

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2017-206440

(P2017-206440A)

(43) 公開日 平成29年11月24日(2017.11.24)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 213/68 (2006.01)	C O 7 D 213/68 C S P	4 C O 5 5
C O 7 D 401/12 (2006.01)	C O 7 D 401/12	4 C O 6 3
C O 7 D 405/12 (2006.01)	C O 7 D 405/12	4 C O 6 4
C O 7 D 413/12 (2006.01)	C O 7 D 413/12	4 H O 1 1
C O 7 D 451/00 (2006.01)	C O 7 D 451/00	
審査請求 未請求 請求項の数 6 O L (全 80 頁) 最終頁に続く		

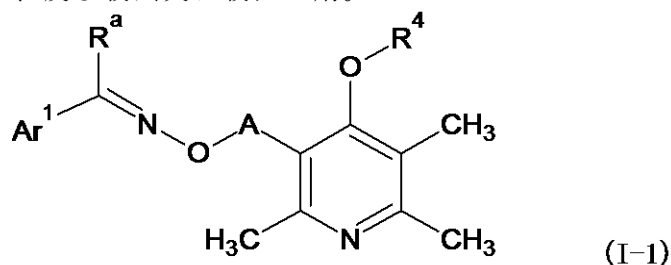
(21) 出願番号	特願2014-184671 (P2014-184671)	(71) 出願人	000004307
(22) 出願日	平成26年9月10日 (2014. 9. 10)		日本曹達株式会社
			東京都千代田区大手町2丁目2番1号
		(74) 代理人	100109508
			弁理士 菊間 忠之
		(72) 発明者	岩田 淳
			神奈川県小田原市高田345 日本曹達株
			式会社 小田原研究所内
		(72) 発明者	清田 隆太郎
			神奈川県小田原市高田345 日本曹達株
			式会社 小田原研究所内
		(72) 発明者	幸堀 伸哉
			神奈川県小田原市高田345 日本曹達株
			式会社 小田原研究所内
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 ピリジン化合物およびその用途

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】新規農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫または殺ダニ剤の提供。

【解決手段】式(I-1)で表される化合物、又はその互変異性体若しくは塩。前記化合物等から選ばれる少なくとも1つを有効成分に含有する農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、及び殺虫又は殺ダニ剤。



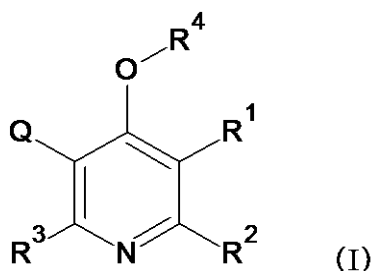
(R⁴はH、C 1～6 アルキル基等；A r¹は等C 6～1 0 アリール基、C 3～6 員ヘテロシクリル基等；AはC 1～6 アルキレン基、C 2～6 アルケニレン基等；R^aはH、C 1～6 アルキル基、C 6～1 0 アリール基、アセチル基等；A r¹とR^aは相互に繋がって、A r¹とR^aが結合する炭素原子とともに5～6 員環を形成してもよい)

【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) で表される化合物、またはその互変異性体若しくは塩。



10

〔式 (I) 中、

R¹は、水素原子、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルコキシ基、またはハロゲノ基を示す。

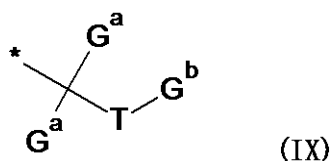
R²およびR³は、それぞれ独立に、水素原子、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 3～8シクロアルキル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルコキシ基、ホルミルオキシ基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルカルボニルオキシ基、無置換の若しくはG²で置換されたC 6～10アリール基、（無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルコキシイミノ）-C 1～6アルキル基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。

20

ここで、R¹とR²は、相互に繋がって、R¹およびR²のそれぞれが結合する炭素原子とともに5～6員環を形成してもよい。

R⁴は、水素原子、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 2～6アルケニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 2～6アルキニル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 3～8シクロアルキル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG²で置換された3～6員ヘテロシクリルC 1～6アルキル基、ホルミル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルカルボニル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 6～10アリールカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルコキシカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 2～6アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルスルホニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルアミノカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換された（C 1～6アルキルチオ）カルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルアミノ（チオカルボニル）基、または式 (IX) で表される有機基を示す。

30



40

〔式 (IX) 中、

G^aは、それぞれ独立に、水素原子、無置換のもしくはG¹で置換されたC 1～6アルキル基、無置換のもしくはG¹で置換されたC 2～6アルケニル基、無置換のもしくはG¹で置換されたC 2～6アルキニル基、無置換のもしくはG²で置換されたC 3～8シクロアルキル基、または無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリール基を示す。

50

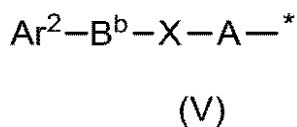
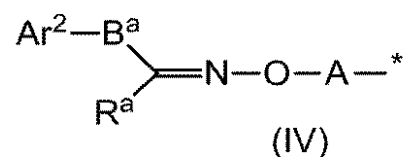
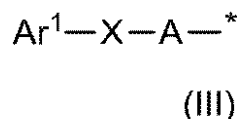
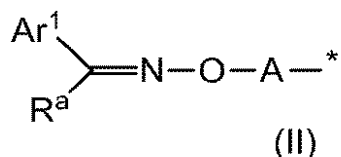
G^b は、水素原子、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 1～6アルキル基、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 2～6アルケニル基、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 2～6アルキニル基、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 3～8シクロアルキル基、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリール基、または無置換のもしくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリル基を示す。

Tは、酸素原子、オキシカルボニル基、カルボニルオキシ基、オキシカルボニルオキシ基、硫黄原子、(チオ)カルボニル基、カルボニル(チオ)基、(チオ)カルボニルオキシ基、オキシカルボニル(チオ)基、または $-O-C(=O)-N(G^b)-$ で表される二価の基を示す。

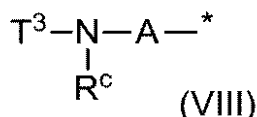
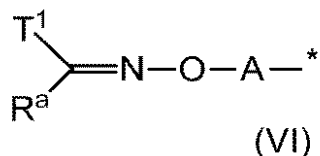
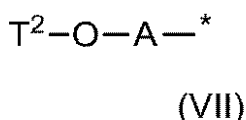
*は式(IX)で表される基の結合位置を示す。]

10

Qは、式(II)～式(VIII)で表される有機基のいずれかを示す。



20



30

[式(II)～式(VIII)中、

Ar^1 は、無置換の若しくは G^2 で置換されたC 6～10アリール基、または無置換の若しくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリル基を示す。

Ar^2 は、無置換の若しくは G^2 で置換されたC 6～10アリール基、無置換の若しくは G^2 で置換されたC 6～10アリールオキシ基、無置換の若しくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリル基、無置換の若しくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリルオキシ基、または無置換の若しくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリルチオ基を示す。

R^a は、水素原子、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 1～6アルキル基、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリール基、またはアミノ基を示す。ここで、 Ar^1 と R^a は、相互に繋がって、 Ar^1 と R^a が結合する炭素原子とともに5～6員環を形成してもよい。

40

Xは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基、または式： NR^c で表される二価の基を示す。 R^c は、水素原子、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 1～6アルキル基、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 2～6アルケニル基、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 1～6アルキルカルボニル基、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールカルボニル基、または無置換のもしくは G^1 で置換されたC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。

Aは、無置換のもしくは G^3 で置換されたC 1～C 6アルキレン基、無置換のもしくは G^3 で置換されたC 2～C 6アルケニレン基、無置換のもしくは G^3 で置換されたC 2～C

50

6 アルキニレン基、無置換のもしくは G^3 で置換されたC 1～C 6 アルキレンオキシ基、無置換のもしくは G^3 で置換されたオキシC 1～C 6 アルキレン基、またはカルボニル基を示す。

B^a は、無置換の若しくは G^4 で置換されたC 1～C 6 アルキレン基、無置換の若しくは G^4 で置換されたC 2～C 6 アルケニレン基、無置換の若しくは G^4 で置換されたC 2～C 6 アルキニレン基、無置換の若しくは G^4 で置換されたC 1～C 6 アルキレンオキシC 1～6 アルキレン基、無置換の若しくは G^4 で置換されたC 3～C 6 シクロアルキレン基、無置換の若しくは G^4 で置換されたC 4～C 6 シクロアルケニレン基、無置換の若しくは G^4 で置換された3～6 員ヘテロシクリレン基、または NR^d で表される二価の基を示す。 R^d は、水素原子、C 1～6 アルキル基、またはC 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。また、 B^a と R^a は、相互に繋がって、 B^a と R^a が結合する炭素原子とともに5～6 員環を形成してもよい。

B^b は、無置換のもしくは G^4 で置換されたC 1～C 6 アルキレン基、無置換のもしくは G^4 で置換されたC 2～C 6 アルケニレン基、無置換のもしくは G^4 で置換されたC 2～C 6 アルキニレン基、無置換のもしくは G^4 で置換されたC 3～C 6 シクロアルキレン基、無置換のもしくは G^4 で置換されたC 4～C 6 シクロアルケニレン基、無置換のもしくは G^4 で置換された3～6 員ヘテロシクリレン基、またはカルボニル基を示す。

T^1 は、（無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルコキシミノ）ーメチル基、1ー（無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルコキシミノ）ーエチル基、または無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルコキシ基を示す。

T^2 は、（無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルキル）ーアミノ基、（無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルキル）ーホルミルーアミノ基、（無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルキル）ーC 1～6 アルキルカルボニルーアミノ基、（無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルコキシ）ーC 1～6 アルキル基、または（無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルキル）ー3～6 員ヘテロシクリル基を示す。

T^3 は、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルコキシ基、または無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10 アリールアミノカルボニルーC 1～6 アルキル基を示す。

*は、式 (II)～式 (VIII) で表される有機基の結合位置を示す。]

G^1 は、水酸基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、ホルミルオキシ基、C 1～6 アルキルカルボニルオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニルオキシ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 または R^a のうちの2つ以上が G^1 で置換された前記の基である場合、係る G^1 は、相互に同じであっても異なってもよい。

G^2 は、C 1～6 アルキル基、C 2～6 アルケニル基、C 2～6 アルキニル基、C 3～8 シクロアルキル基、C 1～6 ハロアルキル基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシC 1～6 ハロアルキル基、C 2～6 ハロアルケニル基、C 2～6 ハロアルキニル基、水酸基、C 1～6 アルコキシ基、C 3～8 シクロアルキルC 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシC 1～6 ハロアルコキシ基、ホルミル基、C 1～6 アルキルカルボニル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、ホルミルオキシ基、C 1～6 アルキルカルボニルオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニルオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC 6～10 アリール基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルキル基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC 6～10 アリールオキシ基、無置換の若しくは G^{21} で置換された3～6 員ヘテロシ

クリル基、無置換の若しくは G^{21} で置換された3～6員ヘテロシクリルオキシ基、C1～6アルキルチオ基、C1～6アルキルスルフィニル基、C1～6アルキルスルホニル基、C1～6ハロアルキルチオ基、C1～6ハロアルキルスルフィニル基、C1～6ハロアルキルスルホニル基、ペンタフルオロスルファニル基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC6～10アリールチオ基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC6～10アリールスルフィニル基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC6～10アリールスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、ハロゲノ基、C1～6アルキレン基、C1～6アルキレンジオキシ基、またはC1～6ハロアルキレンジオキシ基を示す。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^a 、 G^4 、 Ar^1 または Ar^2 のうちの2つ以上が G^2 で置換された前記の基である場合、係る G^2 は、相互に同じであっても異なってもよい。

10

G^{21} は、C1～6アルキル基、C1～6ハロアルキル基、C1～6アルコキシ基、C1～6ハロアルコキシ基、またはハロゲノ基を示す。 G^2 または G^4 のうちの2つ以上が G^{21} で置換された前記の基である場合、係る G^{21} は、相互に同じであっても異なってもよい。

G^3 は、C1～6アルキル基、C1～6アルコキシ基、ホルミル基、C1～6アルキルカルボニル基、ホルミルオキシ基、C1～6アルキルカルボニルオキシ基、ハロゲノ基、C1～6アルキレン基、またはオキソ基を示す。

G^4 は、C1～6アルキル基、C3～8シクロアルキル基、C1～6ハロアルキル基、C1～6アルコキシC1～6アルキル基、C2～6アルケニルオキシC1～6アルキル基、水酸基、C1～6アルコキシ基、C1～6アルコキシC1～6アルコキシ基、C2～6アルケニルオキシ基、C1～6アルコキシカルボニル基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC6～10アリール基、無置換の若しくは G^{21} で置換された3～6員ヘテロシクリル基、シアノ基、ハロゲノ基、C1～6アルキレン基、C1～6アルキレンジオキシ基、オキソ基、C3～8シクロアルキルC1～6アルキル基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC6～10アリールC1～6アルキル基、無置換の若しくは G^{21} で置換された3～6員ヘテロシクリルC1～6アルキル基、C3～8シクロアルキルオキシC1～6アルキル基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC6～10アリールオキシC1～6アルキル基、無置換の若しくは G^{21} で置換された3～6員ヘテロシクリルオキシC1～6アルキル基、C1～6アルキリデン基、C1～6アルコキシイミノ基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC6～10アリールC1～6アルコキシイミノ基、またはC1～6アルキルヒドラジノ基を示す。]

20

30

【請求項2】

式(I)中の R^4 が、水素原子またはアリル基である、請求項1に記載の化合物、またはその互変異性体若しくは塩。

【請求項3】

請求項1または2に記載の化合物、並びにその互変異性体および塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

【請求項4】

請求項1または2に記載の化合物、並びにその互変異性体および塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する有害生物防除剤。

40

【請求項5】

請求項1または2に記載の化合物、並びにその互変異性体および塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する殺虫または殺ダニ剤。

【請求項6】

請求項1または2に記載の化合物、並びにその互変異性体および塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する外部寄生虫防除剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

50

【0001】

本発明は、ピリジン化合物、並びに農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫または殺ダニ剤などの用途に関する。

【背景技術】

【0002】

農園芸作物の栽培に当り、作物の病害に対して多数の防除薬剤が提案されている。提案されている防除薬剤のほとんどは、その防除効力が不十分であったり、薬剤耐性の病原菌の出現によりその使用が制限されたり、植物体に薬害や汚染を生じさせたり、若しくは人畜魚類に対する毒性や環境への影響が大きかったりなどで、十分に満足できるものでない。そのため、かかる欠点の少ない安全に使用できる防除薬剤の出現が強く要望されている。

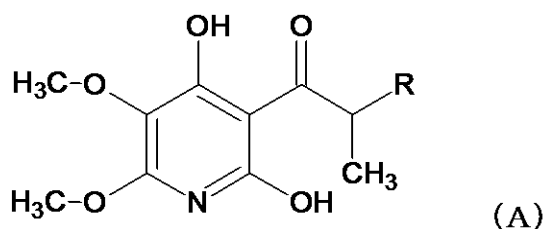
10

【0003】

ところで、特許文献1には、式(A)若しくは式(B)で表されるピリジン化合物が開示されている。特許文献1によれば、このピリジン化合物は電子伝達系の複合体II阻害剤として有用であるらしい。

【0004】

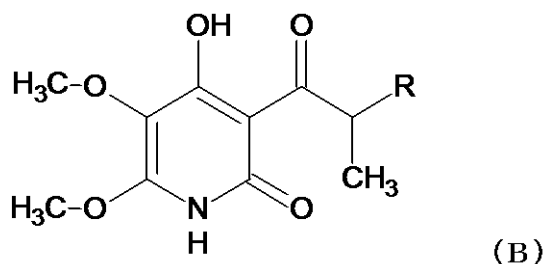
【化1】



20

【0005】

【化2】



30

【先行技術文献】

【特許文献】

【0006】

【特許文献1】WO 2003/103667 A

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0007】

本発明の課題は、新規なピリジン化合物、ならびに農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫または殺ダニ剤を提供することである。

40

【課題を解決するための手段】

【0008】

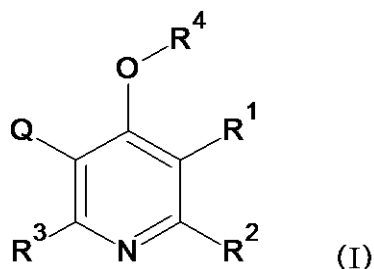
上記課題を解決するために検討した結果、以下の態様を包含する本発明を完成するに至った。

【0009】

〔1〕式(I)で表される化合物、またはその互変異性体若しくは塩。

【0010】

【化 3】



【0011】

10

式 (I) 中、

R¹は、水素原子、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルコキシ基、またはハロゲノ基を示す。

R²およびR³は、それぞれ独立に、水素原子、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 3～8シクロアルキル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルコキシ基、ホルミルオキシ基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルカルボニルオキシ基、無置換の若しくはG²で置換されたC 6～10アリール基、（無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルコキシイミノ）-C 1～6アルキル基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。

20

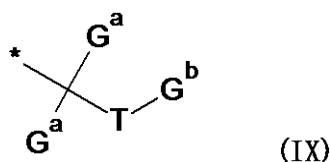
ここで、R¹とR²は、相互に繋がって、R¹およびR²のそれぞれが結合する炭素原子とともに5～6員環を形成してもよい。

R⁴は、水素原子、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 2～6アルケニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 2～6アルキニル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 3～8シクロアルキル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG²で置換された3～6員ヘテロシクリルC 1～6アルキル基、ホルミル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルカルボニル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 6～10アリールカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルコキシカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 2～6アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルスルホニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルアミノカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換された（C 1～6アルキルチオ）カルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6アルキルアミノ（チオカルボニル）基、または式 (IX) で表される有機基を示す。

30

【0012】

【化 4】



40

【0013】

式 (IX) 中、G^aは、それぞれ独立に、水素原子、無置換のもしくはG¹で置換されたC 1～6アルキル基、無置換のもしくはG¹で置換されたC 2～6アルケニル基、無置換のもしくはG¹で置換されたC 2～6アルキニル基、無置換のもしくはG²で置換されたC 3～8シクロアルキル基、または無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリール基を示す。

【0014】

式 (IX) 中、G^bは、水素原子、無置換のもしくはG¹で置換されたC 1～6アルキル基

50

、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 2～6アルケニル基、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 2～6アルキニル基、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 3～8シクロアルキル基、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリール基、または無置換のもしくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリル基を示す。

【0015】

式(IX)中、Tは、酸素原子、オキシカルボニル基、カルボニルオキシ基、オキシカルボニルオキシ基、硫黄原子、(チオ)カルボニル基、カルボニル(チオ)基、(チオ)カルボニルオキシ基、オキシカルボニル(チオ)基、または $-O-C(=O)-N(G^b)-$ で表される二価の基を示す。

*は式(IX)で表される基の結合位置を示す。

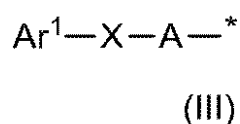
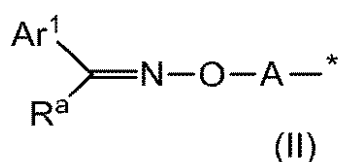
10

【0016】

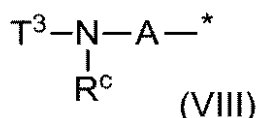
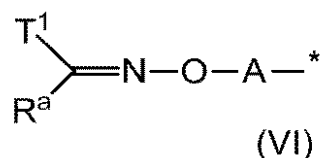
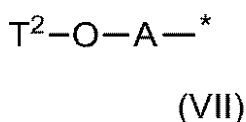
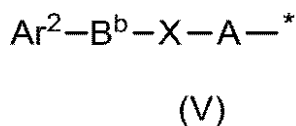
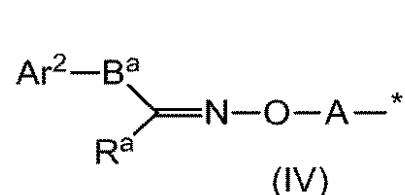
Qは、式(II)～式(VIII)で表される有機基のいずれかを示す。

【0017】

【化5】



20



30

【0018】

式(II)～式(VIII)中、

Ar^1 は、無置換の若しくは G^2 で置換されたC 6～10アリール基、または無置換の若しくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリル基を示す。

Ar^2 は、無置換の若しくは G^2 で置換されたC 6～10アリール基、無置換の若しくは G^2 で置換されたC 6～10アリールオキシ基、無置換の若しくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリル基、無置換の若しくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリルオキシ基、または無置換の若しくは G^2 で置換された3～6員ヘテロシクリルチオ基を示す。

40

R^a は、水素原子、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 1～6アルキル基、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリール基、またはアミノ基を示す。ここで、 Ar^1 と R^a は、相互に繋がって、 Ar^1 と R^a が結合する炭素原子とともに5～6員環を形成してもよい。

Xは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基、または NR^c で表される二価の基を示す。 R^c は、水素原子、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 1～6アルキル基、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 2～6アルケニル基、無置換のもしくは G^1 で置換されたC 1～6アルキルカルボニル基、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールカルボニル基、または無置換のもしくは G^1 で置換されたC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。

Aは、無置換のもしくは G^3 で置換されたC 1～C 6アルキレン基、無置換のもしくは

50

G³で置換されたC 2～C 6アルケニレン基、無置換のもしくはG³で置換されたC 2～C 6アルキニレン基、無置換のもしくはG³で置換されたC 1～C 6アルキレンオキシ基、無置換のもしくはG³で置換されたオキシC 1～C 6アルキレン基、またはカルボニル基を示す。

B^aは、無置換の若しくはG⁴で置換されたC 1～C 6アルキレン基、無置換の若しくはG⁴で置換されたC 2～C 6アルケニレン基、無置換の若しくはG⁴で置換されたC 2～C 6アルキニレン基、無置換の若しくはG⁴で置換されたC 1～C 6アルキレンオキシC 1～6アルキレン基、無置換の若しくはG⁴で置換されたC 3～C 6シクロアルキレン基、無置換の若しくはG⁴で置換されたC 4～C 6シクロアルケニレン基、無置換の若しくはG⁴で置換された3～6員ヘテロシクリレン基、またはNR^dで表される二価の基を示す。R^dは、水素原子、C 1～6アルキル基、またはC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。また、B^aとR^aは、相互に繋がって、B^aとR^aが結合する炭素原子とともに5～6員環を形成してもよい。

B^bは、無置換のもしくはG⁴で置換されたC 1～C 6アルキレン基、無置換のもしくはG⁴で置換されたC 2～C 6アルケニレン基、無置換のもしくはG⁴で置換されたC 2～C 6アルキニレン基、無置換のもしくはG⁴で置換されたC 3～C 6シクロアルキレン基、無置換のもしくはG⁴で置換されたC 4～C 6シクロアルケニレン基、無置換のもしくはG⁴で置換された3～6員ヘテロシクリレン基、またはカルボニル基を示す。

T¹は、（無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシイミノ）-メチル基、1-（無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシイミノ）-エチル基、または無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシ基を示す。

T²は、（無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル）-アミノ基、（無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル）-ホルミル-アミノ基、（無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル）-C 1～6アルキルカルボニル-アミノ基、（無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシ）-C 1～6アルキル基、または（無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル）-3～6員ヘテロシクリル基を示す。

T³は、無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシ基、または無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリールアミノカルボニル-C 1～6アルキル基を示す。

*は、式 (II) ～式 (VIII) で表される有機基の結合位置を示す。

【0019】

G¹は、水酸基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、ホルミルオキシ基、C 1～6アルキルカルボニルオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニルオキシ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。R¹、R²、R³、R⁴またはR^aのうちの2つ以上がG¹で置換された前記の基である場合、係るG¹は、相互に同じであっても異なってもよい。

【0020】

G²は、C 1～6アルキル基、C 2～6アルケニル基、C 2～6アルキニル基、C 3～8シクロアルキル基、C 1～6ハロアルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6ハロアルキル基、C 2～6ハロアルケニル基、C 2～6ハロアルキニル基、水酸基、C 1～6アルコキシ基、C 3～8シクロアルキルC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシC 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシC 1～6ハロアルコキシ基、ホルミル基、C 1～6アルキルカルボニル基、C 1～6アルコキシカルボニル基、ホルミルオキシ基、C 1～6アルキルカルボニルオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニルオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリール基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG²¹で置換さ

10

20

30

40

50

れたC 6～10アリールオキシ基、無置換の若しくはG²¹で置換された3～6員ヘテロシクリル基、無置換の若しくはG²¹で置換された3～6員ヘテロシクリルオキシ基、C 1～6アルキルチオ基、C 1～6アルキルスルフィニル基、C 1～6アルキルスルホニル基、C 1～6ハロアルキルチオ基、C 1～6ハロアルキルスルフィニル基、C 1～6ハロアルキルスルホニル基、ペンタフルオロスルファニル基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリールチオ基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリールスルフィニル基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリールスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、ハロゲノ基、C 1～6アルキレン基、C 1～6アルキレンジオキシ基、またはC 1～6ハロアルキレンジオキシ基を示す。R¹、R²、R³、R⁴、R^a、G⁴、Ar¹またはAr²のうちの2つ以上がG²で置換された前記の基である場合、係るG²は、相互に同じであっても異なってもよい。

【0021】

G²¹は、C 1～6アルキル基、C 1～6ハロアルキル基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6ハロアルコキシ基、またはハロゲノ基を示す。G²またはG⁴のうちの2つ以上がG²¹で置換された前記の基である場合、係るG²¹は、相互に同じであっても異なってもよい。

【0022】

G³は、C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、ホルミル基、C 1～6アルキルカルボニル基、ホルミルオキシ基、C 1～6アルキルカルボニルオキシ基、ハロゲノ基、C 1～6アルキレン基、またはオキシ基を示す。

【0023】

G⁴は、C 1～6アルキル基、C 3～8シクロアルキル基、C 1～6ハロアルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6アルキル基、C 2～6アルケニルオキシC 1～6アルキル基、水酸基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシC 1～6アルコキシ基、C 2～6アルケニルオキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリール基、無置換の若しくはG²¹で置換された3～6員ヘテロシクリル基、シアノ基、ハロゲノ基、C 1～6アルキレン基、C 1～6アルキレンジオキシ基、オキシ基、C 3～8シクロアルキルC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG²¹で置換された3～6員ヘテロシクリルC 1～6アルキル基、C 3～8シクロアルキルオキシC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリールオキシC 1～6アルキル基、無置換の若しくはG²¹で置換された3～6員ヘテロシクリルオキシC 1～6アルキル基、C 1～6アルキリデン基、C 1～6アルコキシイミノ基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシイミノ基、またはC 1～6アルキルヒドラジノ基を示す。

【0024】

〔2〕 式(I)中のR⁴が、水素原子またはアリル基である、前記〔1〕に記載の化合物、またはその互変異性体若しくは塩。

【0025】

〔3〕 前記〔1〕または〔2〕に記載の化合物、並びにその互変異性体および塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

〔4〕 前記〔1〕または〔2〕に記載の化合物、並びにその互変異性体および塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する有害生物防除剤。

〔5〕 前記〔1〕または〔2〕に記載の化合物、並びにその互変異性体および塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する殺虫または殺ダニ剤。

〔6〕 前記〔1〕または〔2〕に記載の化合物、並びにその互変異性体および塩からなる群から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有する外部寄生虫防除剤。

【発明の効果】

【0026】

本発明に係るピリジン化合物は、有害生物防除、殺菌、殺ダニ、殺虫などの効果を有し、植物体に薬害を生じることがなく、人畜魚類に対する毒性や環境への影響が少ない新規

化合物である。特に、ムギ病害に対して優れた防除効果を示す。本発明に係るピリジン化合物は、農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫または殺ダニ剤の有効成分として有用である。

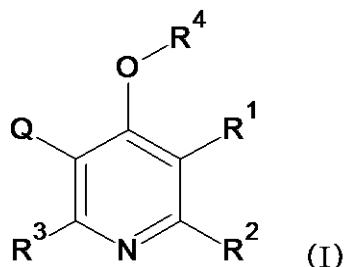
【発明を実施するための形態】

【0027】

本発明に係るピリジン化合物は、式 (I) で表される化合物（以下、化合物 (I) と表記することがある。）、化合物 (I) の互変異性体、および化合物 (I) の塩である。

【0028】

【化6】



10

【0029】

[R¹]

R¹は、水素原子、無置換の若しくはG¹で置換されたC1～6アルキル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC1～6アルコキシ基、またはハロゲノ基を示す。

20

【0030】

C1～6アルキル基は、直鎖であってもよいし、炭素数が3以上であれば分岐鎖であってもよい。C1～6アルキル基としては、メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、i-ペンチル基、ネオペンチル基、2-メチルブチル基、2,2-ジメチルプロピル基、i-ヘキシル基などを挙げることができる。

