性のスペクトルを、土壌および宿主植物の存在下での接触アッセイにより調べた。最大活性はＭｅｌｏｉｄｏｇｙｎｅ ｉｎｃｏｇｎｉｔａ、Ｇｌｏｂｏｄｅｒａ ｒｏｓｔｏｃｈｉｅｎｓｉｓ、Ｐｒａｔｙｌｅｎｃｈｕｓ ｂｒａｃｈｙｕｒｕｓ、Ｔｙｌｅｎｃｈｏｒｈｙｎｃｈｕｓ ｃｌａｙｔｏｎｉ、Ｈｏｐｌｏｌａｉｍｕｓ ｃｏｌｕｍｂｕｓおよびＲａｄｏｐｈｏｌｕｓ ｓｉｍｉｌｉｓに対して見られた。適度の活性はＲｏｔｙｌｅｎｃｈｕｌｕｓ ｒｅｎｉｆｏｒｍｉｓおよびＢｅｌｏｎｏｌａｉｍｕｓ ｌｏｎｇｉｃａｕｄａｔｕｓに対して見られた。

以下の実施例は本発明化合物の適用に適した配合物を示す。成分の量は指示したように重量部またはｇ／Ｌで表示される。*は商標を表す。

実施例４

この実施例は土壌用として適した顆粒を示す。顆粒は標準法、たとえば含浸、コーティング、押出しまたは凝集により調製しうる。

		%w／w
含浸顆粒：	有効成分	5
	ウッドロジン	2．5
	セッコウ顆粒	92．5
	（20－40メッシュ）	
コーティング		
顆粒：	有効成分	0．5
	'ソルブエッソ(Solvesso)' *200	0．4
	炭酸カルシウム顆粒	99．1
	（30－60メッシュ）	
徐放性顆粒：	有効成分	10
	ポリ酢酸ビニル/塩化ビニル	5
	コポリマーラテックス	
	アタパルガス顆粒	85

実施例５

この実施例は噴霧剤として使用するのに適した顆粒を示す。本発明化合物は、水中に希釈して適用するための湿潤性散剤、水分散性顆粒、懸濁剤濃縮液、乳化性濃縮液、乳剤またはマイクロカプセル懸濁剤として配合することができる。

		g／L
乳化性濃縮液：有効成分		２５０
	ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	５０
	ノニルフェノールエトキシレート	５０
	アルキルベンゼン系溶剤	１Ｌとなる量
		%w／w
湿潤性散剤：	液体有効成分	４０
	リグノスルホネート系分散助剤	5
	シリカ	２５
	ラウリル硫酸ナトリウム	3
	チャイナクレー（カオリン）	２７
マイクロカプセル		
懸濁剤：	液体有効成分	２５０
	トルエンジイソシアネート	１０
	ポリメチレンポリフェニルイソシアネート	２０
	ノニルフェノールエトキシレート	6
	リグノスルホネート系分散助剤	１５
	キサンタンガム	1
	ベントナイト	１０
	バイオサイド'プロキセル(Proxel)'*	０．１
	炭酸ナトリウム	5
	水	１Ｌとなる量

マイクロカプセル懸濁剤を噴霧剤、土壌ドレンチとして、または土壌に適用する徐放性顆粒を調製するための中間体として使用しうる。

	g／L
懸濁剤濃縮液：固体有効成分	４００
リグノスルホネート系分散助剤	５０
ラウリル硫酸ナトリウム	３０
キサンタンガム	１
バイオサイド'プロキセル'*	０．１
ベントナイト	１０
水	１Ｌとなる量

実施例６

この実施例は一般的な種子処理剤として、一般的な適用装置で使用するのに適した配合物を示す。

	%w／w
無水種子処理剤：有効成分	２０
ドデシルベンゼン	３
ルビントナー(Rubine Toner)(染料)	２．７
タルク	５３．３
シリカ	１００%となる量