C1～6アルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、n-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基、i-プロポキシ基、i-ブトキシ基、s-ブトキシ基、t-ブトキシ基、i-ヘキシルオキシ基などを挙げることができる。

30

ハロゲノ基としては、フルオロ基、クロロ基、ブロモ基、イオド基を挙げることができる。

【0031】

置換基G¹は、水酸基、C1～6アルコキシ基、C1～6アルコキシC1～6アルコキシ基、C1～6アルコキシカルボニル基、ホルミルオキシ基、C1～6アルキルカルボニルオキシ基、C1～6アルコキシカルボニルオキシ基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。なお、R¹、R²、R³、R⁴またはR^aのうちの2つ以上がG¹で置換された基である場合、係るG¹は、相互に同じであっても異なってもよい。

【0032】

40

C1～6アルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、n-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基、i-プロポキシ基、i-ブトキシ基、s-ブトキシ基、t-ブトキシ基、i-ヘキシルオキシ基などを挙げることができる。

C1～6アルコキシC1～6アルコキシ基としては、メトキシメトキシ基、メトキシエトキシ基などを挙げることができる。

C1～6アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、i-プロポキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基などを挙げることができる。

C1～6アルキルカルボニルオキシ基としては、アセチルオキシ基、プロピオニルオキ

50

シ基、ブチリルオキシ基などを挙げることができる。

C 1～6 アルコキシカルボニルオキシ基としては、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、n-プロポキシカルボニルオキシ基、i-プロポキシカルボニルオキシ基、n-ブトキシカルボニルオキシ基、t-ブトキシカルボニルオキシ基などを挙げることができる。

置換基 G^1 における、ハロゲノ基は既に述べたとおりのものである。

【0033】

[R^2 および R^3]

R^2 および R^3 は、それぞれ独立に、水素原子、無置換の若しくは G^1 で置換されたC 1～6 アルキル基、無置換の若しくは G^2 で置換されたC 3～8 シクロアルキル基、無置換の若しくは G^1 で置換されたC 1～6 アルコキシ基、ホルミルオキシ基、無置換の若しくは G^1 で置換されたC 1～6 アルキルカルボニルオキシ基、無置換の若しくは G^2 で置換されたC 6～10 アリール基、（無置換の若しくは G^1 で置換されたC 1～6 アルコキシイミノ）-C 1～6 アルキル基、シアノ基、またはハロゲノ基を示す。

【0034】

R^2 および R^3 における、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ハロゲノ基、および置換基 G^1 は、すでに述べたとおりのものである。

C 3～8 シクロアルキル基としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、2-アダマンチル基などを挙げることができる。

C 1～6 アルキルカルボニルオキシ基としては、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ブチリルオキシ基などを挙げることができる。

C 6～10 アリール基としては、フェニル基、ナフチル基、アズレニル基、インデニル基、インダニル基、テトラリニル基などを挙げることができる。

(C 1～6 アルコキシイミノ)-C 1～6 アルキル基としては、(C 1～6 アルコキシイミノ)-C 1～6 アルキル基としては、メトキシイミノ-メチル基、1-(エトキシイミノ)-エチル基などを挙げることができる。

【0035】

置換基 G^2 は、C 1～6 アルキル基、C 2～6 アルケニル基、C 2～6 アルキニル基、C 3～8 シクロアルキル基、C 1～6 ハロアルキル基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシC 1～6 ハロアルキル基、C 2～6 ハロアルケニル基、C 2～6 ハロアルキニル基、水酸基、C 1～6 アルコキシ基、C 3～8 シクロアルキルC 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシ基、C 1～6 ハロアルコキシC 1～6 ハロアルコキシ基、ホルミル基、C 1～6 アルキルカルボニル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、ホルミルオキシ基、C 1～6 アルキルカルボニルオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニルオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC 6～10 アリール基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルキル基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC 6～10 アリールオキシ基、無置換の若しくは G^{21} で置換された3～6 員ヘテロシクリル基、無置換の若しくは G^{21} で置換された3～6 員ヘテロシクリルオキシ基、C 1～6 アルキルチオ基、C 1～6 アルキルスルフィニル基、C 1～6 アルキルスルホニル基、C 1～6 ハロアルキルチオ基、C 1～6 ハロアルキルスルフィニル基、C 1～6 ハロアルキルスルホニル基、ペンタフルオロスルファニル基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC 6～10 アリールチオ基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC 6～10 アリールスルフィニル基、無置換の若しくは G^{21} で置換されたC 6～10 アリールスルホニル基、ニトロ基、シアノ基、ハロゲノ基、C 1～6 アルキレン基、C 1～6 アルキレンジオキシ基、またはC 1～6 ハロアルキレンジオキシ基を示す。

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^a 、 G^4 、 Ar^1 または Ar^2 のうちの2つ以上が G^2 で置換された基である場合、係る G^2 は、相互に同じであっても異なってもよい。

【0036】

置換基 G^2 における、C 1～6 アルキル基、C 3～8 シクロアルキル基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキルカルボニルオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、C 1～6 アルコキシカルボニルオキシ基、C 6～10 アリール基、およびハロゲン基は既に述べたとおりのものである。

【0037】

C 2～6 アルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基（アリル基）、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、1-ペンテニル基、2-ペンテニル基、3-ペンテニル基、4-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、1-ヘキセニル基、2-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、5-ヘキセニル基などを挙げることができる。

10

C 2～6 アルキニル基としては、エチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、3-ペンチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、2-メチル-3-ペンチニル基、1-ヘキシニル基、1, 1-ジメチル-2-ブチニル基などを挙げることができる。

【0038】

C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基は、既に述べた C 1～6 アルキル基に、上述の C 1～6 アルコキシ基が置換したものである。C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基としては、メトキシメチル基、エトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、メトキシ-n-プロピル基、エトキシメチル基、エトキシエチル基、n-プロポキシメチル基、i-プロポキシエチル基、s-ブトキシメチル基、t-ブトキシエチル基などを挙げることができる。

20

C 3～8 シクロアルキル C 1～6 アルコキシ基は、既に述べた C 1～6 アルコキシ基に、上述の C 3～8 シクロアルキル基が置換したものである。C 3～8 シクロアルキル C 1～6 アルコキシ基としては、シクロプロピルメトキシ基、シクロブチルメトキシ基、シクロペンチルメトキシ基、シクロヘキシルメトキシ基、2-（シクロプロピル）-エトキシ基などを挙げることができる。

【0039】

C 1～6 アルキルカルボニル基は、カルボニル基に、上述の C 1～6 アルキル基が結合したものである。C 1～6 アルキルカルボニル基としては、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、i-ブチリル基、ピバロイル基などを挙げることができる。

30

【0040】

C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基は、アミノ基に、既に述べた C 1～6 アルコキシカルボニル基が置換したものである。C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基としては、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、n-プロポキシカルボニルアミノ基、i-プロポキシカルボニルアミノ基、n-ブトキシカルボニルアミノ基、t-ブトキシカルボニルアミノ基などを挙げることができる。

C 6～10 アリール C 1～6 アルキル基は、既に述べた C 1～6 アルキル基に、上述の C 6～10 アリール基が置換したものである。C 6～10 アリール C 1～6 アルキル基としては、ベンジル基、フェネチル基などを挙げることができる。

40

【0041】

C 6～10 アリールオキシ基は、水酸基に、既に述べた C 6～10 アリール基が置換したものである。C 6～10 アリールオキシ基としては、フェノキシ基、ナフトキシ基などを挙げることができる。

【0042】

3～6 員ヘテロシクリル基は、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる 1～4 個のヘテロ原子を環の構成原子として含むものである。ヘテロシクリル基は、単環および多環のいずれであってもよい。多環ヘテロシクリル基は、少なくとも一つの環がヘテロシクリルであれば、残りの環が飽和脂環、不飽和脂環または芳香環のいずれであ

50

ってもよい。3～6員ヘテロシクリル基としては、3～6員飽和ヘテロシクリル基、5～6員ヘテロアリール基、5～6員部分不飽和ヘテロシクリル基などを挙げることができる。

【0043】

3～6員飽和ヘテロシクリル基としては、アジリジニル基、オキシラニル基、アゼチジニル基、オキセタニル基、ピロリジニル基、テトラヒドロフラニル基、チアゾリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、テトラヒドロピラニル基、ジオキサニル基、ジオキサニル基などを挙げることができる。

【0044】

5員ヘテロアリール基としては、ピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、テトラゾリル基などを挙げることができる。

10

6員ヘテロアリール基としては、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基などを挙げることができる。

【0045】

3～6員ヘテロシクリルオキシ基は、水酸基に、3～6員ヘテロシクリル基が置換したものである。3～6員ヘテロシクリルオキシ基としては、ピラゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基などを挙げることができる。3～6員ヘテロシクリルオキシ基は、5～6員ヘテロシクリルオキシ基が好ましい。

20

【0046】

C1～6アルキルチオ基は、SH基に、C1～6アルキル基が置換したものである。C1～6アルキルチオ基としては、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基、i-プロピルチオ基、i-ブチルチオ基などを挙げることができる。

C1～6アルキルスルフィニル基は、スルフィニル基に、C1～6アルキル基が結合したものである。C1～6アルキルスルフィニル基としては、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、t-ブチルスルフィニル基などを挙げることができる。

C1～6アルキルスルホニル基は、スルホニル基に、C1～6アルキル基が結合したものである。C1～6アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、t-ブチルスルホニル基などを挙げることができる。

30

C6～10アリールチオ基は、SH基に、C6～10アリール基が置換したものである。C6～10アリールチオ基としては、フェニルチオ基、ナフチルチオ基などを挙げることができる。

C6～10アリールスルフィニル基は、スルフィニル基に、C6～10アリール基が置換したものである。C6～10アリールスルフィニル基としては、フェニルスルフィニル基、ナフチルスルフィニル基などを挙げることができる。

C6～10アリールスルホニル基は、スルホニル基に、C6～10アリール基が置換したものである。C6～10アリールスルホニル基としては、フェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基などを挙げることができる。

40

【0047】

C1～6アルキレン基としては、C1～6アルカン中の水素原子2個が外れてなる2価の基である。C1～6アルキレン基としては、メチレン基、エチレン基（ジメチレン基）、トリメチレン基、テトラメチレン基、プロパン-1,2-ジイル基（すなわち、プロピレン基）などを挙げることができる。

C1～6アルキレンジオキシ基は、C1～6アルカン中の水素原子2個がオキシ基で置換されてなる2価の基である。C1～6アルキレンジオキシ基としては、メチレンジオキシ基（ $-OCH_2O-$ ）、エチレンジオキシ基（ $-OCH_2CH_2O-$ ）、トリメチレンジオキシ基などを挙げることができる。G²であるC1～6アルキレンジオキシ基で置換されたC6～10アリール基としては、2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシル基、ベンゾ[1,

50

3] ジオキソリル基などを挙げることができる。

【0048】

C 1～6 ハロアルキル基、C 2～6 ハロアルケニル基、C 2～6 ハロアルキニル基、C 1～6 ハロアルコキシ基、および C 1～6 ハロアルキレンジオキシ基は、すでに述べた、C 1～6 アルキル基、C 2～6 アルケニル基、C 2～6 アルキニル基、C 1～6 アルコキシ基、および C 1～6 アルキレンジオキシ基に、ハロゲノ基が置換したものである。

C 1～6 ハロアルキル基としては、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、トリプロモメチル基、1-クロロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、2, 2, 2-トリクロロエチル基、ペンタフルオロエチル基、4-フルオロブチル基、4-クロロブチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル基、パーフロロヘキシル基、パークロロヘキシル基、2, 4, 6-トリクロロヘキシル基などを挙げることができる。

【0049】

C 2～6 ハロアルケニル基としては、2-クロロ-1-プロペニル基、2-フルオロ-1-ブテニル基などを挙げることができる。

C 2～6 ハロアルキニル基としては、4, 4-ジクロロ-1-ブチニル基、4-フルオロ-1-ペンチニル基、5-ブロモ-2-ペンチニル基などを挙げることができる。

C 1～6 ハロアルコキシ基としては、クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、1-フルオロエトキシ基、1, 1-ジフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、2, 2, 3, 4, 4, 4-ヘキサフルオロ-ブトキシ基、1-ブロモ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基などを挙げることができる。

C 1～6 ハロアルキレンジオキシ基としては、ジフルオロメチレンジオキシ基 (-OCF₂O-)、テトラフルオロエチレンジオキシ基 (-OCF₂CF₂O-)などを挙げることができる。G²である C 1～6 ハロアルキレンジオキシ基で置換された C 6～10 アリール基としては、2, 2, 3, 3-テトラフルオロ-2, 3-ジヒドロ-ベンゾ [1, 4] ジオキシル基、2, 2-ジフルオロ-ベンゾ [1, 3] ジオキソリル基などを挙げることができる。

【0050】

C 1～6 アルコキシ C 1～6 ハロアルキル基、C 1～6 ハロアルコキシ C 1～6 ハロアルコキシ基、C 1～6 ハロアルキルチオ基、C 1～6 ハロアルキルスルフィニル基、および C 1～6 ハロアルキルスルホニル基は、すでに述べた、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキルチオ基、C 1～6 アルキルスルフィニル基、および C 1～6 アルキルスルホニル基に、ハロゲノ基が置換したものである。

C 1～6 アルコキシ C 1～6 ハロアルキル基としては、ジフルオロ (メトキシ) メチル基、1, 1, 1, 3, 3, 3-ヘキサフルオロ-2-メトキシプロパン-2-イル基などを挙げることができる。

C 1～6 ハロアルコキシ C 1～6 ハロアルコキシ基としては、ジフルオロ (メトキシ) メトキシ基、1, 2, 2-トリフルオロ-2- (トリフルオロメトキシ) エトキシ基などを挙げることができる。

C 1～6 ハロアルキルチオ基としては、トリフルオロメチルチオ基、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ基などを挙げることができる。

C 1～6 ハロアルキルスルフィニル基としては、トリフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル基などを挙げることができる。

C 1～6 ハロアルキルスルホニル基としては、トリフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル基などを挙げることができる。

【0051】

置換基 G²¹は、C 1～6 アルキル基、C 1～6 ハロアルキル基、C 1～6 アルコキシ基

10

20

30

40

50

、C 1～6 ハロアルコキシ基、またはハロゲノ基を示す。これらは既に述べたとおりのものである。G²またはG⁴のうちの2つ以上がG²¹で置換された前記の基である場合、係るG²¹は、相互に同じであっても異なってもよい。

【0052】

R¹とR²は、相互に繋がって、R¹およびR²のそれぞれが結合する炭素原子とともに5～6員環を形成してもよい。係る5～6員環としては、シクロペンテン環、シクロヘキセン環などを挙げることができる。

【0053】

[R⁴]

R⁴は、水素原子、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6 アルキル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 2～6 アルケニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 2～6 アルキニル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 3～8 シクロアルキル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 6～10 アリールC 1～6 アルキル基、無置換の若しくはG²で置換された3～6員ヘテロシクリルC 1～6 アルキル基、ホルミル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6 アルキルカルボニル基、無置換の若しくはG²で置換されたC 6～10 アリールカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6 アルコキシカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 2～6 アルケニルオキシカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6 アルキルスルホニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6 アルキルアミノカルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換された(C 1～6 アルキルチオ)カルボニル基、無置換の若しくはG¹で置換されたC 1～6 アルキルアミノ(チオカルボニル)基、または式(IX)で表される有機基を示す。

【0054】

R⁴における、C 1～6 アルキル基、C 2～6 アルケニル基、C 2～6 アルキニル基、C 3～8 シクロアルキル基、C 1～6 アルキルカルボニル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、C 1～6 アルキルスルホニル基、置換基G¹および置換基G²は既に述べたとおりのものである。

【0055】

C 6～10 アリールC 1～6 アルキル基は、C 1～6 アルキル基に、C 6～10 アリール基が置換したものである。C 6～10 アリールC 1～6 アルキル基としては、ベンジル基、フェネチル基などを挙げることができる。

3～6員ヘテロシクリルC 1～6 アルキル基は、C 1～6 アルキル基に、3～6員ヘテロシクリル基が置換したものである。3～6員ヘテロシクリルC 1～6 アルキル基としては、好ましくは、テトラヒドロフラニルメチル基、テトラヒドロピラニルメチル基、ジオキサニルメチル基、ジオキサニルメチル基などの5～6員飽和ヘテロシクリルC 1～6 アルキル基；ピラゾリルメチル基、ピリジルメチル基などの5～6員ヘテロアリールC 1～6 アルキル基を挙げることができる。

C 6～10 アリールカルボニル基としては、カルボニル基に、C 6～10 アリール基が結合したものである。C 6～10 アリールカルボニル基としては、ベンゾイル基などを挙げることができる。

【0056】

C 2～6 アルケニルオキシカルボニル基としては、ビニルオキシカルボニル基、1-プロペニルオキシカルボニル基、2-プロペニルオキシカルボニル基(アリルオキシカルボニル基)などを挙げることができる。

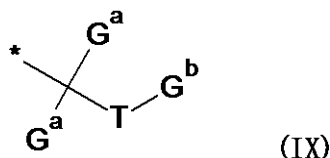
C 1～6 アルキルアミノカルボニル基としては、メチルアミノカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基などを挙げることができる。

(C 1～6 アルキルチオ)カルボニル基としては、(メチルチオ)カルボニル基、(エチルチオ)カルボニル基などを挙げることができる。

C 1～6 アルキルアミノ(チオカルボニル)基としては、メチルアミノ(チオカルボニル)基、ジメチルアミノ(チオカルボニル)基などを挙げることができる。

【0057】

【化 7】



【0058】

式 (IX) 中、 G^a は、それぞれ独立に、水素原子、無置換のもしくは G^1 で置換された C 1 ～ 6 アルキル基、無置換のもしくは G^1 で置換された C 2 ～ 6 アルケニル基、無置換のもしくは G^1 で置換された C 2 ～ 6 アルキニル基、無置換のもしくは G^2 で置換された C 3 ～ 8 シクロアルキル基、または無置換のもしくは G^2 で置換された C 6 ～ 10 アリール基を示す。

10

式 (IX) 中、 G^b は、水素原子、無置換のもしくは G^1 で置換された C 1 ～ 6 アルキル基、無置換のもしくは G^1 で置換された C 2 ～ 6 アルケニル基、無置換のもしくは G^1 で置換された C 2 ～ 6 アルキニル基、無置換のもしくは G^2 で置換された C 3 ～ 8 シクロアルキル基、無置換のもしくは G^2 で置換された C 6 ～ 10 アリール基、または無置換のもしくは G^2 で置換された 3 ～ 6 員ヘテロシクリル基を示す。

式 (IX) 中、T は、酸素原子、オキシカルボニル基、カルボニルオキシ基、オキシカルボニルオキシ基、硫黄原子、(チオ)カルボニル基、カルボニル(チオ)基、(チオ)カルボニルオキシ基、オキシカルボニル(チオ)基、または $-O-C(=O)-N(G^b)$ で表される二価の基を示す。

20

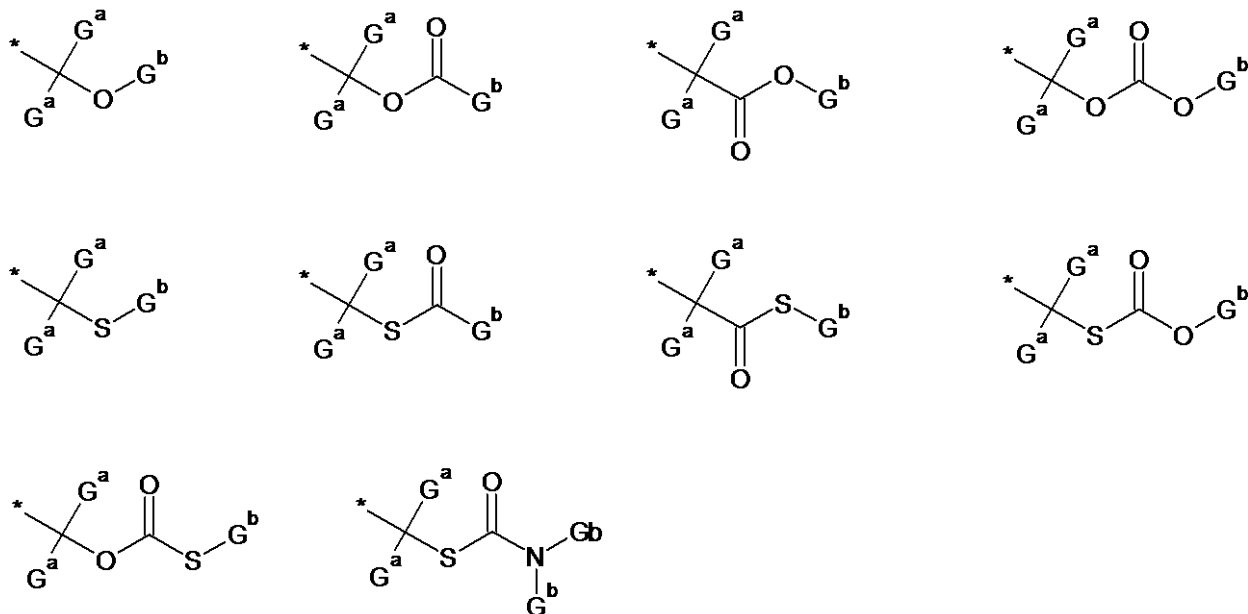
* は式 (IX) で表される基の結合位置を示す。

【0059】

式 (IX) で表される基の例として、次に示すものが挙げられる。

【0060】

【化 8】



30

40

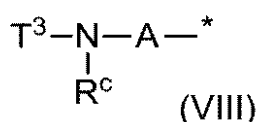
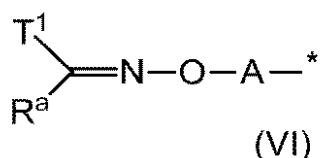
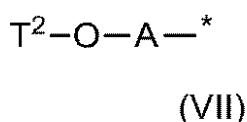
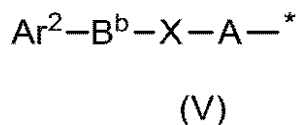
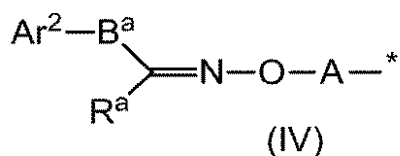
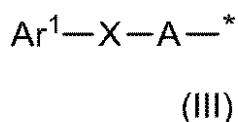
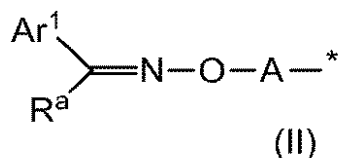
【0061】

〔Q〕

Q は、式 (II) ～ 式 (VIII) で表される有機基のいずれかを示す。なお、* は、式 (II) ～ 式 (VIII) で表される有機基の結合位置を示す。

【0062】

【化 9】



10

【0063】

< R^a >

20

R^aは、水素原子、無置換のもしくはG¹で置換されたC 1～6 アルキル基、無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10 アリール基、またはアミノ基を示す。

R^aにおけるC 1～6 アルキル基、C 6～10 アリール基、置換基G¹および置換基G²はすでに述べたとおりのものである。

R^aとしては、水素原子が好ましい。

A r¹とR^aは、相互に繋がって、A r¹とR^aが結合する炭素原子とともに5～6員環を形成してもよい。A r¹とR^aによって成形される5～6員環としては、シクロペンテン環、シクロヘキセン環などを挙げることができる。

【0064】

< X >

30

Xは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、スルホニル基、または式：N R^cで表される二価の基を示す。

ここで、R^cは、水素原子、無置換のもしくはG¹で置換されたC 1～6 アルキル基、無置換のもしくはG¹で置換されたC 2～6 アルケニル基、無置換のもしくはG¹で置換されたC 1～6 アルキルカルボニル基、無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10 アリールカルボニル基、または無置換のもしくはG¹で置換されたC 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。

R^cにおけるC 1～6 アルキル基、C 6～10 アリール基、C 1～6 アルキルカルボニル基、C 6～10 アリールカルボニル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、置換基G¹および置換基G²はすでに述べたとおりのものである。

40

【0065】

< A >

Aは、無置換のもしくはG³で置換されたC 1～C 6 アルキレン基、無置換のもしくはG³で置換されたC 2～C 6 アルケニレン基、無置換のもしくはG³で置換されたC 2～C 6 アルキニレン基、無置換のもしくはG³で置換されたC 1～C 6 アルキレンオキシ基、無置換のもしくはG³で置換されたオキシC 1～C 6 アルキレン基、またはカルボニル基を示す。AにおけるC 1～C 6 アルキレン基はすでに述べたとおりのものである。

【0066】

C 2～C 6 アルケニレン基は、C 2～C 6 アルケン中の水素原子2個が外れてなる2価の基である。C 2～C 6 アルケニレン基としては、エテニレン基、プロペニレン基、ブテ

50

ニレン基などを挙げることができる。

C 2～C 6 アルキニレン基は、C 2～C 6 アルキン中の水素原子 2 個が外れてなる 2 価の基である。C 2～C 6 アルキニレン基としては、エチニレン基、プロピニレン基、ブチニレン基などを挙げることができる。

C 1～C 6 アルキレンオキシ基としては、メチレンオキシ基 ($-\text{CH}_2\text{O}-$)、エチレンオキシ基 ($-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$) などが挙げられる。

オキシ C 1～C 6 アルキレン基としては、オキシメチレン基 ($-\text{OCH}_2-$)、オキシエチレン基 ($-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$) などが挙げられる。

【0067】

G³は、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、ホルミル基、C 1～6 アルキルカルボニル基、ホルミルオキシ基、C 1～6 アルキルカルボニルオキシ基、ハロゲノ基、C 1～6 アルキレン基、またはオキソ基を示す。G³における、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキルカルボニル基、C 1～6 アルキルカルボニルオキシ基、ハロゲノ基、および C 1～6 アルキレン基はすでに述べたとおりのものである。

【0068】

<A r¹>

A r¹は、無置換の若しくは G²で置換された C 6～10 アリール基、または無置換の若しくは G²で置換された 3～6 員ヘテロシクリル基を示す。A r¹における C 6～10 アリール基、3～6 員ヘテロシクリル基、および置換基 G²はすでに述べたとおりのものである。

【0069】

<A r²>

A r²は、無置換の若しくは G²で置換された C 6～10 アリール基、無置換の若しくは G²で置換された C 6～10 アリールオキシ基、無置換の若しくは G²で置換された 3～6 員ヘテロシクリル基、無置換の若しくは G²で置換された 3～6 員ヘテロシクリルオキシ基、または無置換の若しくは G²で置換された 3～6 員ヘテロシクリルチオ基を示す。

A r²における、C 6～10 アリール基、C 6～10 アリールオキシ基、3～6 員ヘテロシクリル基、3～6 員ヘテロシクリルオキシ基、および置換基 G²はすでに述べたとおりのものである。

【0070】

3～6 員ヘテロシクリルチオ基は、SH 基に 3～6 員ヘテロシクリル基が置換したものである。3～6 員ヘテロシクリルチオ基としては、好ましくは、ピラゾリルチオ基、ピリジルチオ基などの「5～6 員ヘテロアリールチオ基」を挙げることができる。

【0071】

A r²における「3～6 員ヘテロシクリルオキシ基」としては、好ましくは、ピラゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基、ピラジニルオキシ基、ピリミジニルオキシ基などの「5～6 員ヘテロアリールオキシ基」を挙げることができる。

A r²における「3～6 員ヘテロシクリルチオ基」としては、好ましくは、ピラゾリルチオ基、ピリジルチオ基などの「5～6 員ヘテロアリールチオ基」を挙げることができる。

【0072】

<B^a>

B^aは、無置換の若しくは G⁴で置換された C 1～C 6 アルキレン基、無置換の若しくは G⁴で置換された C 2～C 6 アルケニレン基、無置換の若しくは G⁴で置換された C 2～C 6 アルキニレン基、無置換の若しくは G⁴で置換された C 1～C 6 アルキレンオキシ C 1～6 アルキレン基、無置換の若しくは G⁴で置換された C 3～C 6 シクロアルキレン基、無置換の若しくは G⁴で置換された C 4～C 6 シクロアルケニレン基、無置換の若しくは G⁴で置換された 3～6 員ヘテロシクリレン基、または NR^dで表される二価の基を示す。R^dは、水素原子、C 1～6 アルキル基、または C 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。

。

B^aにおける、C 1～C 6 アルキレン基、C 2～C 6 アルケニレン基、および C 2～C 6 アルキニレン基は既に述べたとおりのものである。

R^dにおける、C 1～C 6 アルキル基、および C 1～C 6 アルコキシカルボニル基は既に述べたとおりのものである。

C 1～C 6 アルキレンオキシC 1～6 アルキレン基は、2つのC 1～6 アルキレン基が、酸素原子を介して結合してなる基である。C 1～C 6 アルキレンオキシC 1～6 アルキレン基としては、メチレンオキシメチレン基、メチレンオキシエチレン基、エチレンオキシメチレン基などを挙げることができる。

【0073】

C 3～C 6 シクロアルキレン基は、C 3～C 6 シクロアルカン中の水素原子 2 個が外れてなる 2 価の基である。C 3～C 6 シクロアルキレン基としては、シクロプロピレン基(1, 2-シクロプロピレン基)、シクロブチレン基(1, 2-シクロブチレン基、または 1, 3-シクロペンチレン基)、シクロペンチレン基(1, 2-シクロペンチレン基、または 1, 3-シクロペンチレン基)、シクロヘキシレン基(1, 2-シクロヘキシレン基、1, 3-シクロヘキシレン基、または 1, 4-シクロヘキシレン基)などを挙げることができる。

【0074】

C 4～C 6 シクロアルケニレン基は、C 3～C 6 シクロアルケン中の水素原子 2 個が外れてなる 2 価の基である。C 4～C 6 シクロアルケニレン基としては、シクロブテニレン基(1, 2-シクロブテニレン基、1, 3-シクロブテニレン基、1, 3-シクロブテニレン基、または 3, 4-シクロブテニレン基)、シクロペンテニレン基(1, 2-シクロペンテニレン基、1, 3-シクロペンテニレン基、1, 4-シクロペンテニレン基、または 1, 5-シクロペンテニレン基)、シクロヘキセニレン基(1, 2-シクロヘキセニレン基、1, 3-シクロヘキセニレン基、1, 4-シクロヘキセニレン基、)などを挙げることができる。

3～6 員ヘテロシクリレン基は、ヘテロ脂環式化合物中の水素原子 2 個が外れてなる 2 価の基である。ヘテロ脂環式化合物は、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる 1～4 個のヘテロ原子を環の構成原子として含む非芳香族化合物である。

【0075】

3～6 員ヘテロシクリレン基としては、3～6 員飽和ヘテロシクリレン基または 5～6 員部分不飽和ヘテロシクリレン基などを挙げることができる。

3～6 員ヘテロシクリレン基としては、ジヒドロフリレン基、テトラヒドロフリレン基、ピロリニレン基、ピロリジニレン基、ピラゾリニレン基、ピラゾリジニレン基、イミダゾリニレン基、イミダゾリジニレン基、オキサゾリニレン基、オキサゾリジニレン基、チアゾリニレン基、チアゾリジニレン基、イソオキサゾリジニレン基、イソチアゾリジニレン基、ジヒドロピラニレン基、テトラヒドロピラニレン基、ピペリジニレン基、ピペラジニレン基、モルホリニレン基などを挙げることができる。なお、特定の実施態様においては、3～6 員ヘテロシクリレン基は C 1～6 アルキレン基で、架橋されていてよい。

【0076】

G⁴は、C 1～6 アルキル基、C 3～8 シクロアルキル基、C 1～6 ハロアルキル基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルキル基、C 2～6 アルケニルオキシC 1～6 アルキル基、水酸基、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルコキシC 1～6 アルコキシ基、C 2～6 アルケニルオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、無置換の若しくは G²¹で置換された C 6～10 アリール基、無置換の若しくは G²¹で置換された 3～6 員ヘテロシクリル基、シアノ基、ハロゲノ基、C 1～6 アルキレン基、C 1～6 アルキレンジオキシ基、オキソ基、C 3～8 シクロアルキルC 1～6 アルキル基、無置換の若しくは G²¹で置換された C 6～10 アリールC 1～6 アルキル基、無置換の若しくは G²¹で置換された 3～6 員ヘテロシクリルC 1～6 アルキル基、C 3～8 シクロアルキルオキシC 1～6 アルキル基、無置換の若しくは G²¹で置換された C 6～10 アリールオキシC 1～6 アルキル基、無置換の若しくは G²¹で置換された 3～6 員ヘテロシクリルオキシC 1～6 アルキル基、C

1～6アルキリデン基、C 1～6アルコキシイミノ基、無置換の若しくはG²¹で置換されたC 6～10アリアルC 1～6アルコキシイミノ基、またはC 1～6アルキルヒドラジノ基を示す。

【0077】

G⁴における、C 1～6アルキル基、C 3～8シクロアルキル基、C 1～6ハロアルキル基、C 1～6アルコキシC 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、C 1～6アルキレンジオキシ基、C 6～10アリアル基、3～6員ヘテロシクリル基、ハロゲノ基、C 1～6アルキレン基、および置換基G²¹は既に述べたとおりのものである。

【0078】

C 2～6アルケニルオキシ基は、水酸基に、C 2～6アルケニル基が置換したものである。C 2～6アルケニルオキシ基としては、ビニルオキシ基、1-プロペニルオキシ基、2-プロペニルオキシ基（アリルオキシ基）などを挙げることができる。

C 2～6アルケニルオキシC 1～6アルキル基は、C 1～6アルキル基に、C 2～6アルケニルオキシ基が置換したものである。C 2～6アルケニルオキシC 1～6アルキル基としては、ビニルオキシメチル基、アリルオキシメチル基などを挙げることができる。

C 3～8シクロアルキルC 1～6アルキル基としては、シクロプロピルメチル基、シクロペンチルメチル基などを挙げることができる。

C 6～10アリアルC 1～6アルキル基としては、ベンジル基、フェネチル基などを挙げることができる。

【0079】

3～6員ヘテロシクリルC 1～6アルキル基としては、好ましくは、テトラヒドロフランメチル基、テトラヒドロピラニルメチル基、ジオキサニルメチル基、ジオキサニルメチル基などの5～6員飽和ヘテロシクリルC 1～6アルキル基；ピラゾリルメチル基、ピリジルメチル基などの5～6員ヘテロアリアルC 1～6アルキル基を挙げることができる。

C 3～8シクロアルキルオキシC 1～6アルキル基としては、シクロプロピルオキシメチル基、シクロヘキシルオキシメチル基などを挙げることができる。

【0080】

C 6～10アリアルオキシC 1～6アルキル基としては、フェノキシメチル基、ナフチルオキシメチル基などを挙げることができる。

【0081】

3～6員ヘテロシクリルオキシC 1～6アルキル基としては、好ましくは、ピラゾリルオキシメチル基、ピリジルオキシメチル基などの5～6員ヘテロアリアルメチル基を挙げることができる。

C 1～6アルキリデン基としては、メチリデン基、プロパン-2-イリデン基などを挙げることができる。

C 1～6アルコキシイミノ基としては、メトキシイミノ基（MeO-N=）、エトキシイミノ基（EtO-N=）などを挙げることができる。

C 6～10アリアルC 1～6アルコキシイミノ基としては、ベンジルオキシイミノ基（BnO-N=）などを挙げることができる。

C 1～6アルキルヒドラジノ基としては、メチルヒドラジノ基（MeNH-N=）、エチルヒドラジノ基（EtNH-N=）などを挙げることができる。

【0082】

また、B^aとR^aは、相互に繋がって、B^aとR^aが結合する炭素原子とともに5～6員環を形成してもよい。B^aとR^aによって形成される5～6員環としては、シクロペンテン環、シクロヘキセン環などを挙げることができる。

【0083】

<T¹～T³>

T¹は、（無置換のもしくはG²で置換されたC 6～10アリアルC 1～6アルコキシイ

10

20

30

40

50

ミノ)ーメチル基、1ー(無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシイミノ)ーエチル基、または無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシ基を示す。

T^2 は、(無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル)ーアミノ基、(無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル)ーホルミルーアミノ基、(無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル)ーC 1～6アルキルカルボニルーアミノ基、(無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシ)ーC 1～6アルキル基、または(無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルキル)ー3～6員ヘテロシクリル基を示す。

10

T^3 は、無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールC 1～6アルコキシ基、または無置換のもしくは G^2 で置換されたC 6～10アリールアミノカルボニルーC 1～6アルキル基を示す。

【0084】

T^1 における「(C 6～10アリールC 1～6アルコキシイミノ)ーメチル基」としては、ベンジルオキシイミノーメチル基などを挙げることができる。

T^1 における「1ー(C 6～10アリールC 1～6アルコキシイミノ)ーエチル基」としては、1ー(ベンジルオキシイミノ)ーエチル基などを挙げることができる。

T^1 における「C 6～10アリールC 1～6アルコキシ基」としては、ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、2ーフェニルー1ーメチルプロポキシ基などを挙げることができる。

20

【0085】

T^2 における「(C 6～10アリールC 1～6アルキル)ーアミノ基」としては、ベンジルアミノ基などを挙げることができる。

T^2 における「(C 6～10アリールC 1～6アルキル)ーホルミルーアミノ基」としては、ベンジルーホルミルアミノ基などを挙げることができる。

T^2 における「(C 6～10アリールC 1～6アルキル)ーC 1～6アルキルカルボニルーアミノ基」としては、ベンジルーアセチルアミノ基などを挙げることができる。

T^2 における「(C 6～10アリールC 1～6アルコキシ)ーC 1～6アルキル基」としては、ベンジルオキシメチル基、2ーベンジルオキシー1ーメチルプロピル基などを挙げることができる。

30

T^2 における「(C 6～10アリールC 1～6アルキル)ー3～6員ヘテロシクリル基」としては、1ーベンジルーピロリジンー3ーイル基などを挙げることができる。

【0086】

T^3 における「C 6～10アリールC 1～6アルコキシ基」としては、ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、2ーフェニルー1ーメチルプロポキシ基などを挙げることができる。

T^3 における「C 6～10アリールアミノカルボニルーC 1～6アルキル基」としては、1ーフェニルカルバモイルー2ーメチルプロピル基などを挙げることができる。

40

【0087】

本発明に係るピリジン化合物には、水和物、各種溶媒和物や結晶多形なども含まれる。さらに、本発明に係るピリジン化合物は、不斉炭素原子、二重結合などに基づく立体異性体およびそれらの混合物、互変異性体を包含する。

【0088】

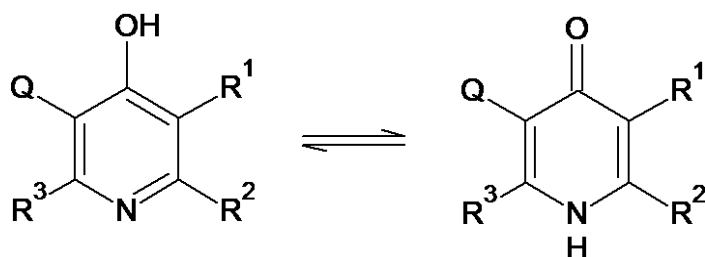
〔互変異性体〕

本発明に係るピリジン化合物は、 R^4 が水素原子である場合、以下に示す互変異性体ピリジンー4ーオン化合物を生じる。なお、式中の R^1 、 R^2 、 R^3 、およびQは、式(I)中の規定と同様の意味を示す。本発明は、当該互変異性体ピリジンー4ーオン化合物を包含する。

【0089】

50

【化 10】



【0090】

〔立体異性体〕

10

本発明は、同一の構造式で表される化合物であるが、構造中の原子または置換基の空間的配置が異なる化合物、例えば、光学異性体、ジアステレオ異性体、幾何異性体などの全ての立体異性体を包含する。立体異性体は、単一物であっても混合物であってもよい。

【0091】

〔塩〕

本発明に係る化合物（I）の塩としては、農園芸学的に許容される塩であれば、特に制限されない。例えば、塩酸、硫酸などの無機酸の塩；酢酸、乳酸などの有機酸の塩；リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属の塩；カルシウム、マグネシウムなどのアルカリ土類金属の塩；鉄、銅などの遷移金属の塩；アンモニア、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ヒドラジンなどの有機塩基の塩などを挙げることができる。化合物（I）の塩は、化合物（I）から公知の手法によって得ることができる。

20

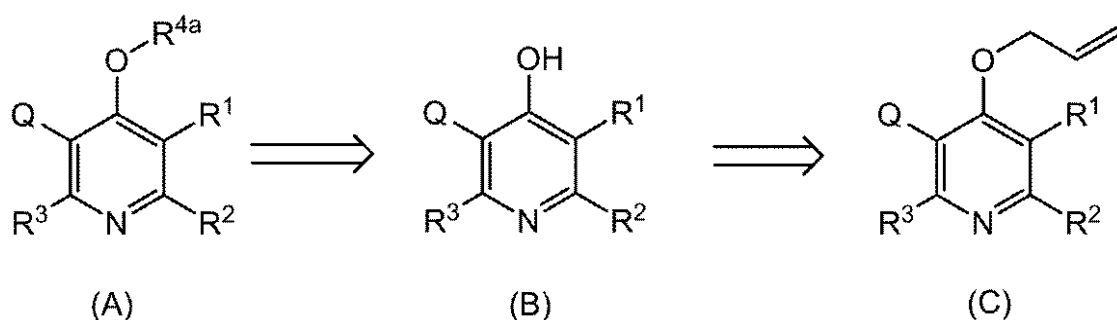
【0092】

〔製造中間体〕

式（I）中の R^4 が、水素原子またはアリル基である化合物は、本発明においては、製造中間体として有用である。

【0093】

【化 11】



30

【0094】

逆合成の概念を示す上記の式中、 R^{4a} は、上記の R^4 のうちで、水素原子およびアリル基以外の有機基を示す。 $R^1 \sim R^3$ 、および Q は、上記の規定と同様の意味を示す。

式（A）で表される化合物は、化合物（I）のうちで、 R^4 が、水素原子およびアリル基以外の有機基である化合物を示す（以下、化合物（A）とすることがある。）。

40

式（B）で表される化合物は、化合物（I）のうちで、 R^4 が、水素原子である化合物を示し（以下、化合物（A）とすることがある。））、化合物（B）は、化合物（A）を製造する際の製造中間体となりうる。

化合物（A）は、式： $R^{4a}-L$ で表される試薬、式： $(R^{4a})_2O$ で表される試薬などを用いることで、化合物（B）から製造できる。ここで、 L は、ハロゲノ基などの脱離基を示す。

式（C）で表される化合物は、化合物（I）のうちで、 R^4 が、アリル基である化合物を示し（以下、化合物（C）とすることがある。））、化合物（C）は、化合物（B）を製造する際の製造中間体となりうる。

50

化合物（B）は、通常のアリル基の脱保護法、例えば、接触還元法、パラジウム触媒（テトラキストリフェニルホスフィンパラジウムやジベンジリデンアセトンパラジウムを用いる方法により、化合物（C）から製造できる。

【0095】

〔農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫若しくは殺ダニ剤〕

本発明の農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫若しくは殺ダニ剤は、化合物（I）化合物（I）の互変異性体若しくは化合物（I）の塩（以下、これらを「本発明化合物」ということがある。）から選ばれる少なくとも1つを有効成分として含有するものである。

【0096】

本発明の農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫若しくは殺ダニ剤は、剤型によって特に限定されない。たとえば、水和剤、乳剤、水溶剤、顆粒水和剤、粉剤、錠剤などの剤型を挙げることができる。製剤への調製方法は、特に制限されず、剤形に応じて公知の調製方法を採用することができる。

【0097】

本発明の農園芸用殺菌剤は、広範囲の種類の糸状菌、例えば、藻菌類（Oomycetes）、子のう（嚢）菌類（Ascomycetes）、不完全菌類（Deuteromycetes）、担子菌類（Basidiomycetes）に属する菌に対し優れた殺菌力を有する。

【0098】

本発明の殺虫若しくは殺ダニ剤は、植物の生育に影響する各種の農業害虫およびダニ類などの有害生物の防除効果に優れている。本発明の殺虫若しくは殺ダニ剤は、感受性系統のみならず、従来の薬剤、たとえば、有機リン剤やカーバメート剤に対する抵抗性が発達した系統の害虫にも有効である。抵抗性系統の害虫の代表例としては、コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシなどを挙げることができる。

【0099】

本発明の有害生物防除剤は、農業害虫、ダニ類以外の有害生物の防除に効果を示す。有害生物として、たとえば、外部寄生虫、衛生害虫などを挙げることができる。

【0100】

本発明の農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫若しくは殺ダニ剤が、対象として得る植物としては、穀物類、野菜類、根菜類、イモ類、樹木類、牧草類、芝類などを挙げることができる。

本発明の農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫若しくは殺ダニ剤は、植物類の各部位、たとえば、葉、茎、柄、花、蕾、果実、種子、スプラウト、根、塊茎、塊根、苗条、挿し木などに施用することができる。また、これら植物類の改良品種・変種、栽培品種、さらには突然変異体、ハイブリッド体、遺伝子組み換え体（GMO）を対象とすることもできる。

【0101】

本発明の農園芸用殺菌剤は、花卉、芝、牧草を含む農園芸作物に発生する種々の病害の防除をするために行われる種子処理、茎葉散布、土壌施用、水面施用などに使用することができる。

【0102】

〔外部寄生虫防除剤〕

本発明化合物は、人獣に害を及ぼす外部寄生虫の防除効果に優れている。また、薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低いため、安全性の高い化合物である。そのため、外部寄生虫防除剤の有効成分として有用である。

外部寄生虫としては、ダニ類、シラミ類、ノミ類などが挙げられる。

本発明の外部寄生虫防除剤の処理の対象となる宿主動物としては、イヌ、ネコなどの愛玩動物；愛玩鳥；ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジなどの家畜；家禽；などの温血動物が挙げられる。その他にも、ミツバチが挙げられる。

外部寄生虫は、宿主動物、特に温血動物の中および上に寄生する。詳しくは、宿主動

10

20

30

40

50

物の背、脇下、下腹部、内股部などに寄生して動物から血液やフケなどの栄養源を得て生息する。

本発明の外部寄生虫防除剤は、公知の獣医学的な手法（局所、経口、非経口または皮下投与）で施用することができる。その方法として、錠剤、カプセル、飼料混入などにより動物に経口的に投与する方法；浸漬液、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内など）などにより動物に投与する方法；油性または水性液剤を噴霧、ボアオン、スポットオンなどにより局所的に投与する方法；樹脂に外部寄生虫防除剤を練り込み、前記混練物を首輪、耳札などの適当な形状に成形し、それを動物に装着し局所的に投与する方法；などが挙げられる。

【0103】

10

本発明の農園芸用殺菌剤、有害生物防除剤、および殺虫若しくは殺ダニ剤は、殺菌、殺虫・殺ダニ、殺線虫、殺土壌害虫などの効果を有する他の農園芸用薬剤；植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料などと混用または併用してもよい。

【0104】

次に、製剤実施例を若干示す。なお、以下に示す製剤処方単なる例示であり、本発明の主旨に反しない範囲で修正することができ、本発明は以下の製剤実施例によって何ら制限されるものではない。「部」は特段の断りが無い限り「質量部」を意味する。

【0105】

（製剤1：水和剤）

本発明化合物	40部
珪藻土	53部
高級アルコール硫酸エステル	4部
アルキルナフタレンスルホン酸塩	3部

20

以上を均一に混合して微細に粉碎して、有効成分40%の水和剤を得た。

【0106】

（製剤2：乳剤）

本発明化合物	30部
キシレン	33部
ジメチルホルムアミド	30部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	7部

30

以上を混合溶解して、有効成分30%の乳剤を得た。

【0107】

（製剤3：粒剤）

本発明化合物	5部
タルク	40部
クレー	38部
ベントナイト	10部
アルキル硫酸ソーダ	7部

以上を均一に混合して微細に粉碎後、直径0.5～1.0mmの粒状に造粒して有効成分5%の粒剤を得る。

40

【0108】

（製剤4：粒剤）

本発明化合物	5部
クレー	73部
ベントナイト	20部
ジオクチルスルホサキシネートナトリウム塩	1部
リン酸カリウム	1部

以上をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分5%の粒剤を得る。

【0109】

50

(製剤 5 : 懸濁剤)

本発明化合物	10 部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	4 部
ポリカルボン酸ナトリウム塩	2 部
グリセリン	10 部
キサントガム	0.2 部
水	73.8 部

以上を混合し、粒度が 3 ミクロン以下になるまで湿式粉碎し、有効成分 10 % の懸濁剤を得る。

以下に外部寄生虫防除剤の製剤処方を示す。

10

【0110】

(製剤 6 : 顆粒)

本発明化合物	5 部
カオリン	94 部
ホワイトカーボン	1 部

本発明化合物を有機溶媒中で溶解させ、担体上へ噴霧した後、溶媒を減圧下蒸発させる。この種の顆粒は動物の餌と混合できる。

【0111】

(製剤 7 : 注入剤)

本発明化合物	0.1 ~ 1 部
ラッカセイ油	バランス

20

調製後は、滅菌フィルターによりろ過滅菌する。

【0112】

(製剤 8 : ポアオン剤)

本発明化合物	5 部
ミリスチン酸エステル	10 部
i-プロパノール	バランス

【0113】

(製剤 9 : スポットオン剤)

本発明化合物	10 ~ 15 部
パルミチン酸エステル	10 部
i-プロパノール	バランス

30

【0114】

(製剤 10 : スプレーオン剤)

本発明化合物	1 部
プロピレングリコール	10 部
i-プロパノール	バランス

【0115】

次に、化合物実施例を示し、本発明をより具体的に説明する。ただし、本発明は以下の化合物実施例によって何ら制限されるものではない。

40

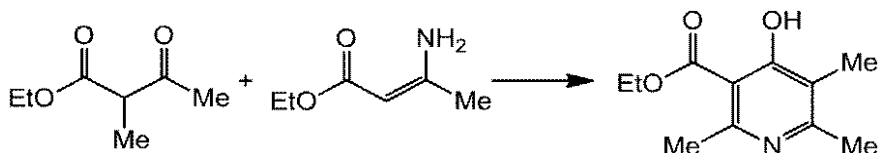
【0116】

〔実施例 1〕 メチル[2, 3, 6-トリメチル-5-[[4-(4-トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロヘキソキシ]-4-ピリジル]カーボネートの製造

(工程 1) 4-ヒドロキシ-2, 5, 6-トリメチルニコチン酸エチルの合成

【0117】

【化 12】



50

【0118】

3-アミノクロトン酸エチル 45 g および 2-メチルアセト酢酸エチル 50 g をキシレン 100 ml に溶解させた。この溶液を一晩加熱還流した。次いで、反応液を室温まで冷却して、析出した結晶をろ過、ジエチルエーテルで洗浄し、乾燥させて、目的化合物 24.2 g (収率 33%) を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm})$ 1.21(3H, t), 2.14(3H, s), 2.46(3H, s), 2.71(3H, s), 4.45(2H, q), 12.14(3H, s)

【0119】

(工程 2) 4-アリルオキシ-2, 5, 6-トリメチルニコチン酸エチルの合成

4-ヒドロキシ-2, 5, 6-トリメチルニコチン酸エチル 12.2 g をアセトニトリル 120 ml に溶解させた。この溶液に、炭酸カリウム 16.1 g を加え、次いで臭化アリル 14.1 g を加え、8 時間加熱還流した。次いで、反応液を室温まで冷却し、水に注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去して、目的化合物 10.0 g (収率 77%) を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm})$ 1.36(3H, t), 2.15(3H, s), 2.46(6H, s), 4.35-4.40(5H, m), 5.25-5.39(2H, m), 5.92-6.11(1H, m)

【0120】

(工程 3) (4-アリルオキシ-2, 5, 6-トリメチルピリジン-3-イル)-メタノールの合成

水素化リチウムアルミニウム 2.8 g をテトラヒドロフラン 300 ml に加えた。この液に、氷冷下、4-メトキシ-2, 5, 6-トリメチルニコチン酸エチル 10.0 g を滴下した。滴下終了後、室温で 2 時間攪拌した。その後、反応液を氷冷し、未反応の水素化リチウムナトリウムが分解されるまで水を加えた。次いで、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、溶媒を減圧留去して、目的化合物 7.9 g (収率 97%) を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm})$ 2.18(3H, s), 2.45(3H, s), 2.56(3H, s), 4.38(2H, d), 4.70(2H, s), 5.25-5.39(2H, m), 5.92-6.11(1H, m)

【0121】

(工程 4) 4-アリルオキシ-3-(クロロメチル)-2, 5, 6-トリメチルピリジンの合成

(4-メトキシ-2, 5, 6-トリメチルピリジン-3-イル)-メタノール 7.9 g をジクロロメタン 100 ml に溶解させた。この溶液に、氷冷下、塩化チオニル 9.0 g を滴下した。滴下終了後、室温で 2 時間攪拌した。その後、反応液を飽和重曹水に注加し、次いでジクロロメタンで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した。分液して、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去して、目的化合物 7.7 g (収率 90%) を得た。

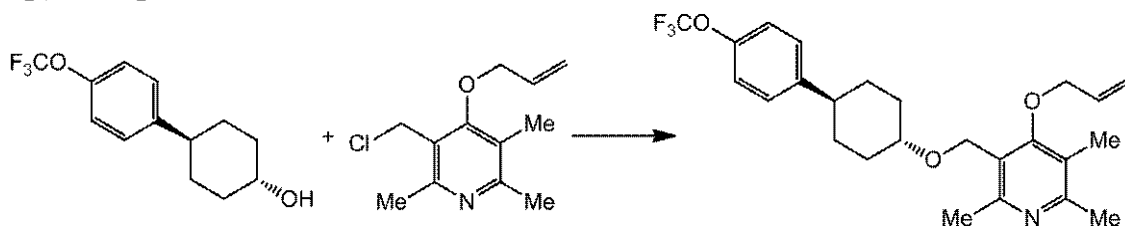
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm})$ 2.16(3H, s), 2.46(3H, s), 2.57(3H, s), 4.42(2H, d), 4.67(2H, s), 5.32-5.49(2H, m), 6.06-6.14(1H, m)

【0122】

(工程 5) 4-アリルオキシ-2, 3, 6-トリメチル-5-[[4-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロヘキソキシ]ピリジン]の合成

【0123】

【化 13】



【0124】

4-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロヘキサノール 5.24 g を N, N

10

20

30

40

50

ージメチルホルムアミド 50 ml に溶解させた。この溶液に氷冷下で 55% 水素化ナトリウム 2.2 g を加えた。次いで、室温で 1 時間攪拌した。得られた反応液に、氷冷下で、4-アリルオキシ-3-(クロロメチル)-2,5,6-トリメチルピリジン 6.82 g の N,N-ジメチルホルムアミド溶液 (10 ml) を滴下した。滴下終了後、室温で 2 時間攪拌、次いで 50℃ で一晩攪拌した。得られた反応液を氷水に注加し、次いでジクロロメタンで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した。分液して、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒: n-ヘキサン/酢酸エチル) にて精製して、目的化合物 7.39 g (収率 82%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 1.38-1.51(4H, m), 1.88-2.26(7H, m), 2.44-2.55(7H, m), 3.37-3.48(1H, m), 4.39(2H, d), 4.55(2H, s), 5.29-5.46(2H, m), 6.04-6.14(1H, m), 7.10-7.21(4H, m)

【0125】

(工程 6) 2,3,6-トリメチル-5-[[4-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロヘキソキシ]メチル]ピリジン-4-オール の合成

4-アリルオキシ-2,3,6-トリメチル-5-[[4-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロヘキソキシ]ピリジン] 0.5 g をメタノール 10 ml に溶解させた。この溶液にテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 0.03 g、および炭酸カリウム 0.31 g を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、次いでクロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した。分液して、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄して、目的化合物 0.4 g (収率 88%) を得た。

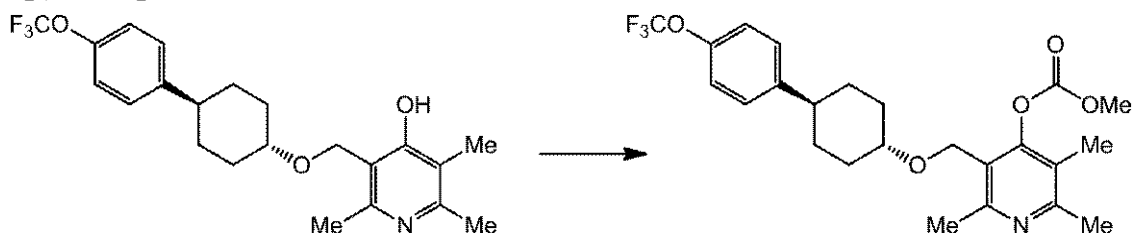
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 1.31-1.49(2H, m), 1.84-2.55(14H, m), 3.33-3.42(1H, m), 4.59(2H, s), 7.08-7.17(4H, m)

【0126】

(工程 7) メチル[2,3,6-トリメチル-5-[[4-(4-トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロヘキソキシ]-4-ピリジル]カーボネートの合成