実施例５の懸濁剤濃縮液およびマイクロカプセル懸濁剤を種子処理用の流動性濃縮液として使用しうる。

実施例７

この実施例は化合物の静電噴霧用配合物を示す。

	g／L
有効成分	２００
Ｎ－メチルピロリドン	５０
大豆油	１２０
'ソルブエッソ' *200	１Ｌとなる量

実施例８

この実施例は毒餌として使用するのに適した配合物を示す。

	%w／w
有効成分	０．２５
糖衣用砂糖	９９．６５
ブチル化ヒドロキシトルエン	０．１０

実施例９

この実施例は大形丸剤として使用するのに適した配合物を示す。

	mg
有効成分	１３００
ナトリウムデンプングリコレート	３００
ミクロクリスタリンセルロース	１２００
乳糖	２９２０
ポビドン	２５０
ステアリン酸マグネシウム	３０

実施例１０

この実施例は注入用懸濁剤として使用するのに適した配合物を示す。

	mg
有効成分	４０
メタ重亜硫酸ナトリウム	1
ポリソルベート８０	1
ヒドロキシ安息香酸メチルナトリウム	2
水	１ｍｌとなる量

実施例１１

この実施例は注入用液剤として使用するのに適した配合物を示す。

	mg
有効成分	２０
クエン酸ナトリウム	6
クエン酸	1
塩化ナトリウム	7
クロルクレゾール	1
水	１ｍｌとなる量

実施例１２

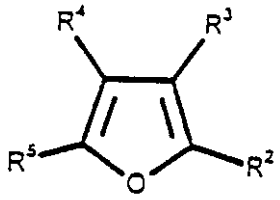
この実施例は経口懸濁剤として使用するのに適した配合物を示す。

	g
有効成分	１００．０
ポリソルベート８０	２．０
キサンタンガム	５．０
コロイド状二酸化ケイ素	１０．０
ヒドロキシ安息香酸メチル	１．５
クエン酸・１水和物	１０．０
クエン酸ナトリウム	１０．０
精製水	１０００．０ｍｌとなる量

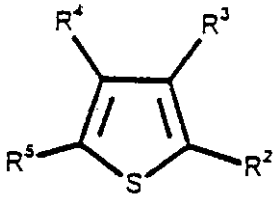
化学式

（明細書中）

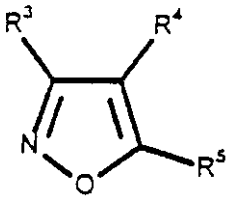
$$R\text{-}S(O)_nCH_2CH_2CH{=}CF_2 \qquad (I)$$



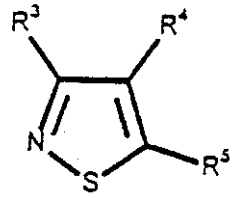
(II)



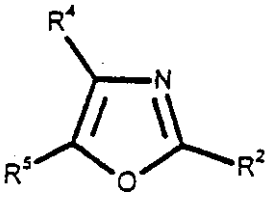
(III)



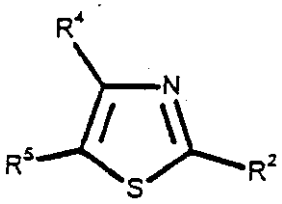
(IV)



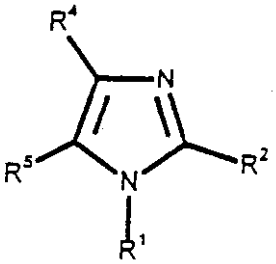
(V)



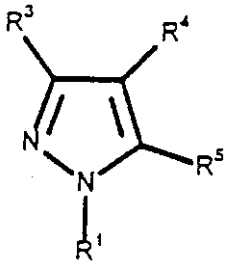
(VI)



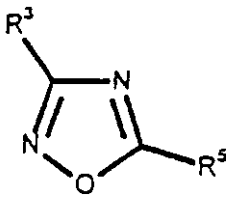
(VII)



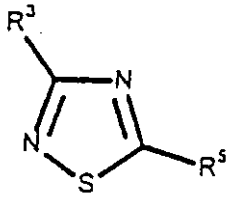
(VIII)



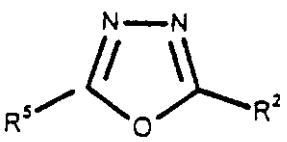
(IX)



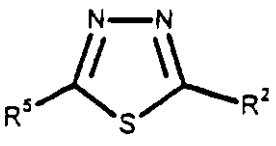
(X)



(XI)