【0127】

【化 14】



【0128】

2,3,6-トリメチル-5-[[4-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロヘキソキシ]メチル]ピリジン-4-オール 0.4 g をクロロホルム 10 ml に溶解させた。この溶液にトリエチルアミン 0.12 g を加えた。その後、氷冷下、クロロギ酸メチル 0.11 g を加えた。室温で一晩攪拌した。得られた反応液を飽和重曹水に注ぎ、クロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒: n-ヘキサン/酢酸エチル) にて精製して、目的化合物 0.41 g (収率 90%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 1.31-1.51(2H, m), 1.89-2.58(14H, m), 3.29-3.37(1H, m), 3.91(3H, s), 4.52(2H, s), 7.10-7.20(4H, m)

【0129】

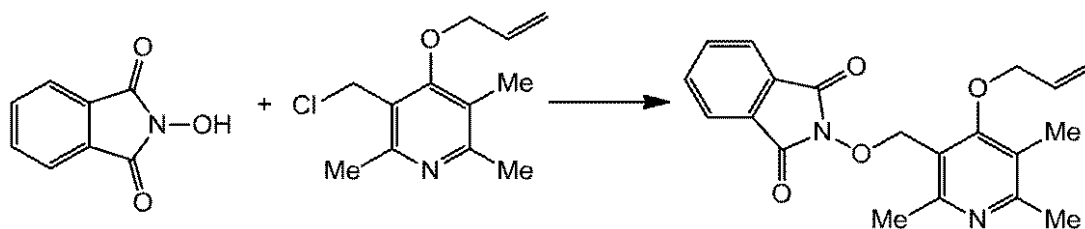
〔実施例 2〕 3-[[2-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-メチルプロピリデン]アミノ]オキシメチル]-2,5,6-トリメチル-4-ピリジル]アセテートの製造

(工程 1) 2-[(4-アリルオキシ-2,5,6-トリメチル-3-ピリジル)メトキ

シ]イソインドリン-1, 3-ジオンの合成

【0130】

【化15】



【0131】

N-ヒドロキシフタルイミド 3.73 g と 4-アリルオキシ-3-(クロロメチル)-2,5,6-トリメチルピリジン 4.29 g を N,N-ジメチルホルムアミド 100 ml に溶解させた。この溶液に、氷冷下で、トリエチルアミン 4.22 g を加えた。室温で一晩攪拌した。得られた反応液を氷水に注加した。析出した結晶をろ過、乾燥させて、目的化合物 4.54 g (収率 68%) を得た。

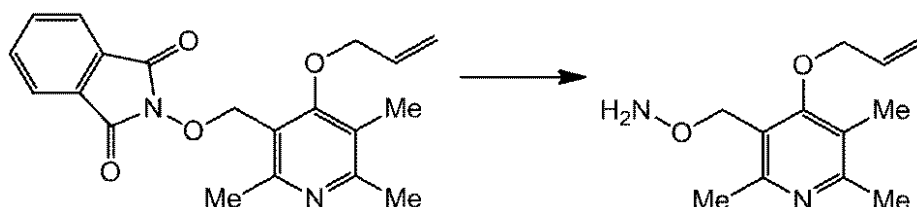
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 2.17(3H,s), 2.48(3H,s), 2.75(3H,s), 4.63(2H,d), 5.29(2H,s), 5.31-5.54(2H,m), 6.13-6.25(1H,m), 7.74-7.83(4H,m)

【0132】

(工程2) O-[(4-アリルオキシ-2,5,6-トリメチル-3-ピリジル)メチル]ヒドロキシルアミンの合成

【0133】

【化16】



【0134】

2-[(4-アリルオキシ-2,5,6-トリメチル-3-ピリジル)メトキシ]イソインドリン-1,3-ジオン 2.00 g をジクロロメタン 40 ml に溶解させた。この溶液に、氷冷下で、メチルヒドラジン 0.53 g を加え、0℃で2時間攪拌した。析出した結晶を濾別し、濾液を減圧濃縮して目的化合物 1.43 g (収率 100%) を得た。

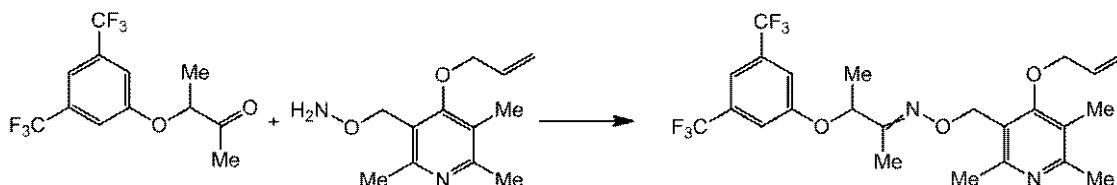
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 2.16(3H,s), 2.46(3H,s), 2.57(3H,s), 4.38(2H,d), 4.75(2H,s), 5.29-5.45(2H,m), 6.04-6.14(1H,m)

【0135】

(工程3) N-[(4-アリルオキシ-2,5,6-トリメチル-3-ピリジル)メトキシ]-3-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]ブタン-2-イミンの合成

【0136】

【化17】



なお、化学式中のオキシム部の炭素-窒素二重結合を表わす交差した二本線は、E 配向および/または Z 配向が存在することを示している。

【0137】

10

20

30

40

50

3-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]ブタン-2-オン 1.11 g をジクロロメタン 10 ml に溶解させた。この溶液に、氷冷下で、O-[(4-アリルオキシ-2, 5, 6-トリメチル-3-ピリジル)メチル]ヒドロキシルアミン 0.54 g およびトリフルオロ酢酸数滴を加え、室温で一晩攪拌した。得られた反応液から溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: n-ヘキサン/酢酸エチル)にて精製して、目的化合物 0.97 g (収率 76%) を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm})$ 1.39-1.57(3H, m), 1.73(3H, m), 2.10-2.47(9H, m), 4.32-4.41(2H, m), 4.96-5.58(5H, m), 5.97-6.13(1H, m), 7.19-7.46(3H, m)

【0138】

(工程4) 3-[[2-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-メチルプロピリデン]アミノ]オキシメチル]-2, 5, 6-トリメチル-ピリジン-4-オール

10

の合成
N-[(4-アリルオキシ-2, 5, 6-トリメチル-3-ピリジル)メトキシ]-3-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]ブタン-2-イミン 0.97 g をメタノール 20 ml に溶解させた。この溶液にテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 0.022 g および炭酸カリウム 0.78 g を加え、室温で2時間攪拌した。得られた反応液を氷水に注ぎ、クロロホルムで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄して、目的化合物 0.82 g (収率 92%) を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm})$ 1.39-1.53(3H, m), 1.67-1.73(3H, m), 2.00-2.28(9H, m), 4.91-5.58(3H, m), 7.18-7.40(3H, m)

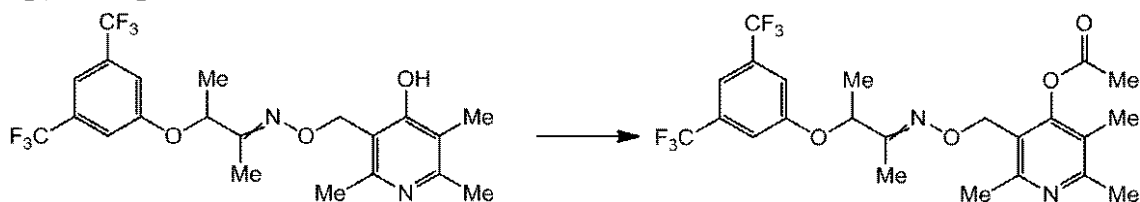
20

【0139】

(工程5) [3-[[2-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-メチルプロピリデン]アミノ]オキシメチル]-2, 5, 6-トリメチル-4-ピリジル]アセテートの合成

【0140】

【化18】



30

【0141】

3-[[2-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-メチルプロピリデン]アミノ]オキシメチル]-2, 5, 6-トリメチル-ピリジン-4-オール 0.82 g をクロロホルム 10 ml に溶解させた。この溶液にトリエチルアミン 0.21 g を加えた。次いで、氷冷下、塩化アセチル 0.17 g を加えた。室温で一晩攪拌した。反応液を飽和重曹水に注ぎ、クロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: n-ヘキサン/酢酸エチル)にて精製し、目的化合物 0.65 g (収率 72%) を得た。

40

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm})$ 1.39-1.53(3H, m), 1.67-1.73(3H, m), 2.03-2.50(12H, m), 4.91-5.52(3H, m), 7.21-7.44(3H, m)

【0142】

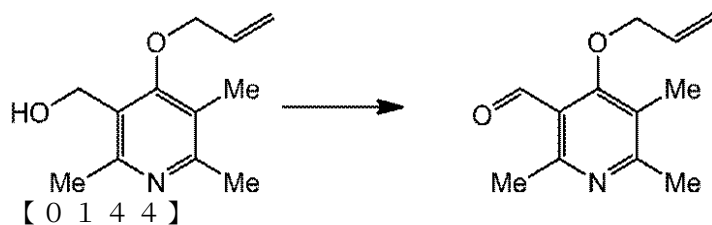
(実施例3) [3-[(E)-3-[[2, 4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロプ-1-エニル]-2, 5, 6-トリメチル-4-ピリジル]メチルカーボネートの製造

(工程1) 4-アリルオキシ-2, 5, 6-トリメチルピリジン-3-カルバルデヒドの合成

【0143】

50

【化 19】



(4-メトキシ-2,5,6-トリメチルピリジン-3-イル)-メタノール 7.9 g をベンゼン 90 ml に溶解させた。この溶液に、二酸化マンガン 15.2 g を加え、一晚加熱還流した。反応液を室温まで冷却し、セライトろ過した。ろ液を減圧濃縮して、目的化合物 5.98 g (収率 77%) を得た。

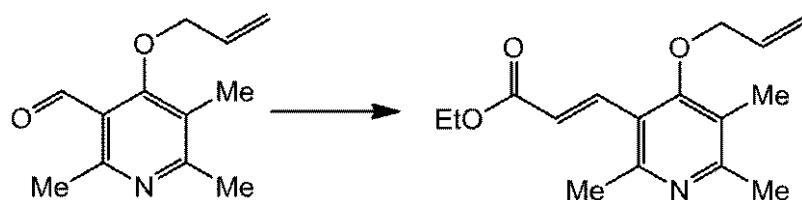
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 2.20(3H,s), 2.51(3H,s), 2.73(3H,s), 4.42(2H,d), 5.25-5.39(2H,m), 5.92-6.11(1H,m), 10.48(1H,s)

【 0 1 4 5 】

(工程 2) エチル(E)-3-(4-アリルオキシ-2,5,6-トリメチル-3-ピリジル)プロプ-2-エノエートの合成

【 0 1 4 6 】

【化 20】



【 0 1 4 7 】

ジエチルホスホ酢酸エチル 8.2 g をテトラヒドロフラン 80 ml に溶解させた。この溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム 1.4 g を加えた。0℃で30分間攪拌した。その後、4-アリルオキシ-2,5,6-トリメチルピリジン-3-カルバルデヒド 5.0 g を滴下した。滴下終了後、室温で2時間攪拌した。得られた反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した。分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:n-ヘキサン/酢酸エチル)にて精製して、目的化合物 4.21 g (収率 64%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 1.33(3H,t), 2.17(3H,s), 2.46(3H,s), 2.57(3H,s), 4.23-4.28(4H,m), 5.28-5.40(2H,m), 5.96-6.05(1H,m), 6.54(1H,d), 7.80(1H,d)

【 0 1 4 8 】

(工程 3) (E)-3-(4-アリルオキシ-2,5,6-トリメチル-3-ピリジル)プロプ-2-エン-1-オールの合成

エチル(E)-3-(4-アリルオキシ-2,5,6-トリメチル-3-ピリジル)プロプ-2-エノエート 4.21 g をジクロロメタン 100 ml に溶解させた。この溶液に、寒剤冷却下、1N水素化ジイソブチルアルミニウムトルエン溶液 30 ml を滴下した。滴下終了後、0℃で2時間攪拌した。その後、反応液を水酸化ナトリウム水溶液に注加した。ジクロロメタンで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去して、目的化合物 3.3 g (収率 96%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 2.16(3H,s), 2.44(3H,s), 2.48(3H,s), 4.24-4.33(4H,m), 5.22-5.40(2H,m), 5.97-6.06(1H,m), 6.28-6.37(1H,m), 6.58(1H,d)

【 0 1 4 9 】

(工程 4) 4-アリルオキシ-3-[(E)-3-ブロモプロプ-1-エニル]-2,5,6-トリメチルピリジンの合成

10

20

30

40

50

(E) - 3 - (4 - アリルオキシ - 2, 5, 6 - トリメチル - 3 - ピリジル) プロプ - 2 - エン - 1 - オール 3. 58 g をジクロロメタン 70 ml に溶解させた。この溶液に、氷冷下、四臭化炭素 5.34 g およびトリフェニルホスフィン 4.22 g を加え、室温で一晩攪拌した。得られた反応液から溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：n-ヘキサン／酢酸エチル）にて精製して、目的化合物 3.5 g（収率 79%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 2.15(3H, s), 2.44(3H, s), 2.50(3H, s), 4.15(3H, d), 4.26(2H, d), 5.24-5.41(2H, m), 5.99-6.08(1H, m), 6.39-6.47(1H, m), 6.24(1H, d)

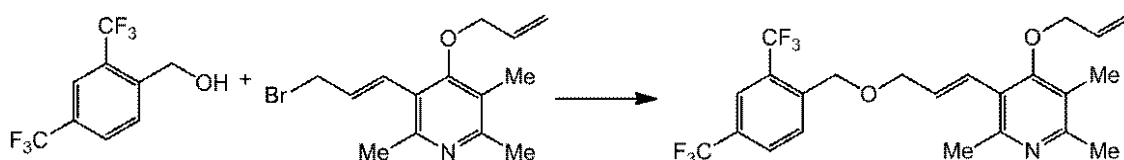
【0150】

(工程 5) 4 - アリルオキシ - 3 - [(E) - 3 - [[2, 4 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロプ - 1 - エニル] - 2, 5, 6 - トリメチルピリジンの合成

10

【0151】

【化 21】



【0152】

2, 4 - ビストリフルオロメチルベンジルアルコール 0.73 g を N, N - ジメチルホルムアミド 5 ml およびテトラヒドロフラン 5 ml からなる混合溶媒に溶解させた。この溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム 0.13 g を加えた。室温で 30 分間攪拌した。得られた反応液に、氷冷下で、4 - アリルオキシ - 3 - [(E) - 3 - ブロモプロプ - 1 - エニル] - 2, 5, 6 - トリメチルピリジン 0.6 g を滴下した。滴下終了後、室温で一晩攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した。分液して、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：n-ヘキサン／酢酸エチル）にて精製し、目的化合物 0.6 g（収率 65%）を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 2.16(3H, s), 2.44(3H, s), 2.50(3H, s), 4.26-4.29(4H, m), 4.81(2H, s), 5.18-5.38(2H, m), 5.95-6.05(1H, m), 6.24-6.68(2H, m), 7.81-7.95(3H, m)

30

【0153】

(工程 6) 3 - [(E) - 3 - [[2, 4 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロプ - 1 - エニル] - 2, 5, 6 - トリメチルピリジン - 4 - オールの合成

4 - アリルオキシ - 3 - [(E) - 3 - [[2, 4 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロプ - 1 - エニル] - 2, 5, 6 - トリメチルピリジン 0.52 g をメタノール 10 ml に溶解させた。この溶液にテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム 0.01 g および炭酸カリウム 0.31 g を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した。分液して、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄して、目的化合物 0.35 g（収率 82%）を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 2.00(3H, s), 2.27(3H, s), 2.36(3H, s), 4.24(2H, d), 4.77(2H, s), 6.57-7.03(2H, m), 7.79-7.95(3H, m)

【0154】

(工程 7) [3 - [(E) - 3 - [[2, 4 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロプ - 1 - エニル] - 2, 5, 6 - トリメチル - 4 - ピリジル]メチルカーボネートの合成

【0155】

【化 2 2】



【0156】

3-[(E)-3-[[2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロプ
 -1-エニル]-2,5,6-トリメチルピリジン-4-オール 0.15 g をクロロホル
 ム 10 ml に溶解させた。この溶液にトリエチルアミン 0.07 g を加えた。次いで、氷
 冷下で、クロロギ酸メチル 0.07 g を加えた。得られた液を室温で一晩攪拌した。反応
 液を飽和重曹水に注ぎ、クロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥
 させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展
 開溶媒：n-ヘキサン／酢酸エチル）にて精製して、目的化合物 0.14 g（収率 81%）
 を得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm})$ 2.11(3H, s), 2.49(3H, s), 2.50(3H, s), 3.83(3H, s), 4.25(2H, d), 4.80(2H, s), 6.08-6.54(2H, m), 7.82-7.95(3H, m)

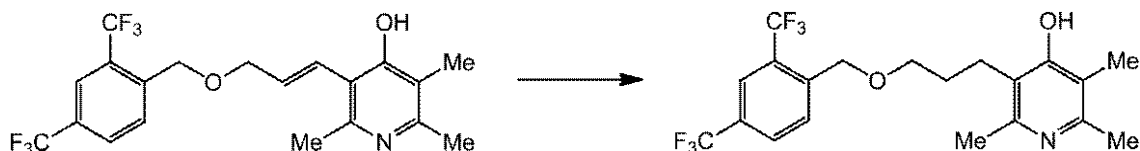
【0157】

（実施例 4） [3-[3-[[2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロ
 ピル]-2,5,6-トリメチル-4-ピリジル]メチルカーボネートの製造

（工程 1） 3-[3-[[2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロ
 ピル]-2,5,6-トリメチルピリジン-4-オール

【0158】

【化 2 3】



【0159】

3-[(E)-3-[[2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロプ
 -1-エニル]-2,5,6-トリメチルピリジン-4-オール 0.2 g をメタノール 2
 0 ml に溶解させた。この溶液に 10%パラジウム炭素 0.02 g を加え、水素雰囲気下
 、室温で一晩攪拌した。反応液をセライト濾過した。濾液を減圧濃縮して、目的化合物 0
 .2 g（収率 100%）を得た。

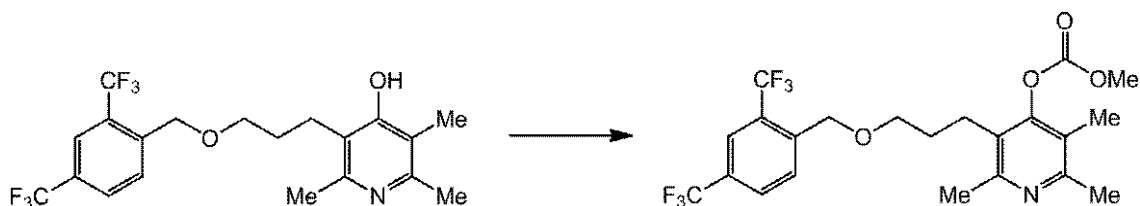
$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, \delta \text{ ppm})$ 1.82-1.92(2H, m), 2.00(3H, s), 2.24(3H, s), 2.27(3H, s), 2.59-2.64(2H, m), 3.57-3.60(2H, m), 4.71(2H, s), 7.78-7.95(3H, m)

【0160】

（工程 2） [3-[3-[[2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロ
 ピル]-2,5,6-トリメチル-4-ピリジル]メチルカーボネートの合成

【0161】

【化 2 4】



【0162】

3-[3-[[2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]メトキシ]プロピル]-2,

10

20

30

40

50

5, 6-トリメチルピリジン-4-オール 0.23 g をクロロホルム 10 ml に溶解させた。この溶液にトリエチルアミン 0.11 g を加えた。次いで、氷冷下で、クロロギ酸メチル 0.1 g を加えた。得られた液を室温で一晩攪拌した。反応液を飽和重曹水に注ぎ、クロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒：n-ヘキサン／酢酸エチル）にて精製して、目的化合物 0.16 g（収率 60%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ ppm) 1.81-1.89(2H, m), 2.06(3H, s), 2.47(3H, s), 2.51(3H, s), 2.64-2.69(2H, m), 3.56-3.60(2H, m), 3.84(3H, s), 4.73(2H, s), 7.80-7.92(3H, m)

【0163】

上記の実施例と同様の方法で製造した化合物を表 1～表 13 に示す。併せて、化合物の物性データを「物性」の欄に記載した。物性データとしては、融点〔mp (°C)〕またはその性状を記載した。

【0164】

表 1 は、式 (I-1) で表される化合物における置換基を示す。

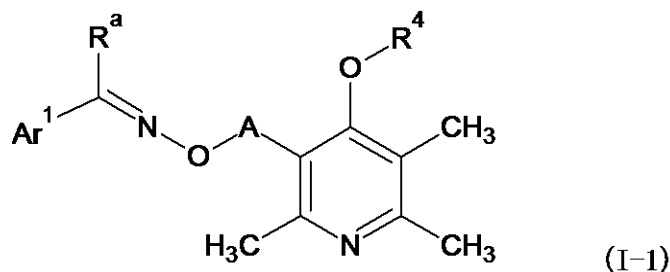
なお、A が非対称な部分構造の場合、構造式中の*の付された炭素はピリジンと結合する炭素を示す。化合物中のイミンの二重結合が、E 配置である場合を「E」、Z 配置である場合を「Z」、および両配置が混合している場合を「EZ」と示す。

【0165】

表 1 中の A-12 と A-13 は立体異性体である。表 1 中の、A-17 と A-18、A-21 と A-22、A-23 と A-24 は、立体異性体である。

【0166】

【化 25】



【0167】

10

20

30

【表 1】

表1

化合物 番号	Ar ¹	R ²	A	R ⁴	立体	物性
A-1	2-CF ₃ Ph	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
A-2	3-CF ₃ Ph	Me	CH ₂	Ac	E	mp:74-76°C
A-3	3-CF ₃ Ph	CH ₂ OMe	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
A-4	4-CF ₃ Ph	H	CH ₂	Ac	E	amorphous
A-5	4-CF ₃ Ph	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
A-6	2-CF ₃ OPh	H	CH ₂	Ac	E	mp:82-86°C
A-7	2-CF ₃ OPh	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
A-8	2-CF ₃ OPh	Me	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
A-9	3-CF ₃ OPh	H	CH ₂	Ac	E	amorphous
A-10	3-CF ₃ OPh	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
A-11	3-CF ₃ OPh	Me	CH ₂	Ac	E	mp:52-55°C
A-12	3-CF ₃ OPh	Me	CH(Me)	Ac	EZ	
A-13	3-CF ₃ OPh	Me	CH(Me)	Ac	EZ	viscous oil
A-14	4-CF ₃ OPh	H	CH ₂	Ac	E	amorphous
A-15	4-CF ₃ OPh	Me	CH ₂	Ac	E	amorphous
A-16	2-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH(Me)	Ac	E	mp:110-112°C
A-17	3-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
A-18	3-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
A-19	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH ₂	Ac	E	viscous oil
A-20	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH ₂	COEt	E	viscous oil
A-21	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
A-22	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
A-23	2,2-F ₂ -benzo[1,3]dioxol-5-yl	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
A-24	2,2-F ₂ -benzo[1,3]dioxol-5-yl	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil

【 0 1 6 8 】

10

20

30

表1(続き)

化合物 番号	Ar ¹	R ^a	A	R ⁴	立体	物性
A-25	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	H	CH ₂	Ac	E	mp:143-146°C
A-26	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	Me	CH ₂	Ac	E	mp:141-142°C
A-27	2-CF ₃ CH ₂ OPh	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
A-28	3-CF ₃ CH ₂ OPh	Me	CH ₂	Ac	E	mp:24-26°C
A-29	2-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	Ac	E	mp:70-75°C
A-30	3-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	Ac	E	mp:95-98°C
A-31	3-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	Ac	Z	mp:55-60°C
A-32	3-CF ₃ OPh	H	CH(Me)C [*] H ₂	Ac	E	mp:60-64°C
A-33	4-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	Ac	E	mp:120-122°C
A-34	2-CF ₃ OPh	H	CH(Me)	H	E	viscous oil
A-35	3-CF ₃ OPh	H	CH(Me)	H	E	mp:220°C
A-36	3-CF ₃ OPh	Me	CH(Me)	H	EZ	mp:150-158°C
A-37	2-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH(Me)	H	E	mp:95-101°C
A-38	3-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH(Me)	H	E	amorphous
A-39	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH ₂	H	E	mp:165-170°C
A-40	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH(Me)	H	E	amorphous
A-41	2,2-F ₂ -benzo[1,3]dioxol-5-yl	H	CH(Me)	H	E	mp:155-160°C
A-42	2-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	H	E	mp:200°C
A-43	3-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	H	E	mp:200°C
A-44	3-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	H	Z	mp:200°C
A-45	3-CF ₃ OPh	H	CH(Me)C [*] H ₂	H	E	mp:200°C
A-46	4-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	H	E	mp:200°C
A-47	3-CF ₃ OPh	H	CH(Me)	allyl	E	viscous oil
A-48	3-CF ₃ OPh	Me	CH(Me)	allyl	EZ	
A-49	2-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH(Me)	allyl	E	
A-50	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	H	CH ₂	allyl	E	viscous oil
A-51	2-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	allyl	E	mp:41-44°C
A-52	3-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	allyl	E	mp:42-46°C
A-53	3-CF ₃ OPh	H	CH(Me)C [*] H ₂	allyl	E	viscous oil
A-54	4-CF ₃ OPh	H	CH ₂ CH ₂	allyl	E	mp:43-47°C

【 0 1 6 9 】

表2は、式(I-2)で表される化合物における置換基を示す。

なお、Aが非対称な部分構造の場合、構造式中の*の付された炭素はピリジンと結合する炭素を示す。A中の二重結合が、E配置である場合を「E」、Z配置である場合を「Z」と表記する。

10

20

30

40

50

【化 2 6】



【表 2】

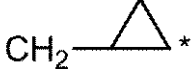
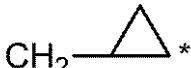
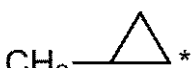
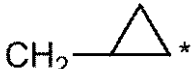
表2

30

【 0 1 7 2 】

40

表2(続き)

化合物 番号	Ar ¹	A	R ⁴	立体	物性
B-21	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	CH ₂ CH=C [*] H	CH ₂ (4-MeOPh)	E	mp:60-62°C
B-22	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	mp:60-64°C
B-23	2-MePh	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
B-24	3-MePh	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
B-25	4-MePh	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
B-26	2-MeOPh	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	oil
B-27	3-MeOPh	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous crtst.
B-28	4-MeOPh	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	oil
B-29	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl	CH ₂ CH=C [*] H	CH ₂ (4-MeOPh)	E	mp:65-70°C
B-30	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	mp:78-81°C
B-31	4-CF ₃ OPh	CH ₂ -  *	Ac		viscous oil
B-32	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	CH ₂ -  *	Ac		viscous oil
B-33	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂ -  *	CO ₂ Me		viscous oil
B-34	4-ClPh	CH=CH	H	E	mp:195-198°C
B-35	4-CF ₃ Ph	CH ₂ C≡C [*]	H		mp:74-76°C
B-36	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	amorphous
B-37	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:162-166°C
B-38	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH=C [*] H	H	Z	mp:168-170°C
B-39	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:178-180°C
B-40	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:158-161°C
B-41	(3-(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O)Ph	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	amorphous
B-42	(4-(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O)Ph	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:192-194°C
B-43	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH=C [*] (Me)	H	Z	mp:185-189°C
B-44	4-CF ₃ OPh	CH ₂ C(Me)=C [*] H	H	E	mp:200°C
B-45	4-ClPh	CH=CHC [*] H ₂	H	EZ	mp:200°C
B-46	4-CF ₃ OPh	CH ₂ -  *	H		mp:200°C
B-47	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	CH ₂ -  *	H		mp:200°C

【 0 1 7 3 】

10

20

30

40

表2(続き)

化合物 番号	Ar ¹	A	R ⁴	立体	物性
B-48	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂ -  *	H		mp:245-249°C
B-49	4-CF ₃ OPh	CH ₂ -  *	H		amorphous
B-50	4-ClPh	CH=CH	allyl	E	viscous oil
B-51	4-CF ₃ OPh	CH=CH	allyl	E	viscous oil
B-52	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous oil
B-53	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH=C [*] (Me)	allyl	Z	viscous oil
B-54	4-CF ₃ OPh	CH ₂ C(Me)=C [*] H	allyl	E	viscous oil
B-55	2-CF ₃ Ph	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	oil
B-56	3-CF ₃ Ph	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous cryst.
B-57	2-ClPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	
B-58	3-ClPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	oil
B-59	4-ClPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	
B-60	4-ClPh	CH=CHC [*] H ₂	allyl	EZ	viscous oil
B-61	(3-(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O)Ph	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous oil
B-62	(4-(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O)Ph	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous oil
B-63	2- ⁿ PrO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous oil
B-64	2-I-4-CF ₃ -Ph	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	mp:59-61°C
B-65	2-MePh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous cryst.
B-66	3-MePh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous cryst.
B-67	4-MePh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous cryst.
B-68	2-MeOPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	oil
B-69	3-MeOPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	oil
B-70	4-MeOPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	oil
B-71	2-CNPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	oil
B-72	3-CNPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous cryst.
B-73	4-CNPh	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	oil

10

20

30

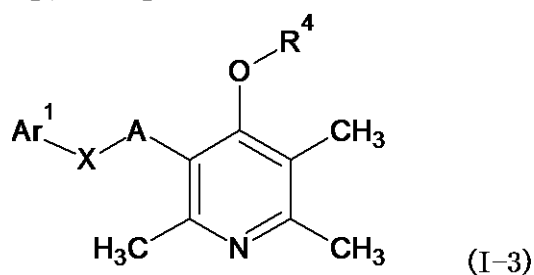
40

【0174】

表3は、式(I-3)で表される化合物における置換基を示す。なお、Aが非対称な部分構造の場合、構造式中の*の付された炭素はピリジンと結合する炭素を示す。A中の二重結合が、E配置である場合を「E」、Z配置である場合を「Z」と表記する。

【0175】

【化 2 7】



【 0 1 7 6】

10

【表 3】

表3

化合物 番号	Ar ¹	X	A	R ⁴	立体	物性
C-1	4-CF ₃ Ph	S	CH(Me)	Ac		
C-2	4-CF ₃ OPh	S	CH ₂	Ac		mp:78-80°C
C-3	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	S	CH ₂	Ac		mp:98-102°C
C-4	4-CF ₃ Ph	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac		mp:37-43°C
C-5	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac		viscous oil
C-6	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	SO ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac		viscous oil
C-7	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	S(=O)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac		viscous oil
C-8	4-CF ₃ Ph	S	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	mp:48-54°C
C-9	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	S	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
C-10	2-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-11	3-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-12	4-CF ₃ OPh	NAc	CH ₂ CH ₂	Ac		mp:64-69°C
C-13	4-CF ₃ OPh	NMe	CH ₂ CH ₂	Ac		mp:93-95°C
C-14	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Hex	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-15	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-16	4-CF ₃ OPh	NCOCH(Et) ₂	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-17	4-CF ₃ OPh	NCOEt	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		mp:63-74°C
C-18	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pr	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-19	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Non	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-20	4-CF ₃ OPh	NCO(2-CF ₃ Ph)	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		mp:102-106°C
C-21	4-CF ₃ OPh	NCO(4-CF ₃ Ph)	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		mp:115-125°C
C-22	4-CF ₃ OPh	NCO(3-CF ₃ Ph)	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		amorphous
C-23	2,3-F ₂ -Ph	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-24	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		amorphous
C-25	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil

【 0 1 7 7】

50

表3(続き)

化合物 番号	Ar ¹	X	A	R ⁴	立体	物性
C-26	4-((3-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-27	4-((3-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		mp:63-66°C
C-28	6-((4-CF ₃ O)Ph)-Py-3-yl	NCO ⁿ Bu	CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
C-29	4-CF ₃ OPh	Nallyl	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac		viscous oil
C-30	4-CF ₃ OPh	NMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac		viscous oil
C-31	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	Nallyl	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac		viscous oil
C-32	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac		viscous oil
C-33	4-CF ₃ Ph	S	CH(Me)	H		amorphous
C-34	4-CF ₃ Ph	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-35	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-36	4-CF ₃ Ph	S	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:200°C
C-37	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	S	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:182-185°C
C-38	4-CF ₃ Ph	S	CH(Me)	allyl		
C-39	4-CF ₃ Ph	S	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous oil
C-40	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	S	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	viscous oil
C-41	2-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	H		mp:165-170°C
C-42	3-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	H		mp:196-203°C
C-43	4-CF ₃ OPh	NAc	CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-44	4-CF ₃ OPh	NMe	CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-45	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Hex	CH ₂ CH ₂	H		mp:170-180°C
C-46	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	H		mp:157-160°C
C-47	4-CF ₃ OPh	NCOCH(Et) ₂	CH ₂ CH ₂	H		mp:193-196°C
C-48	4-CF ₃ OPh	NCOEt	CH ₂ CH ₂	H		mp:200-208°C
C-49	4-CF ₃ OPh	NCO(4-CF ₃ Ph)	CH ₂ CH ₂	H		mp:184-193°C
C-50	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pr	CH ₂ CH ₂	H		mp:195-201°C
C-51	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Non	CH ₂ CH ₂	H		mp:175-180°C
C-52	4-CF ₃ OPh	NCO(4-CF ₃ Ph)	CH ₂ CH ₂	H		mp:225-231°C
C-53	4-CF ₃ OPh	NCO(3-CF ₃ Ph)	CH ₂ CH ₂	H		mp:177-181°C
C-54	2,3-F ₂ -Ph	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	H		mp:180-188°C
C-55	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-56	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C

【 0 1 7 8 】

10

20

30

40

表3(続き)

化合物 番号	Ar ¹	X	A	R ⁴	立体	物性
C-57	4-((3-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-58	4-((3-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-59	6-((4-CF ₃ O)Ph)-Py-3-yl	NCO ⁿ Bu	CH ₂ CH ₂	H		mp:200-203°C
C-60	5-CF ₃ -Py-2-yl	NCO ⁿ Pr	CH ₂ CH ₂	H		amorphous
C-61	4-CF ₃ OPh	Nallyl	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-62	4-CF ₃ OPh	NH	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-63	4-CF ₃ OPh	NMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-64	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	Nallyl	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:124-127°C
C-65	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:200°C
C-66	3-CF ₃ OPh	NH	CH ₂ CH ₂	allyl		mp:65-75°C
C-67	3-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-68	4-CF ₃ OPh	NH	CH ₂ CH ₂	allyl		mp:50-54°C
C-69	4-CF ₃ OPh	NMe	CH ₂ CH ₂	allyl		mp:59-64°C
C-70	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Hex	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-71	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pen	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-72	4-CF ₃ OPh	NCOCH(Et) ₂	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-73	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Pr	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-74	4-CF ₃ OPh	NCO ⁿ Non	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-75	4-CF ₃ OPh	NCO(4-CF ₃ Ph)	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-76	4-CF ₃ OPh	NCO(3-CF ₃ Ph)	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-77	4-CF ₃ OPh	NCOEt	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-78	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	NH	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-79	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	CH ₂ CH ₂	allyl		mp:60-64°C
C-80	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-81	4-((3-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	CH ₂ CH ₂	allyl		mp:52-54°C
C-82	4-((3-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂ CH ₂	allyl		mp:50-53°C
C-83	4-CF ₃ OPh	NMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-84	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	CH ₂ CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-85	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
C-86	4-CF ₃ OPh	NH	CH ₂ CH=C [*] H	allyl	E	mp:69-74°C
C-87	4-CF ₃ OPh	NH	CH ₂ -  *	allyl		viscous oil

【0179】

表4は、式(I-4)で表される化合物における置換基を示す。なお、Aが非対称な部分構造の場合、構造式中の*の付された炭素はピリジンと結合する炭素を示す。化合物中の

10

20

30

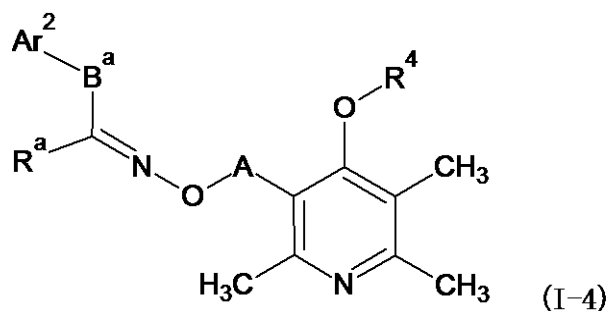
40

50

イミンの二重結合が、E配置である場合を「E」、Z配置である場合を「Z」、および両配置が混合している場合を「EZ」と表記する。

【0180】

【化28】



10

【0181】

【表4】

表4

化合物 番号	Ar ²	B ^a	R ^a	A	R ⁴	立体	物性
D-1	4-ClPh	CH ₂	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-2	3-CF ₃ Ph	CH ₂	Me	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
D-3	3-CF ₃ Ph	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-4	3-CF ₃ Ph	CH ₂	Me	CH ₂	Ac	E	
D-5	4-CF ₃ Ph	CH ₂	Me	CH ₂	Ac	E	
D-6	4-CF ₃ Ph	CH(Me)	H	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-7	4-CF ₃ Ph	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-8	4-CF ₃ Ph	CH(Me)	Me	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
D-9	4-CF ₃ Ph	C(Me) ₂	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-10	4-CF ₃ Ph	C(Me) ₂	H	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-11	4-CF ₃ Ph	C(=N-OMe)	Me	CH ₂	Ac	EZ	mp:152-154°C
D-12	4-CF ₃ Ph	C(=N-OMe)	Me	CH ₂	Ac	EZ	mp:102-105°C
D-13	3-CF ₃ OPh	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-14	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH ₂	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
D-15	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH ₂	H	CH(Me)	Ac	E	viscous oil
D-16	4,6-(CF ₃) ₂ -Ph	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-17	(4-CF ₃ Ph)O	CH ₂	H	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil

20

30

40

【0182】

表4(続き)

化合物 番号	Ar ²	B ^a	R ^a	A	R ⁴	立体	物性
D-18	(4-CF ₃ Ph)O	CH ₂	Me	CH ₂	Ac	EZ	mp:65-68°C
D-19	(4-CF ₃ Ph)O	CH ₂	^t Bu	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-20	(4-CF ₃ Ph)O	CH(Me)	H	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
D-21	(4-CF ₃ Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
D-22	(4-CF ₃ Ph)O	C(Me) ₂	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-23	(3-CF ₃ OPh)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
D-24	(3-CF ₃ OPh)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-25	(3- ^t BuPh)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
D-26	(4- ^t BuPh)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
D-27	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	H	CH ₂	Ac	EZ	amorphous
D-28	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
D-29	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-30	(4,6-(CF ₃) ₂ -Py-2-yl)O	CH ₂	Me	CH ₂	Ac	E	mp:105-114°C
D-31	(4,6-(CF ₃) ₂ -Py-2-yl)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
D-32	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH ₂	Me	CH ₂	Ac	EZ	viscous oil
D-33	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
D-34	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH(Me)	Me	CH ₂	CO ₂ Me	E	viscous oil
D-35	3-CF ₃ Ph	CH ₂	Me	CH(Me)	H	E	amorphous
D-36	4-CF ₃ Ph	CH ₂	Me	CH ₂	H	E	
D-37	4-CF ₃ Ph	CH(Me)	Me	CH(Me)	H	E	viscous oil
D-38	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH ₂	H	CH(Me)	H	E	amorphous
D-39	(4-CF ₃ Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	H	E	viscous oil
D-40	(3-CF ₃ OPh)O	CH(Me)	Me	CH ₂	H	E	mp:203-204°C
D-41	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	H	EZ	mp:190-195°C
D-42	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH(Me)	Me	CH ₂	H	E	mp:210°C
D-43	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH(Me)	Me	CH ₂	H	E	mp:200°C
D-44	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH(Me)	Me	CH ₂	allyl	E	amorphous

【 0 1 8 3 】

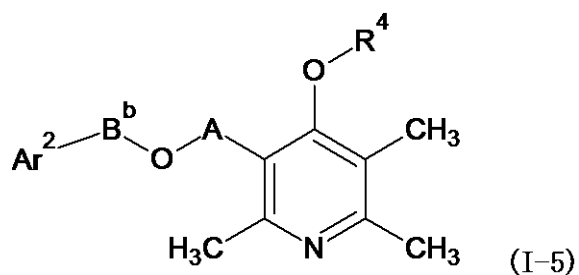
表5は、式(I-5)で表される化合物における置換基を示す。なお、Aが非対称な部分構造の場合、構造式中の*の付された炭素はピリジンと結合する炭素を示す。B^bが非対称な部分構造の場合、構造式中の*の付された炭素はXと結合する炭素を示し、**の付された炭素はAr²と結合する炭素を示す。A中の二重結合が、E配置である場合を「E」、Z配置である場合を「Z」と表記する。

化合物E-5~E-51、E-58、E-59、E-110~E-114、E-116、E-159、またはE-160において、B^b中の1,4-シクロヘキシレンの立体配置が、トランス配置である場合を「trans」、シス配置である場合を「cis」と表記する。

化合物E-63、E-66、E-119、E-122、またはE-162において、 B^b 中の架橋部分と、*または**を付した炭素上の置換基の立体配置が、シス配置である場合を「cis」と表記する。

【0184】

【化29】



10

【0185】

【表5】

表5

化合物 番号	Ar	B^b	A	R^4	立体	物性
E-1	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂	Ac		viscous oil
E-2	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂	Ac		viscous oil
E-3	4-MeOPh	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂	Ac		viscous oil
E-4	4-CF ₃ OPh	C≡C-C [*] H ₂	CH ₂	Ac		viscous oil
E-5	2-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	cis	viscous oil
E-6	2-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	trans	viscous oil
E-7	3-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	cis	viscous oil
E-8	3-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	trans	viscous oil
E-9	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	Ac	trans	viscous oil
E-10	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	Ac	cis	viscous oil
E-11	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	trans	viscous oil
E-12	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	cis	viscous oil
E-13	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ CH ₂ Cl ₃	cis	viscous oil
E-14	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ CH ₂ Cl ₃	trans	viscous oil
E-15	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	COPh	cis	viscous oil
E-16	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	COPh	trans	amorphous
E-17	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ OMe	trans	viscous oil
E-18	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ OMe	cis	viscous oil
E-19	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ CH ₂ OMe	trans	viscous oil
E-20	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ O ⁿ Pr	cis	viscous oil

20

30

40

【0186】

表5(続き)

化合物 番号	Ar	B ^b	A	R ⁴	立体	物性
E-21	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ O ⁿ Pr	trans	viscous oil
E-22	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	trans	viscous oil
E-23	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ CH ₂ OAc	cis	viscous oil
E-24	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ CH ₂ OAc	trans	viscous oil
E-25	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ CO ₂ Me	trans	viscous oil
E-26	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ CN	trans	viscous oil
E-27	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ Ph	trans	amorphous
E-28	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (4-MeOPh)	trans	viscous oil
E-29	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (4-MeOPh)	cis	viscous oil
E-30	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2-MeOPh)	cis	viscous oil
E-31	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2-MeOPh)	trans	amorphous
E-32	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (3-MeOPh)	trans	amorphous
E-33	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2,3-(MeO) ₂ -Ph)	trans	viscous oil
E-34	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (3,4-(MeO) ₂ -Ph)	cis	viscous oil
E-35	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (3,4-(MeO) ₂ -Ph)	trans	viscous oil
E-36	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (3,5-(MeO) ₂ -Ph)	trans	viscous oil
E-37	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (Benzo[1,3]dioxol-5-yl)	trans	viscous oil
E-38	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2-MeO-6-Me-Ph)	trans	viscous oil
E-39	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2,6-(MeO) ₂ -Ph)	trans	viscous oil
E-40	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2,5-(MeO) ₂ -Ph)	trans	viscous oil
E-41	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (5-MeO-benzo[1,3]dioxol-4-yl)	trans	viscous oil
E-42	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2-EtOPh)	cis	viscous oil
E-43	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2-EtOPh)	trans	viscous oil
E-44	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2-(MeOCH ₂ O)-Ph)	trans	viscous oil
E-45	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2-(MeOCH ₂ CH ₂ O)-Ph)	trans	viscous oil
E-46	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (Benzo[1,3]dioxol-4-yl)	trans	viscous oil
E-47	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH(Me)(2-MeOPh)	trans	viscous oil
E-48	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (2,3-Dihydro-benzo[1,4]dioxin-5-yl)	trans	viscous oil
E-49	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CH ₂ (Py-2-yl)	trans	viscous oil
E-50	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	trans	viscous oil

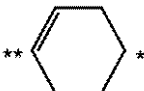
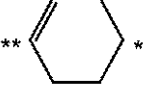
10

20

30

40

表5(続き)

化合物 番号	Ar	B ^b	A	R ¹	立体	物性
E-51	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	cis	viscous oil
E-52	4-CF ₃ OPh		CH ₂	Ac		viscous oil
E-53	2-CF ₃ OPh		CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-54	4-CF ₃ OPh	C(=N-O ⁿ Hex)C [*] H ₂	CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-55	4-CF ₃ OPh	C(=N-O ⁿ Hex)C [*] H ₂	CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-56	4-ClPh	C(=N-O ⁿ Bu)C [*] H ₂	CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-57	4-ClPh	C(=N-O ⁿ Bu)C [*] H ₂	CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-58	5-CF ₃ -Py-2-yl	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	cis	viscous oil
E-59	5-CF ₃ -Py-2-yl	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me	trans	viscous oil
E-60	3,5-(CF ₃) ₂ -pyrazol-1-yl	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-61	3-CF ₃ -pyrazol-1-yl	1,4-cyclohexylene	CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-62	5-CF ₃ -Py-2-yl		CH ₂	CO ₂ Me		mp:83-87°C
E-63	5-CF ₃ -Py-2-yl		CH ₂	CO ₂ Me	cis	viscous oil
E-64	(4-CF ₃ OPh)O	CH(Me)CH(Me)	CH ₂	Ac		viscous oil
E-65	(4-CF ₃ OPh)O	1,4-cyclohexylene	CH ₂	Ac		viscous oil
E-66	(4-ClPh)O		CH ₂	Ac	cis	viscous oil
E-67	4-CF ₃ OPh		CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-68	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH(Me)CH(Me)	CH ₂	Ac		amorphous
E-69	2-MeO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-70	2- ⁿ PrO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		mp:55-58°C
E-71	2,4-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-72	2-CF ₃ CH ₂ O-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-73	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-74	4-CF ₃ OPh	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-75	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		mp:23-26°C

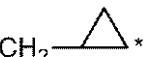
10

20

30

40

表5(続き)

化合物 番号	Ar	B ^b	A	R ⁴	立体	物性
E-76	4-CF ₃ OPh	CH(CH ₂ OMe)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-77	4-ClPh	CH(Ph)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-78	4-CF ₃ OPh	CH(Ph)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-79	4-ClPh	CH(3-ClPh)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-80	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl	CH(Et)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CO ₂ Me		viscous oil
E-81	4-CF ₃ Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
E-82	2-MeO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-83	2- ⁿ PrO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-84	2,4-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-85	2-CF ₃ CH ₂ O-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-86	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-87	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	CH ₂ Ph	E	viscous oil
E-88	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-89	4-CF ₃ OPh	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	CH ₂ Ph	E	mp:43-48°C
E-90	4-CF ₃ OPh	CH(Me)	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
E-91	4-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
E-92	3-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
E-93	2-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
E-94	4-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	CH ₂ Ph	E	viscous oil
E-95	4-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-96	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-97	4-CF ₃ OPh	CH(CH ₂ OMe)	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-98	4-ClPh	CH(Ph)	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-99	4-CF ₃ OPh	CH(Ph)	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-100	4-ClPh	CH(4-ClPh)	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
E-101	4-ClPh	CH(3-ClPh)	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-102	4-CF ₃ OPh	CH(pyrimidine-2-yl)	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
E-103	(4-CF ₃ OPh)O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
E-104	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	CO ₂ Me	E	viscous oil
E-105	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH(Me)CH(Me)	CH ₂ CH=C [*] H	Ac	E	viscous oil
E-106	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂  *	CO ₂ Me		viscous oil

10

20

30

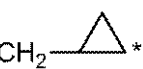
40

表5(続き)

化合物 番号	Ar	B ^b	A	R ¹	立体	物性
E-107	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂	H		amorphous
E-108	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂	H		amorphous
E-109	4-MeOPh	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂	H		mp:175-180°C
E-110	2-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	H	trans	mp:200°C
E-111	3-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	H	trans	mp:195-199°C
E-112	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	H	trans	mp:200°C
E-113	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	H	cis	amrphous
E-114	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	1,4-cyclohexylene	CH ₂	H	trans	mp:157-159°C
E-115	4-CF ₃ OPh		CH ₂	H		mp:200°C
E-116	5-CF ₃ -Py-2-yl	1,4-cyclohexylene	CH ₂	H	trans	mp:200°C
E-117	3,5-(CF ₃) ₂ -pyrazol-1-yl	1,4-cyclohexylene	CH ₂	H		mp:200°C
E-118	5-CF ₃ -Py-2-yl		CH ₂	H		mp:200°C
E-119	5-CF ₃ -Py-2-yl		CH ₂	H	cis	mp:200°C
E-120	(4-CF ₃ OPh)O	1,4-cyclohexylene	CH ₂	H		mp:200°C
E-121	(4-CF ₃ OPh)O	CH(Me)CH(Me)	CH ₂	H		mp:200°C
E-122	(4-ClPh)O		CH ₂	H	cis	mp:185-190°C
E-123	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH(Me)CH(Me)	CH ₂	H		mp:200°C
E-124	2-MeO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:196-202°C
E-125	2- ⁿ PrO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:164-167°C
E-126	2,4-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:152-154°C
E-127	2-CF ₃ CH ₂ O-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:165-168°C
E-128	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:168-172°C
E-129	4-CF ₃ OPh	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:150-154°C
E-130	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:202-206°C

【 0 1 9 0 】

表5(続き)

化合物 番号	Ar	B ^b	A	R ^d	立体	物性
E-131	4-CF ₃ OPh	CH(CH ₂ OMe)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:160-162°C
E-132	4-ClPh	CH(3-ClPh)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:137-144°C
E-133	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl	CH(Et)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	H		mp:164-166°C
E-134	4-CF ₃ Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:195-198°C
E-135	2-MeO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:170-178°C
E-136	2- ⁿ PrO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:160-165°C
E-137	2,4-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:148-150°C
E-138	2-CF ₃ CH ₂ O-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:168-171°C
E-139	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:130-135°C
E-140	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:199-202°C
E-141	4-CF ₃ OPh	CH(Me)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:151-154°C
E-142	4-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:142-147°C
E-143	3-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:126-130°C
E-144	2-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:192-194°C
E-145	4-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:148-151°C
E-146	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:146-159°C
E-147	4-CF ₃ OPh	CH(CH ₂ OMe)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:134-136°C
E-148	4-ClPh	CH(Ph)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:150-161°C
E-149	4-CF ₃ OPh	CH(Ph)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:100-105°C
E-150	4-ClPh	CH(4-ClPh)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:200°C
E-151	4-ClPh	CH(3-ClPh)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:153-163°C
E-152	4-CF ₃ OPh	CH(pyrimidine-2-yl)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:145-150°C
E-153	(4-CF ₃ OPh)O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:120-124°C
E-154	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl	CH(Et)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	mp:158-160°C
E-155	(3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl)O	CH(Me)CH(Me)	CH ₂ CH=C [*] H	H	E	solid
E-156	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ 	H		mp:163-165°C
E-157	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂	allyl		viscous oil
E-158	4-CF ₃ OPh	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂	allyl		viscous oil
E-159	3-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	allyl	trans	viscous oil
E-160	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	CH ₂	allyl	trans	viscous oil
E-161	(4-CF ₃ OPh)O	1,4-cyclohexylene	CH ₂	allyl		viscous oil

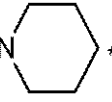
10

20

30

40

表5(続き)

化合物 番号	Ar	B ^b	A	R ⁴	立体	物性
E-162	(4-ClPh)O	** 	CH ₂	allyl	cis	viscous oil
E-163	4-CF ₃ OPh	 *	CH ₂	allyl		viscous oil
E-164	4-ClPh	CH(2-ClPh)	CH ₂ CH ₂ CH ₂	allyl		viscous oil
E-165	4-CF ₃ Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-166	2-MeO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-167	2- ⁿ PrO-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-168	2,4-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-169	2-CF ₃ CH ₂ O-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	amorphous
E-170	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-171	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	mp:28-31°C
E-172	4-CF ₃ OPh	CH(Me)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-173	4-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-174	3-CF ₃ OPh	CH(Et)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-175	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH(Et)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-176	4-CF ₃ OPh	CH(CH ₂ OMe)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-177	4-ClPh	CH(Ph)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-178	4-CF ₃ OPh	CH(Ph)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-179	4-ClPh	CH(4-ClPh)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-180	4-ClPh	CH(3-ClPh)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-181	4-CF ₃ OPh	CH(pyrimidine-2-yl)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-182	(4-CF ₃ OPh)O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-183	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl	CH(Et)	CH ₂ CH=C*H	allyl	E	viscous oil
E-184	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	CH ₂	CH ₂  *	allyl		viscous oil

10

20

30

【0192】

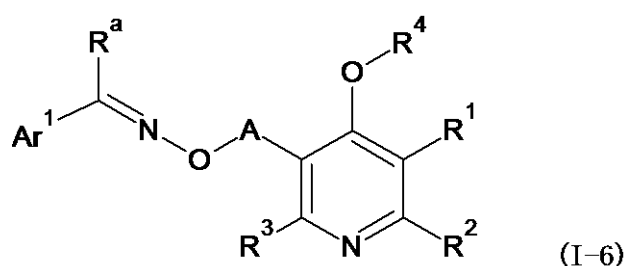
表6は、式(I-6)で表される化合物における置換基を示す。

化合物中のイミンの二重結合が、E配置である場合を「E」、Z配置である場合を「Z」、および両配置が混合している場合を「EZ」と示す。

40

【0193】

【化30】



50

【 0 1 9 4 】

【 表 6 】

表6

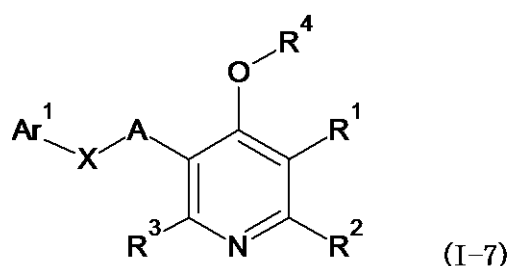
化合物 番号	Ar ¹	R ^a	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	立体	物性
F-1	3-CF ₃ OPh	H	CH(Me)	Cl	Me	Me	Ac	E	viscous oil
F-2	3-CF ₃ OPh	H	CH(Me)	Br	Me	Me	Ac	E	viscous oil
F-3	6-CF ₃ -Py-2-yl	Me	CH ₂	Me	Me	Me	Ac	E	mp:65-67°C
F-4	6-(tBuOCONH)-Py-2-yl	H	CH ₂	Me	Me	Me	Ac	E	mp:25-27°C
F-5	6-(tBuOCONH)-Py-2-yl	H	CH ₂	Me	Me	Me	H	E	mp:200°C

10

【 0 1 9 5 】

表7は、式(I-7)で表される化合物における置換基を示す。なお、Aが非対称な部分構造の場合、構造式中の*の付された炭素はピリジンと結合する炭素を示す。

【 0 1 9 6 】



20

【 0 1 9 7 】

【 表 7 】

表7

化合物 番号	Ar ²	X	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	立体	物性
G-1	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NAc	C(=O)	Br	Me	Me	Ac		
G-2	4-CF ₃ Ph	NH	C(=O)	Me	Me	Me	Ac		mp:200°C
G-3	4-((3-CF ₃ Ph)O)Ph	NAc	C(=O)	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
G-4	4-CF ₃ OPh	NMe	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		amorphous
G-5	4-CF ₃ OPh	NAc	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
G-6	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
G-7	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	Nallyl	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
G-8	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NAc	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
G-9	4-ClPh	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil

30

40

【 0 1 9 8 】

表7(続き)

化合物 番号	Ar ²	X	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	立体	物性
G-10	4-CF ₃ Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	Me		amorphous
G-11	2-CF ₃ OPh	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
G-12	4-CF ₃ OPh	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
G-13	3-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
G-14	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		mp:73-75°C
G-15	4-(4-CF ₃ OPh)Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		amorphous
G-16	2-(2,4-Cl ₂ -Ph)O-5-Cl-Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	CO ₂ Me		viscous oil
G-17	4-(1-adamantyl)Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	CO ₂ Me		amorphous
G-18	1-(4-CF ₃ Ph)-1H-pyrazol-3-yl	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		amorphous
G-19	2,2,6,6-(Me) ₄ -piperidin-1-yl	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		mp:90-94°C
G-20	4-CF ₃ OPh	O	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	Ac		mp:78-81°C
G-21	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	O	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
G-22	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	O	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	CO ₂ Me		viscous oil
G-23	4-CF ₃ OPh	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	Ac		mp:64-67°C
G-24	2- ⁿ PrO-4-CF ₃ -Ph	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	CO ₂ Me		mp:52-55°C
G-25	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	CO ₂ Me		viscous oil
G-26	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	Ac		mp:124-128°C
G-27	N-Phthalimideyl	O	CH ₂	Me	Me	Me	Me		amorphous
G-28	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	C(=O)	H	Me	Me	H		mp:200°C
G-29	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	C(=O)	Br	Me	Me	H		mp:200°C
G-30	4-ClPh	NH	C(=O)	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-31	4-CF ₃ Ph	NH	C(=O)	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-32	4-((3-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	C(=O)	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-33	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	C(=O)	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-34	4-CF ₃ OPh	NH	CH ₂	Me	Me	Me	H		amorphous
G-35	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NMe	CH ₂	Me	Me	Me	H		amorphous
G-36	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	CH ₂	Me	Me	Me	H		amorphous
G-37	4-CF ₃ OPh	NH	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-38	4-CF ₃ OPh	NAc	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-39	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	NH	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-40	4-ClPh	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C