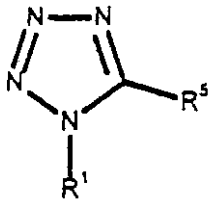
(XII)



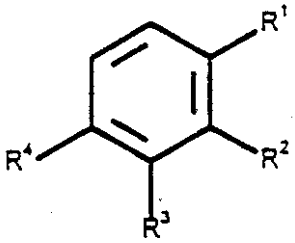
(XIII)

化学式

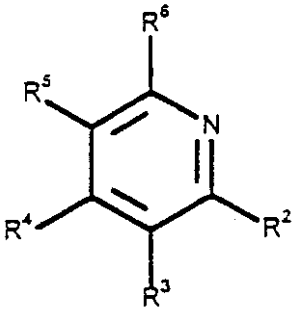
（明細書中）



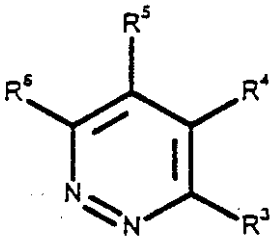
（XIV）



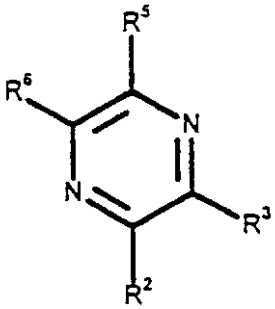
（XV）



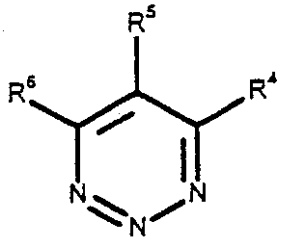
（XVI）



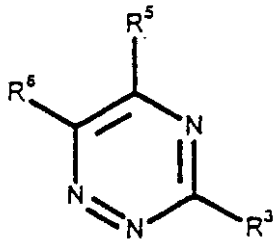
（XVII）



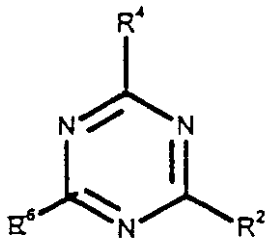
（XVIII）



（XIX）



（XX）



（XXI）

化学式

（明細書中）

$R-SH$ (XXIII)

$CF_2=CHCH_2CH_2L$ (XXIV)

$CF_2=CHCH_2CH_2OSO_2R^b$ (XXV)

$CF_2=CHCH_2CH_2Br$ (XXVI)

$R-L$ (XXVII)

$CF_2=CHCH_2CH_2SH$ (XXVIII)

$R-NH_2$ (XXIX)

$(CF_{2=}CHCH_2CH_2S)_2$ (XXX)

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		FI		
A01N 43/76	*(2006.01)*	A01N	43/76	
A01N 43/80	*(2006.01)*	A01N	43/80	101
A01P 7/02	*(2006.01)*	A01P	7/02	
A01P 7/04	*(2006.01)*	A01P	7/04	
C07C 323/05	*(2006.01)*	C07C	323/05	
C07D 213/71	*(2006.01)*	C07D	213/71	
C07D 213/80	*(2006.01)*	C07D	213/80	
C07D 213/81	*(2006.01)*	C07D	213/81	
C07D 213/82	*(2006.01)*	C07D	213/82	
C07D 213/84	*(2006.01)*	C07D	213/84	
C07D 213/85	*(2006.01)*	C07D	213/85	
C07D 231/18	*(2006.01)*	C07D	231/18	
C07D 233/84	*(2006.01)*	C07D	233/84	
C07D 233/90	*(2006.01)*	C07D	233/90	
C07D 233/92	*(2006.01)*	C07D	233/92	
C07D 237/10	*(2006.01)*	C07D	237/10	
C07D 241/12	*(2006.01)*	C07D	241/12	
C07D 251/22	*(2006.01)*	C07D	251/22	B
C07D 253/04	*(2006.01)*	C07D	253/04	
C07D 253/06	*(2006.01)*	C07D	253/06	C
C07D 257/04	*(2006.01)*	C07D	257/04	
C07D 261/10	*(2006.01)*	C07D	261/10	
C07D 261/14	*(2006.01)*	C07D	261/14	
C07D 261/18	*(2006.01)*	C07D	261/18	
C07D 263/34	*(2006.01)*	C07D	263/34	
C07D 263/46	*(2006.01)*	C07D	263/46	
C07D 271/06	*(2006.01)*	C07D	271/06	
C07D 271/10	*(2006.01)*	C07D	271/10	
C07D 277/20	*(2006.01)*	C07D	277/36	
C07D 277/36	*(2006.01)*	C07D	277/56	
C07D 277/56	*(2006.01)*	C07D	307/64	
C07D 307/64	*(2006.01)*	C07D	333/34	
C07D 333/34	*(2006.01)*	C07D	333/38	
C07D 333/38	*(2006.01)*	C07D	333/62	
C07D 333/62	*(2006.01)*	C07D	417/04	
C07D 417/04	*(2006.01)*	C07D	471/04	108X
C07D 471/04	*(2006.01)*			