10

20

30

40

表7(続き)

化合物 番号	Ar ²	X	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	立体	物性
G-41	2-CF ₃ OPh	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-42	3-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:176-180°C
G-43	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-44	2-(2,4-Cl ₂ -Ph)O-5-Cl-Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		amorphous
G-45	4-(1-adamantyl)Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-46	1-(4-CF ₃ Ph)-1H-pyrazol-3-yl	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		amorphous
G-47	2,2,6,6-(Me) ₄ -piperidin-1-yl	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-48	4-CF ₃ OPh	O	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-49	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	O	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-50	4-CF ₃ OPh	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-51	2- ⁿ PrO-4-CF ₃ -Ph	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
G-52	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:215-218°C
G-53	3-Cl-5-CF ₃ -Py-2-yl	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:168-170°C
G-54	3-CF ₃ Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		amorphous
G-55	4-CF ₃ OPh	O	CH(Me)	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-56	3-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-57	4-((4-CF ₃ OPh)O)Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-58	2-(2,4-Cl ₂ -Ph)O-5-Cl-Ph	O	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-59	2,2,6,6-(Me) ₄ -piperidin-1-yl	O	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		mp:78-82°C
G-60	4-CF ₃ OPh	O	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	allyl		mp:47-52°C
G-61	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	O	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-62	2-ClPh	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-63	3,5-(CF ₃) ₂ -Ph	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	allyl		mp:30-32°C
G-64	N-Phthalimideyl	O	CH(Me)C [*] H ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
G-65	N-Phthalimideyl	O	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	allyl		mp:44-47°C

10

20

30

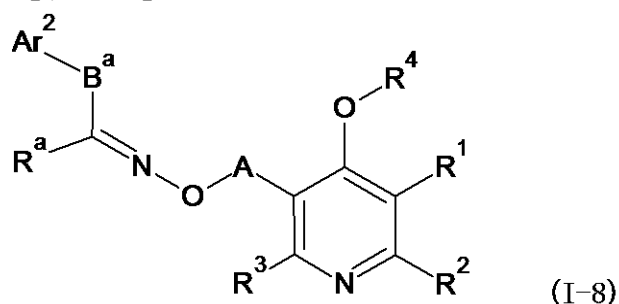
【0200】

表8は、式(I-8)で表される化合物における置換基を示す。化合物中のイミンの二重結合が、E配置である場合を「E」、Z配置である場合を「Z」、および両配置が混合している場合を「EZ」と表記する。

40

【0201】

【化31】



50

【 0 2 0 2 】

【 表 8 】

表8

化合物 番号	Ar ²	B ^a	R ^a	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	立体	物性
H-1	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Br	Et	Et	Ac	EZ	viscous oil
H-2	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Me	Et	Et	Ac	EZ	mp:195-203°C
H-3	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Me	Et	Me	Ac	EZ	viscous oil
H-4	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Me	Me	Et	Ac	EZ	viscous oil
H-5	4-CF ₃ OPh	N(CO ₂ Me)	H	CH ₂	Me	Me	Me	CO ₂ Me	E	mp:85-88°C
H-6	4-CF ₃ OPh	NH	Me	CH ₂	Me	Me	Me	CO ₂ Me	E	viscous oil
H-7	4-CF ₃ OPh	N(Me)	Me	CH ₂	Me	Me	Me	CO ₂ Me	EZ	viscous oil
H-8	4-CF ₃ OPh	N(Me)	Me	CH ₂	Me	Me	Me	CO ₂ Me	EZ	viscous oil
H-9	4-CF ₃ Ph	CH ₂	NH ₂	C(=O)	Me	Me	Me	Me	EZ	mp:172-174°C
H-10	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Me	Et	Me	H	EZ	mp:200°C
H-11	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Me	Me	Et	H	EZ	mp:200°C
H-12	4-CF ₃ Ph	C(=O)	Me	CH ₂	Me	Et	Me	allyl	EZ	viscous oil
H-13	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Me	Et	Et	allyl	EZ	viscous oil
H-14	(3,5-(CF ₃) ₂ -Ph)O	CH(Me)	Me	CH ₂	Me	Et	Me	allyl	EZ	viscous oil
H-15	4-CF ₃ OPh	NH	H	CH ₂	Me	Me	Me	H	E	mp:200°C
H-16	4-CF ₃ OPh	NH	Me	CH ₂	Me	Me	Me	H	E	mp:158-161°C
H-17	4-CF ₃ OPh	N(Me)	Me	CH ₂	Me	Me	Me	H	EZ	mp:191-195°C
H-18	4-CF ₃ OPh	N(Me)	Me	CH ₂	Me	Me	Me	H	EZ	mp:171-173°C
H-19	4-CF ₃ OPh	NH	H	CH ₂	Me	Me	Me	allyl	E	mp:110-114°C
H-20	4-CF ₃ OPh	NH	Me	CH ₂	Me	Me	Me	allyl	E	amorphous
H-21	4-CF ₃ OPh	N(Me)	Me	CH ₂	Me	Me	Me	allyl	EZ	viscous oil
H-22	4-CF ₃ OPh	N(Me)	Me	CH ₂	Me	Me	Me	allyl	EZ	mp:41-45°C

10

20

30

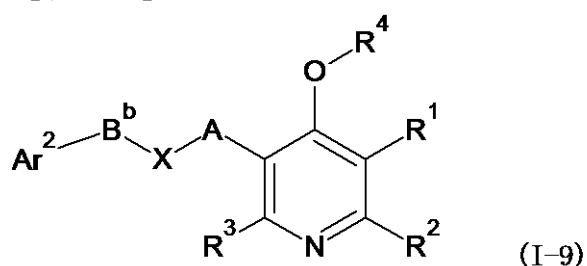
【 0 2 0 3 】

表 9 は、式 (I-9) で表される化合物における置換基を示す。なお、A が非対称な部分構造の場合、構造式中の*の付された炭素はピリジンと結合する炭素を示す。B^b が非対称な部分構造の場合、構造式中の*の付された炭素はXと結合する炭素を示す。

化合物I-2～I-8、I-36～I-38、またはI-40においてB^b中の1, 4-シクロヘキシレンの立体配置が、トランス配置である場合を「trans」、シス配置である場合を「cis」と表記する。

【 0 2 0 4 】

【 化 3 2 】



【 0 2 0 5 】

40

【表 9】

表9

化合物 番号	Ar ²	B ^b	X	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	立体	物性
I-1	4-CF ₃ OPh	C≡C-C [*] H ₂	O	CH ₂	Br	Me	Me	Ac		viscous oil
I-2	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Br	Et	Et	Ac	trans	viscous oil
I-3	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Me	Et	Ac	trans	viscous oil
I-4	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Et	Me	Ac	trans	amorphous
I-5	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Et	Me	CO ₂ Me	trans	viscous oil
I-6	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Et	Me	CH ₂ CH ₂ OAc	trans	viscous oil
I-7	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Me	ⁱ Pr	CO ₂ Me	trans	viscous oil
I-8	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Me	ⁱ Pr	CH=CHMe	trans	viscous oil
I-9	Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	Et		mp:43-46°C
I-10	4-CF ₃ Ph	CH ₂	O	CH(Me)	Me	Me	Me	Ac		
I-11	4-(4-CF ₃ Ph)Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		amorphous
I-12	3,4-Cl ₂ -Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
I-13	3,5-Cl ₂ -Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		amorphous
I-14	3-CF ₃ -4-F-Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
I-15	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
I-16	4-ClPh	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
I-17	4-BrPh	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
I-18	3-CF ₃ Ph	CH(Me)	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
I-19	4-CF ₃ Ph	CH ₂	O	C(=O)	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
I-20	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	O	C(=O)	Me	Me	Me	Ac		
I-21	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	O	C(=O)C [*] H(Me)	Me	Me	Me	Ac		viscous oil
I-22	4-CF ₃ OPh	C(=O)	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		amorphous
I-23	4-CF ₃ OPh	C(=O)	O	CH ₂	Me	Me	Me	CH ₂ OMe		amorphous
I-24	4-CF ₃ Ph	CH ₂ C [*] (=O)	O	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		amorphous
I-25	4-CF ₃ Ph	CH ₂ C [*] (=O)	O	CH ₂	Me	Me	Me	CH ₂ OMe		amorphous
I-26	4-CF ₃ Ph	CH ₂	S	CH(Me)	Me	Me	Me	Ac		
I-27	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	S	CH(Me)	Me	Me	Me	Ac		

10

20

30

【 0 2 0 6 】

表9(続き)

化合物 番号	Ar ²	B ^b	X	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	立体	物性
I-28	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	S(=O)	CH(Me)	Me	Me	Me	Ac		amorphous
I-29	4-CF ₃ Ph	CH ₂	NMe	C(=O)C [*] H ₂	H	Me	Me	Ac		amorphous
I-30	4-CF ₃ OPh	C(=O)	NH	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		mp:158-160°C
I-31	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	C(=O)	NH	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		mp:162-163°C
I-32	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	C(=O)	NEt	CH ₂	Me	Me	Me	Ac		mp:130-135°C
I-33	4-CF ₃ Ph	CH ₂	NH	C(=O)	Me	Me	Me	Ac		mp:158-160°C
I-34	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Me	Et	H	trans	mp:200°C
I-35	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Et	Me	H	trans	mp:200°C
I-36	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Me	ⁱ Pr	H	trans	mp:88-90°C
I-37	4-CF ₃ OPh	C≡C-C [*] H ₂	O	CH ₂	H	Me	Me	allyl		viscous oil
I-38	4-CF ₃ OPh	1,4-cyclohexylene	O	CH ₂	Me	Et	Me	allyl	trans	viscous oil
I-39	4-CF ₃ Ph	CH ₂	O	CH(Me)	Me	Me	Me	H		viscous oil
I-40	3,4-Cl ₂ -Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-41	3,5-Cl ₂ -Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-42	3-CF ₃ -4-F-Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-43	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-44	4-ClPh	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-45	4-BrPh	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-46	3-CF ₃ Ph	CH(Me)	O	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-47	4-CF ₃ Ph	CH ₂	O	C(=O)	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-48	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	O	C(=O)	Me	Me	Me	H		mp:186-188°C
I-49	4-CF ₃ Ph	CH ₂	O	CH(Me)	Me	Me	Me	allyl		
I-50	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	CH ₂	O	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
I-51	3-CF ₃ Ph	CH(Me)	O	CH ₂	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
I-52	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	O	C(=O)C [*] H(Me)	Me	Me	Me	allyl		viscous oil
I-53	4-CF ₃ Ph	CH ₂	S	CH(Me)	Me	Me	Me	H		amorphous
I-54	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	S	CH(Me)	Me	Me	Me	H		amorphous
I-55	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	SO ₂	CH(Me)	Me	Me	Me	H		amorphous
I-56	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	S	CH(Me)	Me	Me	Me	allyl		
I-57	4-CF ₃ Ph	CH ₂	NMe	C(=O)C [*] H ₂	H	Me	Me	H		mp:200°C
I-58	4-CF ₃ OPh	C(=O)	NH	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-59	4-CF ₃ Ph	CH ₂ CH ₂	NH	C(=O)	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-60	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	C(=O)	NH	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-61	4-((4-CF ₃ Ph)O)Ph	C(=O)	NEt	CH ₂	Me	Me	Me	H		mp:200°C
I-62	4-CF ₃ Ph	CH ₂	NMe	C(=O)C [*] H ₂	H	Me	Me	allyl		viscous oil

10

20

30

40

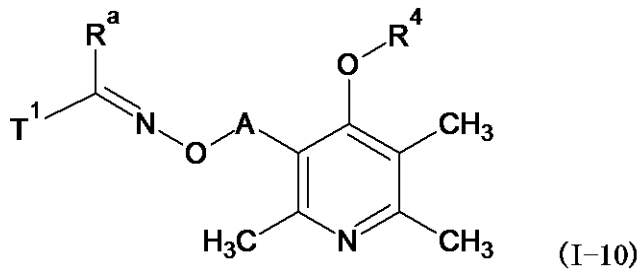
【0207】

表10は、式(I-10)で表される化合物における置換基を示す。化合物中のイミンの二重結合が、E配置である場合を「E」、Z配置である場合を「Z」、および両配置が混合している場合を「EZ」と表記する。

【0208】

50

【化 3 3】



【 0 2 0 9】

10

【表 1 0】

表10

化合物 番号	T ¹	R ^a	A	R ⁴	立体	物性
J-1	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O-N=C(Me)	Me	CH ₂	Ac	E	amorphous
J-2	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	H	CH ₂	Ac	E	amorphous
J-3	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	H	CH ₂	H	E	viscous oil
J-4	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O-N=C(Me)	Me	CH ₂	allyl	E	mp:90-92°C
J-5	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	H	CH ₂	allyl	E	viscous oil
J-6	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
J-7	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	Me	CH ₂	Ac	E	viscous oil
J-8	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	Me	CH ₂	H	E	amorphous

20

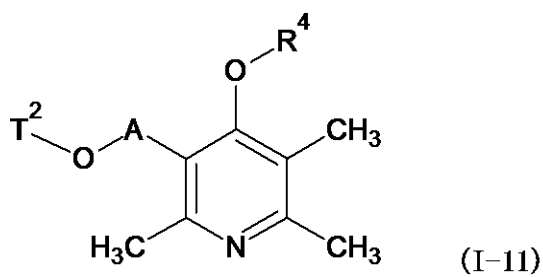
【 0 2 1 0】

表 1 1 は、式 (I-11) で表される化合物における置換基を示す。なお、T²における構造式中の*の付された炭素は酸素と結合する炭素を示す。

【 0 2 1 1】

30

【化 3 4】

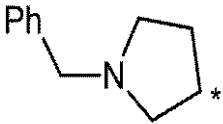
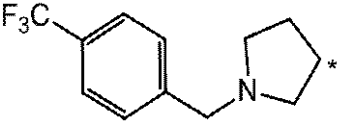
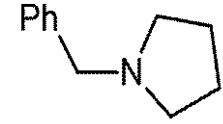
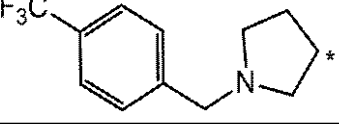
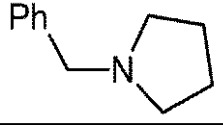


【 0 2 1 2】

40

【表 1 1】

表11

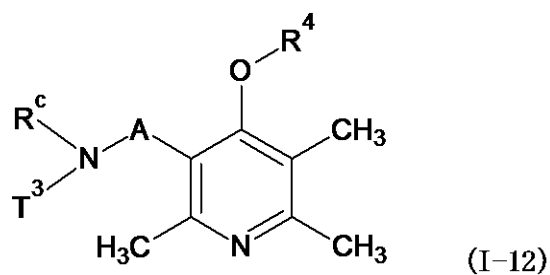
化合物 番号	T ²	A	R ⁴	立体	物性
K-1	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ N(Ac)	CH ₂	Ac		amorphous
K-2	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ N(CHO)	CH ₂	Ac		mp:62-65°C
K-3	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ OCH(Me)CH(Me)	CH ₂	Ac		viscous oil
K-4		CH ₂	Ac		viscous oil
K-5		CH ₂	Ac		viscous oil
K-6	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ N(Ac)	CH ₂	H		mp:185-188°C
K-7	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ N(CHO)	CH ₂	H		mp:155-158°C
K-8	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ OCH(Me)CH(Me)	CH ₂	H		amorphous
K-9		CH ₂	H		amorphous
K-10		CH ₂	H		mp:185-188°C
K-11	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ N(Ac)	CH ₂	allyl		amorphous
K-12	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ NH	CH ₂	allyl		amorphous
K-13		CH ₂	allyl		viscous oil

【0 2 1 3】

表 1 2 は、式 (I-11) で表される化合物における置換基を示す。

【0 2 1 4】

【化 3 5】



【0 2 1 5】

10

20

30

40

【表 1 2】

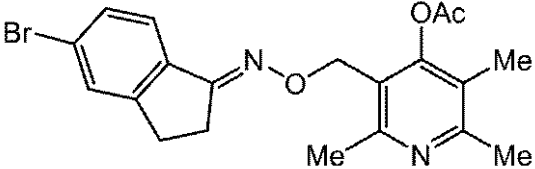
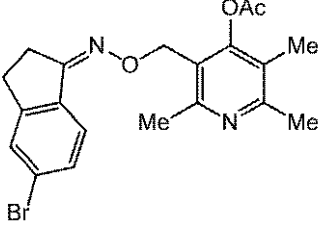
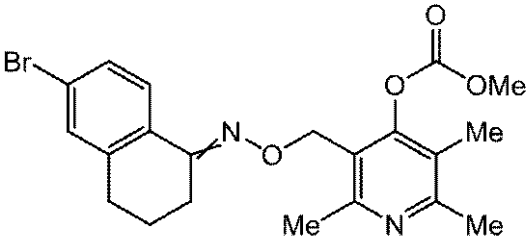
表12

化合物 番号	T ³	R ^c	A	R ⁴	立体	物性
L-1	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	H	C(=O)	Me		mp:128-130°C
L-2	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	Ac	CH ₂	Ac		mp:65-70°C
L-3	(4-CF ₃ Ph)CH(Me)CH(Me)O	Ac	CH ₂	Ac		viscous oil
L-4	(4-CF ₃ Ph)CH(Me)CH(Me)O	CO(4-CF ₃ OPh)	CH ₂	Ac		viscous oil
L-5	(4-CF ₃ Ph)CH(Me)CH(Me)O	CO ⁿ Pr	CH ₂	Ac		viscous oil
L-6	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	H	CH ₂	H		mp:168-175°C
L-7	(4-CF ₃ Ph)CH(Me)CH(Me)O	H	CH ₂	H		viscous oil
L-8	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	H	CH ₂	allyl		viscous oil
L-9	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	Me	CH ₂	allyl		viscous oil
L-10	(4-CF ₃ Ph)CH ₂ O	CO ₂ ^t Bu	CH ₂	allyl		amorphous
L-11	(4-CF ₃ Ph)CH(Me)CH(Me)O	H	CH ₂	allyl		viscous oil

【 0 2 1 6 】

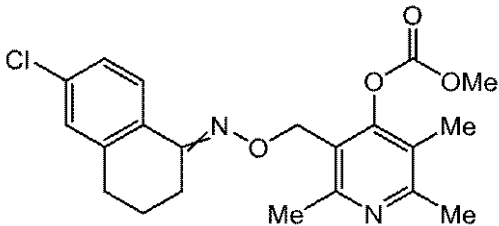
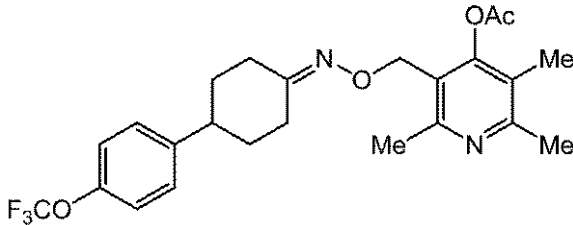
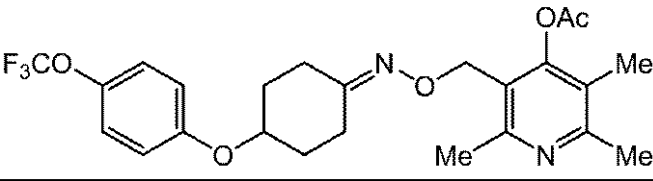
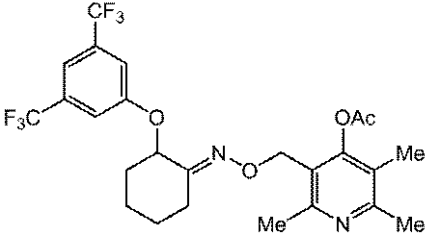
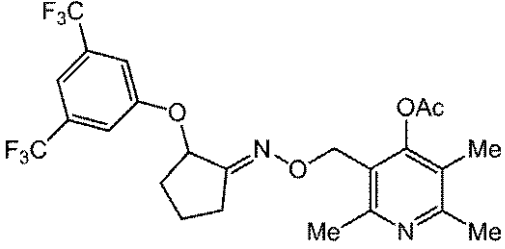
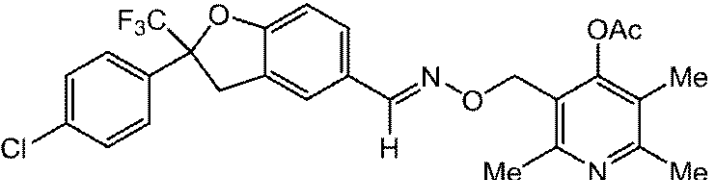
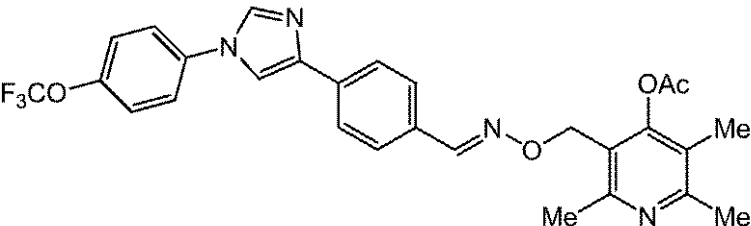
【表 1 3】

表13

化合物 番号		物性
M-1		mp:80-82°C
M-2		mp:100-104°C
M-3		mp:72-76°C

【 0 2 1 7 】

表13(続き)

化合物 番号		物性
M-4		viscous oil
M-5		mp:124-126°C
M-6		mp:76-78°C
M-7		amorphous
M-8		mp:80-84°C
M-9		viscous oil
M-10		mp:200°C

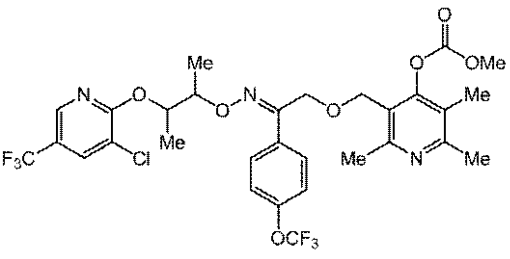
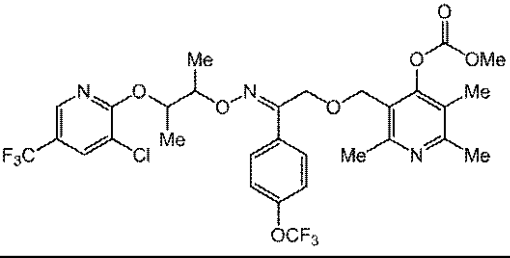
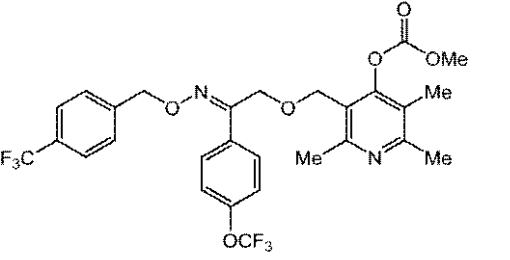
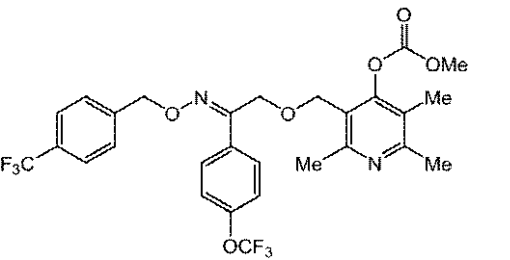
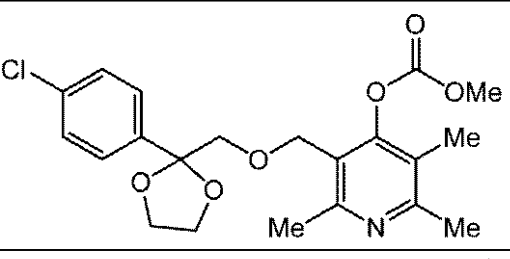
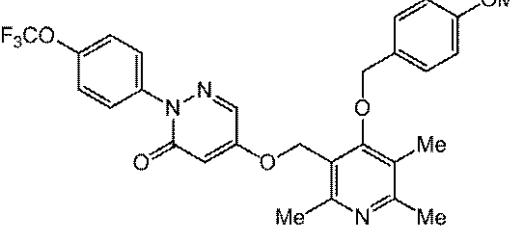
10

20

30

40

表13(続き)

化合物 番号		物性
M-11		viscous oil
M-12		viscous oil
M-13		viscous oil
M-14		viscous oil
M-15		viscous oil
M-16		amorphous

10

20

30

40

表13(続き)

化合物 番号		物性
M-17		mp:101-107°C
M-18		viscous oil
M-19		amorphous
M-20		mp:200°C
M-21		mp:200-205°C
M-22		mp:200°C

10

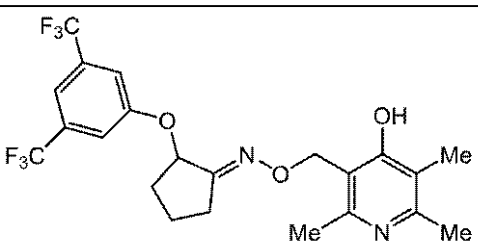
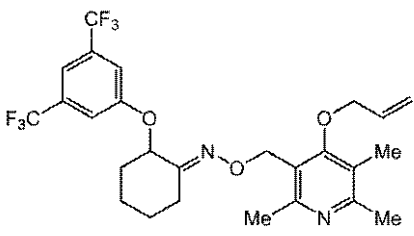
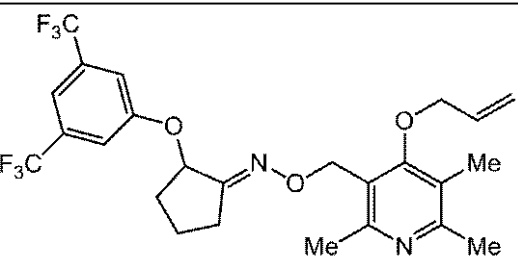
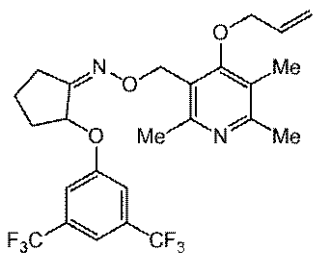
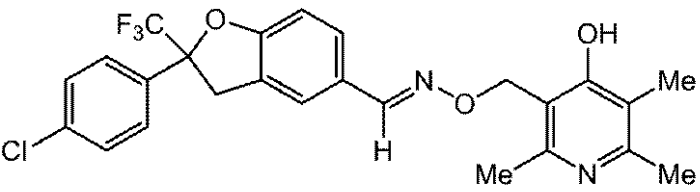
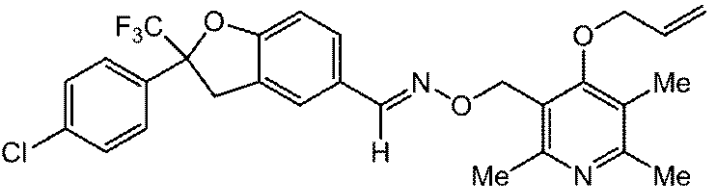
20

30

40

【 0 2 2 0 】

表13(続き)

化合物 番号		物性
M-23		mp:200°C
M-24		viscous oil
M-25		viscous oil
M-26		viscous oil
M-27		mp:200°C
M-28		viscous oil