(31)優先権主張番号 9404718.0
(32)優先日 平成6年3月10日(1994.3.10)
(33)優先権主張国 英国(GB)
(31)優先権主張番号 9404719.8
(32)優先日 平成6年3月10日(1994.3.10)
(33)優先権主張国 英国(GB)
(31)優先権主張番号 9404720.6
(32)優先日 平成6年3月10日(1994.3.10)
(33)優先権主張国 英国(GB)

(31)優先権主張番号　9404721.4
(32)優先日　　平成6年3月10日(1994.3.10)
(33)優先権主張国　英国(GB)
(31)優先権主張番号　9500521.1
(32)優先日　　平成7年1月11日(1995.1.11)
(33)優先権主張国　英国(GB)

(74)代理人
　　弁理士　小林　泰
(74)代理人
　　弁理士　藍原　誠
(72)発明者　ターンブル，マイケル・ドライスデイル
　　イギリス国バークシャー　アールジー６　２エックスジー，リーディング，アーレイ，サマートン・ガーデンズ　１９
(72)発明者　バンサル，ハルジンダー・シング
　　イギリス国バークシャー　アールジー１２　３エックスユー，ブラックネル，フォレスト・パーク，ウッドマンコット・クロース　１０
(72)発明者　スミス，アリソン・メアリー
　　イギリス国サリー　ティーダブリュー１０　６ディーピー，リッチモンド，アルバート・ロード　２６
(72)発明者　サマン，ロジャー
　　イギリス国バークシャー　アールジー１２　４ワイユー，ブラックネル，トーフィールド　３８
(72)発明者　フィッツジョン，スティーヴン
　　イギリス国バークシャー　アールジー１２　３ティーエス，ブラックネル，クラウン・ウッド，レスター　４７
(72)発明者　ゴッドフリー，クリストファー・リチャード・アイルズ
　　イギリス国バークシャー　アールジー１２　８ユーダブリュー，ブラックネル，グレイト・ホランズ，ヴァイキング　１５９
(72)発明者　ホットサン，マシュー・ブライアン
　　イギリス国バークシャー　アールジー１２　５ユーティー，ビンフィールド，クロックフォード・プレイス　４１
(72)発明者　シラーズ，ナン・キャセリン
　　イギリス国サリー　ジーユー１５　４キューエフ，カンバリー，カレッジ・タウン，ブランクサム・ヒル・ロード　５３
(72)発明者　ダウリング，アラン・ジョン
　　イギリス国バークシャー　エスエル６　２ワイダブリュー，メイデンヘッド，ムーア・エンド　７

審査官　前田　憲彦

(56)参考文献　特表平９－５０１１７５（ＪＰ，Ａ）
　　特表平８－５０３９３２（ＪＰ，Ａ）
　　特表平８－５０４１８５（ＪＰ，Ａ）

(58)調査した分野(Int.Cl.，ＤＢ名)
　　C07C317/00
　　A01N 43/00
　　C07C323/00
　　C07D213/00
　　C07D231/00
　　C07D233/00

C07D237/00
C07D241/00
C07D251/00
C07D253/00
C07D257/00
C07D261/00
C07D263/00
C07D271/00
C07D277/00
C07D307/00
C07D333/00
C07D417/00
C07D471/00
CA(STN)
REGISTRY(STN)