10

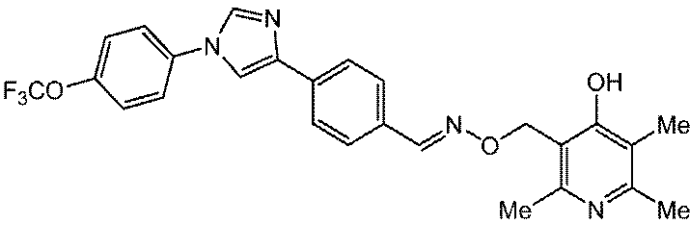
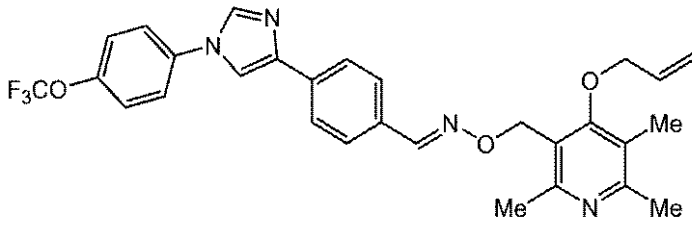
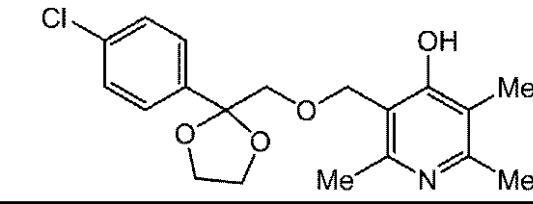
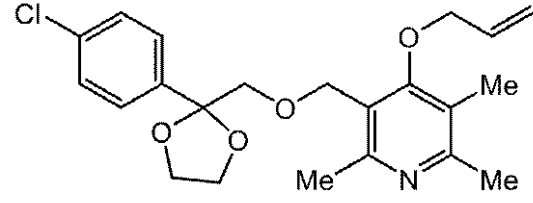
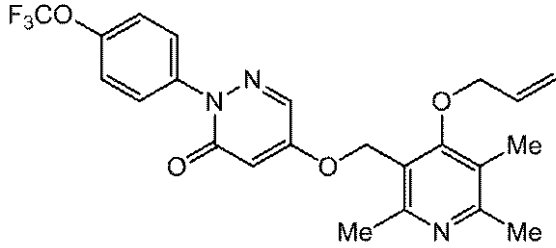
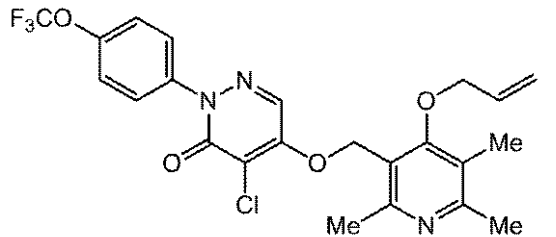
20

30

40

【 0 2 2 1 】

表13(続き)

化合物 番号		物性
M-29		mp:200°C
M-30		mp:104-106°C
M-31		mp:200°C
M-32		viscous oil
M-33		amorphous
M-34		amorphous

10

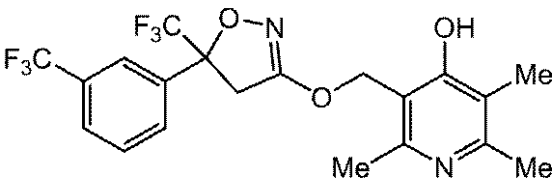
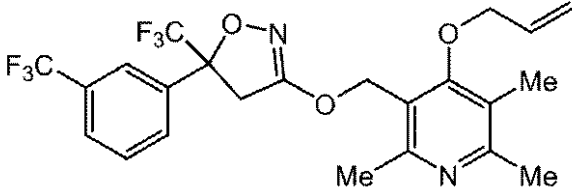
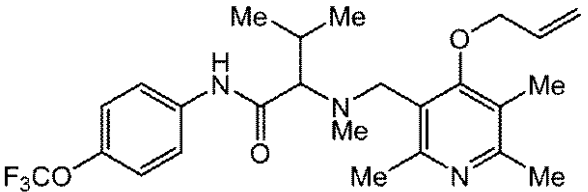
20

30

40

【 0 2 2 2 】

表13(続き)

化合物 番号		物性
M-35		amorphous
M-36		viscous oil
M-37		viscous oil

10

20

【 0 2 2 3 】

上記の表 1 ～ 表 1 3 に記載した化合物のいくつかについて、 ^1H -NMR データを、表 1 4 に示す。

【 0 2 2 4 】

【 表 1 4 】

表14

化合物 番号	NMR
A-1	2.03(s,3H), 2.10(s,3H), 2.29(s,3H), 2.51(s,3H), 2.61(s,3H), 5.12(s,2H), 7.31(d,1H), 7.46(t,1H), 7.54(t,1H), 7.67(d,1H).
A-3	2.05(s,3H), 2.34(s,3H), 2.50(s,3H), 2.63(s,3H), 3.26(s,3H), 4.52(s,2H), 5.19(s,2H), 7.62(t,1H), 7.59(t,1H), 7.81(d,1H), 7.95(s,1H).
A-4	1.97(3H,s), 2.32(3H,s), 2.50(3H,s), 2.65(3H,s), 5.12(2H,s), 7.18-7.70(4H,m), 7.98(1H,s).
A-5	1.98-2.70(15H,m), 5.08(2H,s), 7.15-7.80(4H,m).
A-7	1.62-2.62(15H,m), 5.64(1H,m), 7.19-8.22(5H,m).
A-8	1.99, 2.06, 2.09, 2.12, 2.18, 2.31, 2.46, 2.51 and 2.52(9s,total 15H), 4.95 and 4.15(2s,total 1H), 7.08-7.45(m,total 4H).
A-12	1.57-2.70(18H,m), 6.05(1H,s), 7.10-7.50(4H,m).
A-17	1.61-2.63(15H,m), 5.61(1H,m), 6.95-7.90(9H,m).
A-18	1.66-2.62(15H,m), 5.62(1H,m), 7.02-8.29(9H,m).
A-19	2.05-2.65(12H,m), 5.13(2H,s), 6.95-7.98(9H,m).
A-21	1.62-2.63(15H,m), 5.60(1H,m), 6.92-8.09(9H,m).
A-22	1.56-2.63(15H,m), 5.36(1H,m), 6.99-7.90(9H,m).
A-23	1.62-2.72(15H,m), 5.60(1H,m), 6.98-8.02(4H,m).
A-24	1.69-2.60(15H,m), 5.60(1H,m), 7.08-7.92(4H,m).
A-27	2.05(s,3H), 2.12(s,3H), 2.31(s,3H), 2.50(s,3H), 2.63(s,3H), 4.32(q,2H), 5.14(s,2H), 6.34(d,1H), 7.05(t,1H), 7.30-7.37(m,2H).

30

40

【 0 2 2 5 】

表14(続き)

化合物 番号	NMR
B-1	2.05(3H,s), 2.31(3H,s), 2.49(3H,s), 2.53(3H,s), 6.08(1H,d), 6.81(1H,d), 6.94-7.31(4H,m).
B-2	2.08(3H,s), 2.31(3H,s), 2.47(3H,s), 2.49(3H,s), 5.50(1H,d), 6.62(1H,d), 6.93-7.29(4H,m).
B-3	2.06(3H,s), 2.32(3H,s), 2.49(3H,s), 2.53(3H,s), 6.10(1H,d), 6.81(1H,d), 7.01-7.21(4H,m).
B-4	2.09(3H,s), 2.28(3H,s), 2.50(3H,s), 2.56(3H,s), 5.54(1H,d), 6.63(1H,d), 6.98-7.18(4H,m).
B-6	2.09(3H,s), 2.40(3H,s), 2.57(3H,s), 2.65(3H,s), 5.19(2H,s), 7.07-7.59(4H,m).
B-7	2.04(3H,s), 2.18(3H,s), 2.46(3H,s), 2.51(3H,s), 4.66(2H,d), 6.11(1H,m), 6.52(1H,d), 6.90-7.16(4H,m).
B-8	2.21(3H,s), 2.48(3H,s), 2.59(3H,s), 4.68(2H,d), 6.14-6.53(2H,m), 6.90-7.16(4H,m).
B-9	1.95-2.57(15H,m), 4.66(2H,d), 5.59(1H,s), 6.89-7.19(4H,m).
B-10	2.06-2.49(15H,m), 4.55(2H,s), 6.24(1H,s), 6.91-7.16(4H,m).
B-11	2.07(3H,s), 2.26(3H,s), 2.42(3H,s), 2.51(3H,s), 4.40(2H,d), 6.06(2H,m), 6.38(2H,d), 6.81-7.49(4H,m).
B-14	2.11(3H,s), 2.48(3H,s), 2.49(3H,s), 3.84(3H,s), 4.76(2H,d), 6.17-6.63(2H,m), 7.35(2H,s), 7.47(1H,s).
B-16	2.03-2.54(12H,m), 3.40(2H,m), 6.21-6.36(2H,m), 7.21-7.29(4H,m).
B-18	2.05-2.50(12H,m), 4.18(2H,d), 4.61(2H,s), 6.03-6.47(2H,m), 7.46-7.66(4H,m).
B-20	1.05(3H,t), 1.80-1.95(2H,m), 2.09(3H,s), 2.48(3H,s), 2.51(3H,s), 3.79(3H,s), 4.00(2H,q), 4.79(2H,q), 6.19-6.64(2H,d), 6.94-7.18(3H,m).
B-31	0.80-1.59(4H,m), 2.04(3H,s), 2.38(3H,s), 2.46(3H,s), 2.61(3H,s), 3.87-4.05(2H,m), 6.86-7.15(4H,m).
B-32	0.80-1.68(4H,m), 2.04(3H,s), 2.39(3H,s), 2.46(3H,s), 2.63(3H,s), 3.87-4.09(2H,m), 6.91-7.54(8H,m).
B-33	0.97-1.74(4H,m), 2.09(3H,s), 2.47(3H,s), 2.62(3H,s), 3.90(3H,s), 4.07-4.13(2H,m), 7.32(2H,s), 7.46(1H,s).

10

20

【 0 2 2 6 】

表14(続き)

化合物 番号	NMR
C-2	2.03(3H,s), 2.28(3H,s), 2.47(3H,s), 2.49(3H,s), 4.04(2H,s), 7.39-7.54(4H,m).
C-5	1.76-1.82(2H,m), 2.01(3H,s), 2.34(3H,s), 2.45(3H,s), 2.58-2.64(2H,m), 2.93(2H,t), 6.96-7.58(8H,m).
C-9	2.03(3H,s), 2.24(3H,s), 2.34(3H,s), 2.46(3H,s), 3.67(2H,d), 5.96-6.22(2H,m), 6.96-7.57(8H,m).
C-10	0.81(3H,t), 1.09-1.61(6H,m), 1.89-2.01(5H,m), 2.44(3H,s), 2.50(3H,s), 2.79-2.92(2H,m), 3.27-3.34(1H,m), 3.74(3H,s), 3.89-3.97(1H,m), 7.17-7.42(4H,m).
C-11	0.82(3H,t), 1.11-1.59(6H,m), 2.00-2.09(5H,m), 2.44(3H,s), 2.49(3H,s), 2.81-2.85(2H,m), 3.68-3.72(2H,m), 3.75(3H,s), 6.99-7.47(4H,m).
C-14	0.82(3H,t), 1.18-1.61(8H,m), 2.00-2.05(5H,m), 2.44(3H,s), 2.52(3H,s), 2.79-2.84(2H,m), 3.66-3.72(5H,m), 7.16-7.258(4H,m).
C-15	0.82(3H,t), 1.12-1.59(6H,m), 2.00-2.04(5H,m), 2.44(3H,s), 2.52(3H,s), 2.80-2.84(2H,m), 3.67-3.72(5H,m), 7.16-7.28(4H,m).
C-16	0.82(6H,t), 1.36-1.43(4H,m), 2.02(3H,s), 2.08-2.12(1H,m), 2.46(3H,s), 2.60(3H,s), 3.69-3.74(5H,m), 7.20-7.31(4H,m).
C-18	0.83(3H,t), 1.54-1.64(2H,m), 1.98-2.03(5H,m), 2.44(3H,s), 2.53(3H,s), 2.79-2.83(2H,m), 3.67-3.72(5H,m), 7.16-7.28(4H,m).
C-19	0.84(3H,t), 1.12-1.38(14H,m), 1.51-1.59(2H,m), 2.03(3H,s), 2.44(3H,s), 2.51(3H,s), 2.79-2.83(2H,m), 3.66-3.71(5H,m), 7.15-7.27(4H,m).
C-22	2.03(3H,s), 2.46(3H,s), 2.54(3H,s), 2.94-2.98(2H,m), 3.81(3H,s), 3.94-3.99(2H,m), 6.99-7.54(8H,m).
C-24	2.04(s, 3H), 2.48(s, 3H), 2.52(s, 3H), 2.85-2.89(m, 2H), 3.66-3.70(m, 2H), 3.74(brs, 1H), 3.82(s, 3H), 7.01-7.60(m, 8H).
C-25	2.09(3H,s), 2.48(3H,s), 2.53(3H,s), 2.77(2H,t), 3.44(2H,t), 3.89(3H,s), 6.75-7.52(8H,m).
C-28	0.84(3H,t), 1.52-1.64(2H,m), 1.98-2.03(5H,m), 2.45(3H,s), 2.49(3H,s), 2.79-2.84(2H,m), 3.65-3.70(2H,m), 3.82(3H,s), 6.99-7.96(7H,m).
C-32	1.69-1.79(2H,m), 2.00-3.38(19H,m), 6.67-7.52(8H,m).

10

20

【 0 2 2 7 】

表14(続き)

化合物 番号	NMR
D-2	1.59-2.59(18H,m), 3.44(2H,m), 5.50(1H,m), 7.30-7.49(4H,m).
D-3	1.40(d,3H), 1.56(s,3H), 2.04(s,3H), 2.50(s,3H), 2.60(s,3H), 3.61(q,1H), 5.07(s,2H), 7.30-7.48(m,4H).
D-6	1.35 and 1.40(2d,total 3H), 2.03, 2.29, 2.31, 2.49, 2.52 and 2.57(6s,total 12H), 3.60-3.70 and 4.25-4.35(m,total 1H), 5.01(s,total 2H), 6.70(d), 7.25-7.30(m), 7.36(d) and 7.50-7.60(m)(total 5H).
D-7	1.39(d,3H), 1.56(s,3H), 2.04(s,3H), 2.32(s,3H), 2.50(s,3H), 2.60(s,3H), 3.61(q,1H), 5.06(s,2H), 7.27(d,2H), 7.52(s,3H).
D-8	1.24-2.57(21H,m), 3.58(1H,m), 5.51(1H,m), 7.22-7.54(4H,m).
D-9	1.42(s,6H), 1.47(s,3H), 2.05(s,3H), 2.34(s,3H), 2.51(s,3H), 2.63(s,3H), 5.09(s,2H), 7.28(d,2H), 7.51(d,2H).
D-10	1.44(s,6H), 2.04(s,3H), 2.32(s,3H), 2.51(s,3H), 2.60(s,3H), 5.04(s,2H), 7.30-7.36(m,3H), 7.53(d,2H).
D-13	1.38(d,3H), 1.56(s,3H), 2.04(s,3H), 2.32(s,3H), 2.50(s,3H), 2.60(s,3H), 3.58(q,1H), 5.06(s,2H), 7.00-7.15(m,3H), 7.29(t,1H).
D-14	1.67-2.77(19H,m), 5.45(1H,m), 7.07-7.21(5H,m).
D-15	1.54-2.81(19H,m), 5.44(1H,m), 6.58-7.22(5H,m).
D-16	1.42(d,3H), 1.59(s,3H), 2.04(s,3H), 2.31(s,3H), 2.50(s,3H), 2.59(s,3H), 3.67(q,1H), 5.07(s,2H), 7.59(s,2H), 7.72(s,1H).
D-17	2.03, 2.05, 2.05, 2.07, 2.49, 2.51, 2.57 and 2.60(8s,total 12H), 4.60 and 4.76(2d,total 2H), 5.06 and 5.13(2s, total 2H), 6.89-6.96 and 7.45-7.55(m,total 5H).
D-19	1.16(s,9H), 2.03(s,3H), 2.24(s,3H), 2.49(s,3H), 2.58(s,3H), 4.67(s,2H), 5.07(s,2H), 6.94(d,2H), 7.49(d,2H).
D-20	1.42 and 1.49(2d,total 3H), 2.02, 2.03, 2.28, 2.35, 2.49, 2.52, 2.55 and 2.62(8s,total 12H), 4.85-4.95 and 5.30-5.40(m,total 1H), 5.01 and 5.11(2s,total 2H), 6.82, 6.92, 7.22 and 7.44(4d,total 5H).
D-21	1.38 and 1.46(2d,total 3H), 1.68, 2.03, 2.05, 2.27, 2.35, 2.50, 2.52 and 2.57(8s,total 15H), 4.86 and 5.46(2q,total 1H), 5.00-5.10(m,total 2H), 6.76 and 6.91(2d,total 2H), 7.39-7.44(m,total 2H).
D-22	1.48(s,6H), 1.76(s,3H), 2.06(s,3H), 2.33(s,3H), 2.52(s,3H), 2.62(s,3H), 5.08(s,2H), 6.76(d,2H), 7.30(d,2H).
D-23	1.36 and 1.45(2d,total 3H), 1.70, 2.03, 2.06, 2.26, 2.35, 2.49, 2.51, 2.55 and 2.61(9s,total 15H), 4.71 and 5.42(2q,total 1H), 5.00-5.10(m,total 2H), 6.60-6.66, 6.75-6.85 and 7.15-7.20(m,total 4H).
D-24	1.36 and 1.45(2d,total 3H), 1.70, 2.03, 2.04, 2.26, 2.35, 2.49, 2.51, 2.55 and 2.61(9s,15H), 4.81 and 5.42(2q,total 1H), 4.95-5.10(m,2H), 6.75-6.85 and 7.15-7.20(m, total 5H).
D-25	1.26 and 1.27(s,total 9H), 1.36 and 1.44(2d,total 3H), 1.72, 2.03, 2.05, 2.25, 2.35, 2.49, 2.51, 2.56 and 2.62(9s,total 15H), 4.85 and 5.42(2q,1H), 4.95-5.10(m,total 2H), 6.58-7.18(m,total 4H).
D-26	1.27(s,9H), 1.34 and 1.39(2d,total 3H), 1.72, 2.03, 2.06, 2.25, 2.35, 2.50, 2.52, 2.57 and 2.53(9s,total 15H), 4.80 and 5.40(2q,total 1H), 5.02-5.05(m,total 2H), 6.64(d), 6.83(d) and 7.16-7.25(m)(total 4H).
D-27	1.43 and 1.52(2d,total 3H), 2.02, 2.06, 2.28, 2.34, 2.49, 2.49, 2.51, 2.53 and 2.60(8s,total 12H), 4.90-5.05(m), 5.13(s) and 5.35-5.45(m)(total 3H), 6.64(d), 7.19-7.25 and 7.35-7.44(m,total 4H).
D-28	1.39-1.53(3H,m), 1.67-1.73(3H,m), 2.03-2.50(12H,m), 4.91-5.52(3H,m), 7.21-7.44(3H,m).
D-29	1.49(d,3H), 1.71(s,3H), 2.05(s,3H), 2.27(s,3H), 2.49(s,3H), 2.55(s,3H), 4.91(q,1H), 4.95-5.10(m,2H), 7.38(s,2H), 7.42(s,1H).

10

20

30

40

表14(続き)

化合物番号	NMR
D-31	1.39 and 1.48(2d,total 3H), 1.60, 1.74, 1.81, 2.04, 2.30, 2.34, 2.48, 2.49, 2.55 and 2.60 (10s,total 15H), 4.97-5.08(m,total 2H), 5.68 and 6.13(2q,total 1H), 7.14(s) and 7.42(s)(total 1H).
D-32	1.79, 1.93, 2.04, 2.04, 2.09, 2.31, 2.34, 2.48, 2.50 and 2.52 (10s,total 15H), 4.63-4.65(m,total 2H), 5.02(bs,total 2H), 7.50-7.62(m,total 2H).
D-33	1.55(d,2H), 2.00(s,3H), 2.01(s,3H), 2.32(s,3H), 2.41(s,3H), 2.48(s,3H), 4.89(bs,2H), 5.14(q,1H), 7.53(s,1H), 7.55(s,1H).
D-39	1.46(d,3H), 1.68(s,3H), 2.03(s,3H), 2.26(s,3H), 2.50(s,3H), 2.57(s,3H), 4.85(q,1H), 4.98-5.10(m,2H), 6.91(d,2H), 7.40(d,2H).

10

【 0 2 2 9 】

表14(続き)

化合物番号	NMR
E-1	1.82-2.72(16H,m), 3.37(2H,t), 4.39(2H,s), 7.23-7.51(4H,m).
E-2	1.57-2.61(18H,m), 3.38(2H,t), 4.38(2H,s), 7.08-7.16(4H,m).
E-3	1.55-2.54(18H,m), 3.37(2H,t), 3.77(3H,s), 4.37(2H,s), 6.78-7.08(4H,m).
E-4	2.11-2.47(12H,m), 4.85(2H,s), 4.90(2H,s), 7.15-7.39(4H,m).
E-5	1.52-2.98(18H,m), 3.68(1H,m), 3.86(3H,s), 4.44(2H,s), 7.17-7.36(4H,m).
E-6	1.38-2.93(18H,m), 3.34(1H,m), 3.91(3H,s), 4.52(2H,s), 7.19-7.35(4H,m).
E-7	1.36-2.60(18H,m), 3.68(1H,m), 3.85(3H,s), 4.44(2H,s), 7.02-7.31(4H,m).
E-8	1.31-2.58(18H,m), 3.33(1H,m), 3.91(3H,s), 4.52(2H,s), 7.02-7.30(4H,m).
E-9	1.32-1.50(2H,m), 1.89-2.58(17H,m), 3.29-3.36(1H,m), 4.52(2H,s), 7.10-7.20(4H,m).
E-10	1.46-2.60(21H,m), 3.64(1H,m), 4.38(2H,m), 7.09-7.22(4H,m).
E-11	1.31-1.51(2H,m), 1.89-2.58(14H,m), 3.29-3.37(1H,m), 3.91(3H,s), 4.52(2H,s), 7.10-7.20(4H,m).
E-13	1.49-2.61(18H,m), 3.68(1H,m), 4.45(2H,s), 4.79(2H,s), 7.08-7.21(4H,m).
E-14	1.35-2.59(18H,m), 3.34(1H,m), 4.53(2H,s), 4.88(2H,s), 7.10-7.20(4H,m).
E-17	1.24-2.55(21H,m), 3.41(1H,m), 3.82(2H,q), 4.55(2H,s), 5.10(2H,s), 7.11-7.21(4H,m).
E-18	1.24-2.58(21H,m), 3.73(1H,m), 3.83(2H,q), 4.47(2H,s), 5.12(2H,s), 7.09-7.20(4H,m).
E-20	0.94-2.58(23H,m), 3.71(3H,m), 4.47(2H,s), 5.13(2H,s), 7.09-7.20(4H,m).
E-21	0.93-2.55(23H,m), 3.42(1H,m), 3.72(2H,t), 4.55(2H,s), 5.10(2H,s), 7.11-7.21(4H,m).
E-28	1.36-2.57(18H,m), 3.40(1H,m), 3.82(3H,s), 4.57(2H,s), 4.85(2H,s), 6.91-7.38(8H,m).
E-29	1.38-2.59(18H,m), 3.72(1H,m), 3.81(3H,s), 4.50(2H,s), 4.87(2H,s), 6.88-7.36(8H,m).
E-30	1.33-2.60(18H,m), 3.69(1H,m), 3.76(3H,s), 4.52(2H,s), 4.95(2H,s), 6.86-7.52(8H,m).
E-31	1.33-2.57(18H,m), 3.52(1H,m), 3.84(3H,s), 4.58(2H,s), 4.93(2H,s), 6.90-7.51(8H,m).
E-32	1.36-2.57(18H,m), 3.39(1H,m), 3.83(3H,s), 4.57(2H,s), 4.89(2H,s), 6.88-7.33(8H,m).
E-33	1.35-2.59(18H,m), 3.41(1H,m), 3.85(3H,s), 3.88(3H,s), 4.60(2H,s), 4.95(2H,s), 7.10-7.19(7H,m).
E-34	1.39-2.59(18H,m), 3.71(1H,m), 3.87(3H,s), 3.89(3H,s), 4.50(2H,s), 4.90(2H,s), 6.82-7.18(7H,m).
E-35	1.38-2.57(18H,m), 3.41(1H,m), 3.87(3H,s), 3.89(3H,s), 4.57(2H,s), 4.86(2H,s), 6.83-7.20(7H,m).
E-36	1.34-2.59(18H,m), 3.38(1H,m), 3.80(6H,s), 4.57(2H,s), 4.85(2H,s), 6.44-7.19(7H,s).
E-37	1.36-2.59(18H,m), 3.41(1H,m), 4.56(2H,s), 4.81(2H,s), 5.98(2H,s), 6.83-7.21(7H,m).

20

30

40

【 0 2 3 0 】

表14(続き)

化合物 番号	NMR
E-38	1.34-2.60(21H,m), 3.35(1H,m), 3.76(3H,s), 4.56(2H,s), 5.03(2H,s), 6.72-7.23(7H,m).
E-39	1.37-2.59(18H,m), 3.36(1H,m), 3.79(6H,s), 4.58(2H,s), 4.91(2H,s), 6.83-7.19(7H,m).
E-40	1.36-2.59(18H,m), 3.36(1H,m), 3.79(6H,s), 4.58(2H,s), 4.91(2H,s), 6.83-7.19(7H,m).
E-41	1.37-2.57(18H,m), 3.41(1H,m), 3.80(3H,s), 4.66(2H,s), 4.88(2H,s), 5.95(2H,s), 6.32-7.19(6H,m).
E-42	1.30-2.60(21H,m), 3.68(1H,m), 4.04(2H,q), 4.52(2H,s), 4.96(12H,s), 6.85-7.55(8H,m).
E-43	1.31-2.57(2H,m), 3.35(1H,m), 4.04(2H,q), 4.58(2H,s), 4.95(2H,s), 6.87-7.55(8H,m).
E-44	1.33-2.57(18H,m), 3.37(1H,m), 3.45(3H,s), 4.58(2H,s), 4.97(2H,s), 5.21(2H,s), 7.05-7.53(8H,m).
E-45	1.35-2.57(18H,m), 3.33(1H,m), 3.39(3H,s), 3.68(2H,m), 4.11(2H,m), 4.57(2H,s), 4.96(2H,s), 6.89-7.69(8H,m).
E-46	1.36-2.57(18H,m), 3.41(1H,m), 4.60(2H,s), 4.89(2H,s), 6.00(2H,s), 6.84-7.18(7H,m).
E-47	1.33-2.54(21H,m), 3.28(1H,m), 3.75(3H,s), 4.46(2H,m), 5.47(1H,m), 6.86-7.68(8H,m).
E-48	1.36-2.57(18H,m), 3.37(1H,m), 4.27(4H,s), 4.58(2H,s), 4.90(2H,s), 6.88-7.67(7H,m).
E-49	1.33-2.58(18H,m), 3.35(1H,m), 4.59(2H,s), 5.04(2H,s), 7.18-8.56(8H,m).
E-50	1.34-2.62(18H,m), 3.37(1H,m), 3.92(3H,s), 4.53(2H,s), 7.62-7.70(3H,m).
E-51	1.49-2.63(18H,m), 3.68(1H,m), 3.86(3H,s), 4.45(2H,s), 7.66-7.68(3H,m).
E-52	1.72-2.58(18H,m), 3.66(1H,m), 4.48(2H,s), 5.95(1H,m), 7.12-7.36(4H,m).
E-53	1.38-2.59(15H,m), 3.69(1H,m), 3.92(3H,s), 4.53(2H,m), 5.65(1H,m), 7.18-7.25(4H,m).
E-54	0.88(3H,t), 1.30-1.75(8H,m), 2.06(3H,s), 2.39(3H,s), 2.47(3H,s), 4.18(2H,t), 4.42(2H,s), 4.63(2H,s), 7.16-7.71(4H,m).
E-55	0.86(3H,t), 1.27-1.72(8H,m), 2.07(3H,s), 2.40(3H,s), 2.48(3H,s), 3.83(3H,s), 4.11(2H,t), 4.32(2H,s), 4.47(2H,s), 7.19-7.71(4H,m).
E-56	0.92(3H,t), 1.35-1.72(4H,m), 2.06(3H,s), 2.41(3H,s), 2.47(3H,s), 3.81(3H,s), 4.18(2H,t), 4.41(2H,s), 4.62(2H,s), 7.28-7.61(4H,m).
E-57	0.93(3H,t), 1.31-1.69(4H,m), 2.07(3H,s), 2.41(3H,s), 2.48(3H,s), 3.82(3H,s), 4.11(2H,t), 4.30(2H,s), 4.46(2H,s), 7.32-7.59(4H,m).
E-58	1.52-2.89(18H,m), 3.67(1H,m), 3.89(3H,s), 4.45(2H,s), 7.29-8.75(3H,m).
E-59	1.43-2.88(18H,m), 3.35(1H,m), 3.91(3H,s), 4.51(2H,s), 7.23-8.77(3H,m).
E-60	1.41-2.54(17H,m), 3.40-4.30(5H,m), 5.38(2H,s), 6.88(1H,s).
E-61	1.35-2.55(17H,m), 3.71-4.22(5H,m), 4.41(2H,s), 6.55(1H,s), 7.50(1H,s).
E-63	1.82-2.20(m, 9H), 2.08(s, 3H), 2.48(s, 3H), 2.57(s, 3H), 3.57(m, 1H), 3.90(s, 3H), 4.40(s, 2H), 4.47(m, 1H), 6.49(d, 1H), 7.55(d, 1H), 8.36(s, 1H).
E-64	1.19-1.25(6H,m), 2.02-2.53(12H,m), 3.59-4.53(4H,m), 6.82-7.11(4H,m).
E-65	1.56-2.57(20H,m), 3.41(1H,m), 4.32(1H,m), 4.42(2H,m), 6.84-7.11(4H,m).
E-67	1.73(m, 2H), 2.00(m, 2H), 2.08(s, 3H), 2.49(s, 3H), 2.56(d, 3H), 3.93(m, 2H), 3.40-3.52(m, 3H), 3.87-3.90(m, 3H), 4.46-4.51(m, 2H), 6.87(d, 2H), 7.07(d, 2H).
E-68	1.20-1.31(6H,m), 2.02-2.47(12H,m), 3.71(1H,m), 5.39(1H,m), 7.81-8.27(2H,m).
E-69	1.77-1.86(2H,m), 2.03-2.68(11H,m), 3.54(2H,t), 3.84(3H,s), 3.86(3H,s), 4.55(2H,s), 7.04-7.52(3H,m).
E-71	1.81-1.85(2H,m), 2.06(3H,s), 2.47(3H,s), 2.51(3H,s), 2.64-2.68(2H,m), 3.58(2H,t), 4.73(2H,s), 7.80-7.89(3H,m).
E-72	1.78-1.83(2H,m), 2.06(3H,s), 2.46(3H,s), 2.50(3H,s), 2.62-2.68(2H,m), 3.57(2H,t), 3.84(3H,s), 4.41(2H,q), 4.58(2H,s), 7.01-7.60(3H,m).
E-73	1.80-1.90(2H,m), 2.06(3H,s), 2.47(3H,s), 2.51(3H,s), 2.63-2.69(2H,m), 3.59(2H,t), 3.84(3H,s), 4.61(2H,s), 7.52-7.65(3H,m).

10

20

30

40

表14(続き)

化合物 番号	NMR
E-74	1.76-1.81(2H,m), 2.06(3H,s), 2.46(3H,s), 2.50(3H,s), 2.61-2.64(2H,m), 3.49(2H,t), 3.83(3H,s), 4.90(2H,s), 7.17-7.37(4H,m).
E-75	1.81-1.88(2H,m), 2.06(3H,s), 2.47(3H,s), 2.50(3H,s), 2.62-2.65(2H,m), 3.55(2H,t), 3.82(3H,s), 4.60(2H,s), 7.79(3H,s).
E-76	1.71-1.76(2H,m), 2.05(3H,s), 2.46-2.64(8H,m), 3.37-3.60(7H,m), 3.87(3H,s), 4.44-4.48(1H,m), 7.18-7.36(4H,m).
E-77	1.72-1.83(2H,m), 2.02(3H,s), 2.45(3H,s), 2.49(3H,s), 2.60-2.69(2H,m), 3.41-3.49(2H,m), 3.78(3H,s), 7.21-7.35(9H,m).
E-78	1.74-1.81(2H,m), 2.05(3H,s), 2.46(3H,s), 2.49(3H,s), 2.60-2.68(2H,m), 3.44-3.48(2H,m), 3.78(3H,s), 7.14-7.38(9H,m).
E-79	1.72-1.80(2H,m), 2.09(3H,s), 2.49(3H,s), 2.51(3H,s), 2.62-2.68(2H,m), 3.44(2H,t), 3.81(3H,s), 7.16-7.31(8H,m).
E-80	0.97(3H,t), 1.69-1.98(4H,m), 2.05(3H,s), 2.45(3H,s), 2.48(3H,s), 2.56-2.62(2H,m), 3.27-3.41(2H,m), 3.89(3H,s), 4.85(1H,t), 7.89(1H,s), 8.81(1H,s).
E-81	2.05-2.50(12H,m), 4.18(2H,d), 4.61(2H,s), 6.03-6.47(2H,m), 7.46-7.66(4H,m).
E-82	2.11(2H,s), 2.49(3H,s), 2.50(3H,s), 3.81(3H,s), 3.86(3H,s), 4.24(2H,d), 4.61(2H,s), 6.10-6.52(2H,m), 7.05-7.55(3H,m).
E-83	1.79-1.87(2H,m), 2.11-2.50(9H,m), 3.82(3H,s), 3.97(2H,t), 4.24(2H,d), 4.63(2H,s), 6.10-6.52(2H,m), 7.03-7.55(3H,m).
E-84	2.11-2.50(9H,m), 3.82(3H,s), 4.24-4.26(2H,m), 4.80(2H,s), 6.09-6.54(2H,m), 7.82-7.94(3H,m).
E-85	2.10(3H,s), 2.48(3H,s), 2.49(3H,s), 3.82(3H,s), 4.23-4.26(2H,m), 4.42(2H,q), 4.65(2H,s), 6.09-6.52(2H,m), 7.03-7.63(3H,m).
E-86	2.11(3H,s), 2.49(3H,s), 2.50(3H,s), 3.83(3H,s), 4.27(2H,d), 4.67(2H,s), 6.10-6.54(2H,m), 7.53-7.69(3H,m).
E-88	2.11(3H,s), 2.49(3H,s), 2.50(3H,s), 3.82(3H,s), 4.24(2H,d), 4.66(2H,s), 6.10-6.53(2H,m), 7.80-7.82(3H,m).
E-90	1.44(3H,d), 2.05-2.50(12H,m), 3.94-4.05(2H,m), 4.51(1H,q), 5.97-6.37(2H,m), 7.18-7.36(4H,m).
E-91	0.89(3H,t), 1.60-1.88(2H,m), 2.05-2.47(12H,m), 3.89-4.26(3H,m), 5.96-6.38(2H,m), 7.18-7.33(4H,m).
E-92	0.89(3H,t), 1.65-1.84(2H,m), 2.04-2.48(12H,m), 3.91-4.27(3H,m), 5.96-6.38(2H,m), 7.09-7.37(4H,m).
E-93	0.94(3H,t), 1.64-1.82(2H,m), 2.04-2.47(12H,m), 3.91-3.98(2H,m), 4.68(1H,m), 5.96-6.39(2H,m), 7.24-7.54(4H,m).
E-95	1.60-1.82(4H,m), 2.06(3H,s), 2.46(3H,s), 2.49(3H,s), 2.53-2.65(2H,m), 3.21-3.35(2H,m), 3.87(3H,s), 4.13(1H,t), 7.16-7.30(4H,m).
E-96	0.93(3H,t), 1.67-1.89(2H,m), 2.10(3H,s), 2.47(3H,s), 2.48(3H,s), 3.85(3H,s), 3.92-4.40(3H,m), 6.01-6.44(2H,m), 7.76-7.80(3H,m).
E-97	2.10(3H,s), 2.47(3H,s), 2.49(3H,s), 3.38(3H,s), 3.43-3.64(2H,m), 3.84(3H,s), 3.97-4.16(2H,m), 4.58-4.62(1H,m), 6.03-6.44(2H,m), 7.20-7.39(4H,m).
E-98	2.16(s, 3H), 2.48(s, 3H), 2.49(s, 3H), 3.75(s, 3H), 4.13(m, 2H), 5.43(s, 1H), 6.11(dt, 1H), 6.45(d, 1H), 7.24-7.34(m, 9H).
E-99	2.10(3H,s), 2.47(3H,s), 2.49(3H,s), 3.75(3H,s), 4.12-4.14(2H,m), 6.09-6.48(2H,m), 7.15-7.40(9H,m).
E-100	2.05-2.48(12H,m), 4.08-4.12(2H,m), 5.39(1H,s), 6.02-6.42(2H,m), 7.24-7.31(8H,m).

10

20

30

40

【 0 2 3 2 】

表14(続き)

化合物 番号	NMR
E-101	2.10(3H,s), 2.47(3H,s), 2.48(3H,s), 4.11(2H,d), 6.06-6.47(2H,m), 7.19-7.35(8H,m).
E-103	2.05(3H,s), 2.27(3H,s), 2.48(3H,s), 3.82-4.22(6H,m), 5.99-6.46(2H,m), 6.89-7.14(4H,m).
E-104	0.98(3H,t), 1.81-1.99(2H,m), 2.09(3H,s), 2.47(6H,s), 3.86(3H,s), 3.93-4.20(2H,m), 4.94-4.98(1H,m), 6.03-6.43(2H,m), 7.89(1H,s), 8.83(1H,s).
E-105	1.23-1.40(6H,m), 2.04-2.48(12H,m), 3.76(1H,m), 4.25(2H,m), 5.36(1H,m), 5.95-6.40(2H,m), 7.81(1H,s), 8.29(1H,s).
E-106	0.88-1.57(4H,m), 2.08(3H,s), 2.46(3H,s), 2.60(3H,s), 3.46-3.69(2H,m), 3.86(3H,s), 4.66(2H,s), 7.80(3H,m).

10

【 0 2 3 3 】

表14(続き)

化合物 番号	NMR
F-2	1.64-2.66(12H,m), 5.62(1H,m), 6.91-7.93(5H,m).
G-4	2.02(3H,s), 2.50-2.58(12H,m), 4.15-4.41(2H,m), 6.81-7.12(4H,m).
G-6	2.04-2.59(15H,m), 4.27(2H,m), 6.89-7.53(8H,m).
G-13	2.05-2.56(12H,m), 4.89(2H,s), 6.65-7.58(8H,m).
G-14	2.04-2.58(12H,m), 4.92(2H,s), 6.95-7.55(8H,m).
G-15	2.05-2.59(20H,m), 4.95(2H,s), 7.01-7.56(8H,m).
G-16	2.07(3H,s), 2.43(3H,s), 2.49(3H,s), 3.87(3H,s), 4.98(2H,s), 6.61-7.34(6H,m).
G-17	1.69-2.56(24H,m), 3.83(3H,m), 4.95(2H,s), 6.89-7.30(4H,m).
G-20	2.03(3H,s), 2.32(3H,s), 2.48(3H,s), 2.56(3H,s), 2.98(2H,m), 4.01(2H,t), 6.82-7.12(4H,m).
G-21	2.03(3H,s), 2.35(3H,s), 2.48(3H,s), 2.57(3H,s), 3.00(2H,m), 4.03(2H,t), 6.86-7.53(8H,m).
G-22	2.08(3H,s), 2.16(3H,s), 2.48(3H,s), 2.59(3H,s), 3.04(2H,t), 3.92(3H,s), 4.05(2H,t), 6.86-7.53(8H,m).
G-23	1.91-2.71(16H,m), 3.93(2H,t), 6.84-7.14(4H,m).
G-24	1.05(3H,t), 1.43-2.76(15H,m), 3.85-4.03(7H,m), 6.86-7.16(3H,m).
G-25	1.97-2.05(5H,m), 2.46(3H,s), 2.51(3H,s), 2.71-2.75(2H,m), 3.85(3H,s), 4.01-4.03(2H,m), 7.27(2H,s), 7.43(1H,s).
H-6	1.92-1.98(m, 3H), 2.11(m, 3H), 2.50(m, 3H), 2.63(m, 3H), 3.85(s, 3H), 4.99-5.03(m, 2H), 6.98-7.39(m, 4H).
H-7	1.73(s, 3H), 2.10(s, 3H), 2.50(s, 3H), 2.65(s, 3H), 3.09(s, 3H), 3.89(s, 3H), 4.99(s, 2H), 7.00-7.03(m, 2H), 7.13(d, 2H).
H-8	1.80-1.89(m, 3H), 2.03-2.10(m, 3H), 2.44-2.52(m, 3H), 3.10(m, 3H), 3.83(m, 3H), 4.92(m, 2H), 6.75(d, 2H), 7.01(d, 2H).

20

30

【 0 2 3 4 】

表14(続き)

化合物 番号	NMR
I-3	1.25-2.50(20H,m), 2.86(2H,q), 3.33(1H,m), 4.47(2H,s), 7.10-7.20(4H,m).
I-4	1.21-2.59(20H,m), 2.79(2H,q), 3.33(1H,m), 4.45(2H,s), 7.10-7.20(4H,m).
I-7	1.25-2.49(22H,m), 3.35(1H,m), 3.91(3H,s), 4.54(2H,s), 7.12-7.19(4H,m).
I-8	1.25-2.56(25H,m), 3.34(1H,m), 4.55(2H,s), 4.61(1H,m), 6.03(1H,d), 7.10-7.20(4H,m).
I-11	2.04-2.57(12H,m), 4.47(2H,s), 4.51(2H,s), 7.33-7.68(8H,m).
I-13	2.03-2.55(12H,m), 4.39(2H,s), 4.44(2H,s), 7.20-7.28(4H,m).
I-14	2.04-2.56(12H,m), 4.43(2H,s), 4.48(2H,s), 7.13-7.56(3H,m).
I-15	2.04-2.57(12H,m), 4.44(2H,s), 7.40-7.64(3H,m).
I-17	2.03-2.54(12H,m), 4.40(2H,s), 4.47(2H,s), 7.18-7.47(4H,m).
I-18	1.39(3H,d), 2.03-2.49(12H,m), 4.18-4.44(3H,m), 7.48-7.59(4H,m).
I-27	1.56(3H,d), 2.04-2.84(16H,m), 4.48(1H,q), 7.21-7.56(4H,m).
J-1	1.94-2.63(18H,m), 5.22(2H,m), 7.42-7.61(4H,m).
K-3	1.01-1.21(6H,m), 2.02-2.56(12H,m), 3.25-4.56(6H,m), 7.14-7.36(4H,m).
K-4	1.76-2.79(18H,m), 3.56-4.33(5H,m), 7.23-7.30(5H,m).
M-4	1.76-1.98(m, 2H), 2.09(s, 3H), 2.49(s, 3H), 2.64(s, 3H), 2.63-2.85(m, 4H), 3.74-3.86(s, 3H), 5.13-5.20(m, 2H), 7.08-7.13(m, 2H), 7.85-8.33(m, 1H).
M-7	1.33-2.48(m, 6H), 2.02(s, 3H), 2.23(s, 3H), 2.48(s, 3H), 2.53(s, 3H), 4.11(q, 1H), 4.98(dd, 2H), 7.42-7.46(m, 3H).
M-9	2.04(s, 3H), 2.35(s, 3H), 2.48(s, 3H), 2.62(s, 3H), 3.53-3.96(dd, 2H), 5.09(s, 2H), 6.93(d, 1H), 7.31-7.45(m, 5H), 7.53(d, 1H), 7.92(s, 1H).
M-11	1.37-2.47(15H,m), 3.74(3H,m), 4.25-4.58(5H,m), 5.62(1H,m), 7.15-8.29(6H,m).
M-12	1.34-2.47(15H,m), 3.80(3H,m), 4.28-4.54(5H,m), 5.61(1H,m), 7.09-8.24(6H,m).
M-13	2.05(3H,s), 2.38(3H,s), 2.47(3H,s), 3.76(3H,s), 4.42(2H,s), 4.66(2H,s), 5.27(2H,s), 7.16-7.68(8H,m).
M-14	2.06(3H,s), 2.36(3H,s), 2.47(3H,s), 3.79(3H,s), 4.29(2H,s), 4.34(2H,s), 5.20(2H,s), 7.20-7.68(8H,m).

10

20

30

40

【0235】

〔生物試験〕

本発明化合物が、殺虫剤または殺ダニ剤の有効成分として有用であることを以下の試験例で示す。

【0236】

（試験例1）ハスモンヨトウに対する効力確認試験

本発明化合物5質量部、ジメチルホルムアミド93.6質量部、およびポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル1.4質量部を混合溶解して、有効成分5%の乳剤を調製した。

該乳剤を水で希釈して化合物濃度125ppmの薬剤を得た。その薬液にキャベツ葉を30秒間浸漬し、次いで風乾した。その後、ろ紙を敷いたシャーレにキャベツ葉を入れ、ハスモンヨトウ2齢幼虫5頭を接種した。ガラス蓋をして、温度25℃、湿度65%の恒温恒湿室内に置き、5日間放置した。その後、ハスモンヨトウの生死を調べ、殺虫率を算出した。試験は2反復で行った。

表15に示す化合物についてハスモンヨトウに対する効力確認試験を行った。いずれの化合物も殺虫率が100%であった。

【0237】

【表 1 5】

表15

化合物番号					
A-6	C-23	E-20	E-46	E-100	L-1
A-25	C-24	E-21	E-47	E-106	M-5
B-13	C-25	E-22	E-50	E-112	M-6
B-14	C-26	E-23	E-52	E-160	
B-31	C-27	E-26	E-59	E-163	
B-32	C-28	E-27	E-61	G-15	
B-33	C-30	E-28	E-62	G-18	
B-39	C-32	E-31	E-63	G-20	
B-46	D-6	E-32	E-67	G-21	
C-5	D-10	E-33	E-69	G-25	
C-9	E-8	E-34	E-71	G-49	
C-11	E-9	E-35	E-72	H-6	
C-13	E-10	E-36	E-78	H-8	
C-14	E-11	E-37	E-82	I-3	
C-15	E-12	E-38	E-84	I-4	
C-16	E-14	E-39	E-85	I-5	
C-17	E-16	E-40	E-88	I-7	
C-18	E-17	E-43	E-91	I-8	
C-21	E-18	E-44	E-92	I-36	
C-22	E-19	E-45	E-96	I-38	

10

20

【0 2 3 8】

(試験例 2) ワタアブラムシに対する効力確認試験

試験例 1 と同じ方法で調製した乳剤を水で希釈して化合物濃度 1 2 5 p p m の薬液を得た。3 寸鉢にキュウリを播種した。発芽から 1 0 日間経過したキュウリの第一本葉上に、ワタアブラムシ雌成虫を接種した。接種から 1 日間経過した日に雌成虫を除去し、産下された若虫が寄生するキュウリに、前記薬液を散布した。温度 2 5 ℃、湿度 6 5 % の恒温恒湿室内に 5 日間置いた。その後、ワタアブラムシの生死を調べ、殺虫率を算出した。試験は 2 反復で行った。

30

表 1 6 に示す化合物についてワタアブラムシに対する効力確認試験を行った。いずれの化合物も殺虫率が 1 0 0 % であった。

【0 2 3 9】

【表 16】

表16

化合物番号					
A-1	B-22	D-9	E-15	E-63	H-3
A-2	B-31	D-10	E-17	E-64	H-4
A-3	B-32	D-11	E-18	E-67	H-6
A-6	B-33	D-12	E-20	E-69	H-7
A-8	B-39	D-13	E-21	E-71	H-8
A-9	C-2	D-16	E-22	E-72	H-13
A-11	C-4	D-17	E-28	E-75	I-2
A-12	C-5	D-19	E-29	E-78	I-3
A-14	C-9	D-20	E-31	E-82	I-4
A-15	C-11	D-21	E-32	E-84	I-5
A-19	C-13	D-23	E-35	E-85	I-7
A-20	C-14	D-24	E-37	E-88	I-8
A-23	C-15	D-25	E-38	E-91	J-6
A-25	C-16	D-26	E-39	E-92	J-7
A-26	C-17	D-27	E-40	E-93	K-3
A-27	C-18	D-28	E-43	E-96	M-1
A-28	C-19	D-29	E-44	E-106	M-2
A-30	C-21	D-30	E-45	G-4	M-3
A-31	C-22	D-31	E-46	G-12	M-4
A-32	C-23	D-34	E-47	G-14	M-5
B-1	C-24	D-39	E-50	G-15	M-6
B-2	C-25	E-5	E-51	G-18	M-7
B-3	C-26	E-6	E-52	G-20	M-8
B-6	C-28	E-7	E-53	G-21	M-9
B-8	C-31	E-8	E-54	G-22	M-12
B-11	C-32	E-9	E-55	G-23	M-13
B-13	C-53	E-10	E-57	G-24	M-14
B-14	D-3	E-11	E-58	G-25	
B-20	D-6	E-12	E-59	G-41	
B-21	D-8	E-14	E-62	H-1	

【0240】

(試験例3) ナミハダニに対する効力確認試験

試験例1と同じ方法で調製した乳剤を水で希釈して化合物濃度125ppmの薬液を得た。3寸鉢にインゲンを播種した。発芽から10日間が経過したインゲンの第一本葉上に、ナミハダニ雌成虫10頭接種した。接種から1日間経過した日に前記薬液を散布した。温度25℃、湿度65%の恒温恒湿室内に置き、散布から3日間経過した日にナミハダニの生死を調べ、殺虫率を算出した。試験は2反復で行った。

表17に示す化合物についてナミハダニに対する効力確認試験を行った。いずれの化合物も殺虫率が100%であった。

【0241】

【表 17】

表17

化合物番号						
A-3	C-14	D-25	E-18	E-50	E-88	I-4
A-8	C-15	D-26	E-20	E-51	E-92	I-5
A-19	C-17	D-27	E-21	E-52	E-93	I-7
A-20	C-18	D-28	E-22	E-53	E-96	I-8
A-28	C-19	D-29	E-23	E-54	E-106	J-6
A-30	C-22	D-30	E-24	E-55	E-159	K-3
B-8	C-23	D-31	E-26	E-58	E-160	M-5
B-11	C-25	D-34	E-28	E-59	G-20	M-6
B-14	D-3	E-5	E-29	E-61	G-21	M-7
B-15	D-6	E-6	E-30	E-62	G-22	M-8
B-20	D-7	E-7	E-31	E-63	G-23	M-13
B-22	D-9	E-8	E-34	E-64	G-24	M-14
B-31	D-10	E-9	E-35	E-67	G-25	
B-32	D-13	E-10	E-37	E-69	H-3	
B-33	D-16	E-11	E-38	E-71	H-4	
C-4	D-19	E-12	E-39	E-72	H-6	
C-5	D-20	E-14	E-43	E-75	H-7	
C-9	D-21	E-15	E-44	E-78	H-8	
C-10	D-22	E-16	E-46	E-84	H-13	
C-11	D-23	E-17	E-47	E-85	I-3	

10

20

【0242】

本発明化合物が、農園芸用殺菌剤の有効成分として有用であることを以下の試験例で示す。

30

【0243】

(試験例4) コムギうどんこ病防除試験

ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート1.5%を含有するジメチルホルムアミド溶液95質量部に本発明化合物5質量部を溶解させて有効成分5%の乳剤を調製した。

前記の乳剤をポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート0.02%を含有する水溶液で希釈して、化合物濃度100ppmの薬液を得た。続いて、該薬液を、素焼きポットで栽培したコムギ幼苗(品種「チホク」、1.0~1.2葉期)に散布した。葉を風乾させた。その後、コムギうどんこ病菌(*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*)の分生胞子を振り払い接種し、22~25℃の温室で7日間保持した。葉上の病斑出現状態を調査した。無処理区との比較で防除価を算出した。

40

表18に示す化合物についてコムギうどんこ病防除試験を行った。いずれの化合物も防除価が75%以上であった。

【0244】

【表 18】

表18

化合物番号						
A-2	B-16	D-6	E-12	E-83	E-182	I-8
A-6	B-17	D-7	E-21	E-84	E-184	I-11
A-7	B-20	D-8	E-22	E-85	F-1	I-14
A-9	B-22	D-9	E-28	E-86	F-2	I-15
A-10	B-23	D-10	E-29	E-88	F-3	I-16
A-11	B-24	D-11	E-33	E-90	G-4	I-17
A-12	B-25	D-12	E-34	E-91	G-12	I-18
A-15	B-28	D-13	E-37	E-95	G-13	I-19
A-19	B-30	D-14	E-50	E-96	G-14	I-20
A-23	B-31	D-15	E-51	E-97	G-15	I-21
A-25	B-32	D-20	E-52	E-98	G-18	I-34
A-26	B-33	D-21	E-53	E-99	G-20	I-36
A-29	B-46	D-22	E-58	E-100	G-22	I-37
A-30	B-49	D-23	E-64	E-101	G-23	I-50
A-31	B-52	D-28	E-65	E-102	G-25	I-51
A-32	B-53	D-29	E-68	E-103	G-38	J-1
A-33	B-54	D-30	E-69	E-105	G-43	J-6
A-35	B-56	D-34	E-70	E-106	G-54	L-8
A-47	B-59	D-39	E-71	E-132	G-56	L-9
A-48	B-63	D-41	E-72	E-157	G-60	M-7
A-51	C-2	D-44	E-73	E-160	G-63	M-8
A-52	C-4	E-1	E-74	E-168	H-3	M-9
A-53	C-5	E-2	E-75	E-169	H-4	M-24
A-54	C-8	E-5	E-76	E-170	H-7	M-25
B-6	C-13	E-6	E-77	E-171	H-12	M-26
B-7	C-15	E-7	E-78	E-172	H-13	M-28
B-8	C-18	E-8	E-79	E-173	I-1	
B-9	C-69	E-9	E-80	E-176	I-3	
B-10	D-2	E-10	E-81	E-177	I-5	
B-12	D-3	E-11	E-82	E-179	I-7	

【0245】

(試験例5) コムギ赤さび病防除試験

試験例4と同じ方法で乳剤を調製した。該乳剤をポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート0.02%を含有する水溶液で希釈して、化合物濃度100ppmの薬液を得た。該薬液を、素焼きポットで栽培したコムギ幼苗(品種「農林61号」、1.0~1.2葉期)に散布した。葉を風乾させた。その後、コムギ赤さび病菌(*Puccinia recondita*)の夏胞子を振り払い接種し、22~25℃の温室で10日間保持した。葉上の病斑出現状態を調査した。無処理区との比較から防除価を算出した。

表19に示す化合物についてコムギ赤さび病防除試験を行った、いずれの化合物も防除価が75%以上であった。

【0246】

10

20

30

40

【表 19】

表19

化合物番号						
A-1	B-4	B-46	D-35	E-77	E-100	G-25
A-7	B-7	B-47	D-38	E-78	E-101	G-43
A-8	B-8	B-50	E-1	E-79	E-103	H-4
A-10	B-9	B-58	E-3	E-80	E-104	H-7
A-12	B-10	B-59	E-6	E-81	E-105	H-8
A-13	B-12	C-1	E-7	E-82	E-106	H-18
A-17	B-15	C-5	E-8	E-83	E-128	I-1
A-18	B-16	C-8	E-9	E-84	E-133	I-3
A-19	B-17	C-9	E-11	E-85	E-141	I-8
A-20	B-18	C-33	E-21	E-86	E-142	I-20
A-21	B-22	C-83	E-22	E-88	E-143	I-34
A-22	B-23	D-2	E-37	E-90	E-145	I-54
A-23	B-24	D-8	E-47	E-91	E-183	J-1
A-24	B-25	D-9	E-69	E-92	F-1	K-3
A-32	B-26	D-13	E-70	E-93	F-2	L-11
A-33	B-28	D-14	E-71	E-95	G-13	M-6
A-38	B-31	D-15	E-72	E-96	G-14	M-7
A-40	B-32	D-20	E-73	E-97	G-17	M-8
A-47	B-42	D-22	E-74	E-98	G-21	M-9
A-48	B-45	D-24	E-76	E-99	G-22	M-27

10

20

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード (参考)
C O 7 D	453/00	(2006.01)	C O 7 D	453/00
A O 1 N	43/40	(2006.01)	A O 1 N	43/40 1 O 1 E
A O 1 P	3/00	(2006.01)	A O 1 P	3/00
A O 1 P	7/04	(2006.01)	A O 1 P	7/04
A O 1 P	7/02	(2006.01)	A O 1 P	7/02
A O 1 N	43/90	(2006.01)	A O 1 N	43/40 1 O 2
A O 1 N	43/50	(2006.01)	A O 1 N	43/90 1 O 2
A O 1 N	43/54	(2006.01)	A O 1 N	43/50 H
A O 1 N	43/80	(2006.01)	A O 1 N	43/54 F
			A O 1 N	43/80 1 O 1

- (72)発明者 宗井 陽平
神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内
- (72)発明者 小林 朝巳
神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内
- (72)発明者 藤井 聡
神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内
- (72)発明者 佐藤 元亮
神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内
- (72)発明者 深川 尊子
神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内
- (72)発明者 井上 博生
神奈川県小田原市高田 3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所内

F ターム (参考) 4C055 AA01 BA03 BA06 BB02 CA03 CA16 CA25 CB07 CB08 DA42
DA43 DB02 DB04 DB11 EA01
4C063 AA01 BB08 CC12 CC25 CC28 CC51 CC76 CC81 DD03 DD12
EE03
4C064 AA01 AA06 CC01 DD10 EE01 FF06 GG12
4H011 AA01 AC01 AC04 BA01 BB09 BC01 BC03 BC07 BC18 BC20
DA02 DA15 DA16 DC03 DC04 DC05 DC06 DC08 DD03