

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2025年4月3日(03.04.2025)



(10) 国際公開番号

WO 2025/069918 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 401/14 (2006.01) A01P 5/00 (2006.01)
A01N 43/58 (2006.01) A01P 7/02 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)
A01N 47/02 (2006.01) C07D 401/04 (2006.01)
A01N 47/06 (2006.01) C07D 403/04 (2006.01)
A01N 47/24 (2006.01) C07D 405/14 (2006.01)
A01N 53/04 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2024/031121

(22) 国際出願日: 2024年8月30日(30.08.2024)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2023-166313 2023年9月27日(27.09.2023) JP

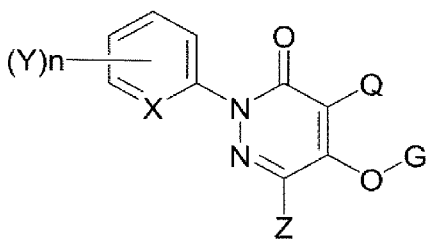
(71) 出願人: 石原産業株式会社(ISHIHARA SANGYO
KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒5500002 大阪府大阪
市西区江戸堀一丁目3番15号 (JP).

(72) 発明者: 桐山 和久 (KIRIYAMA Kazuhisa);
〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番
15号 石原産業株式会社内 (JP). 重黒木 達

也(JUKUROGI Tatsuya); 〒5500002 大阪府大阪
市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業
株式会社内 (JP). 田澤 優太(TAZAWA Yuta);
〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3
番15号 石原産業株式会社内 (JP). 可児 達
也(KANI Tatsuya); 〒5500002 大阪府大阪市西
区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会
社内 (JP). 吉村 忠浩(YOSHIMURA Tadahiro);
〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番
15号 石原産業株式会社内 (JP). 川上 翔大
(KAWAKAMI Shota); 〒5500002 大阪府大阪市
西区江戸堀一丁目3番15号 石原産業株式会
社内 (JP). 鳥居 綾香(TORII Ayaka); 〒5500002
大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石
原産業株式会社内 (JP). 石原 勝也(ISHIHARA
Katsuya); 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀
一丁目3番15号 石原産業株式会社内 (JP).
勘坂 悠太(KANZAKA Yuta); 〒5500002 大阪府
大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 石原産
業株式会社内 (JP). 土井 龍輔(DOI Ryusuke);
〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3
番15号 石原産業株式会社内 (JP).

(54) Title: PYRIDAZINONE COMPOUND OR SALT THEREOF, AND PEST CONTROL AGENT CONTAINING SAME

(54) 発明の名称: ピリダジノン系化合物又はその塩及びそれらを含む有害生物防除剤



(57) Abstract: A number of pest control agents have been used over the years, but a considerable number of such pest control agents have various problems such as insufficient efficacy and limitation on the use thereof due to pests, etc., gaining resistance thereto. Therefore, there is a demand for development of a new pest control agent with few of such shortcomings. The present invention pertains to: a pyridazinone compound represented by formula (I) [in the formula, each symbol is as described in the description] or a salt thereof; a pest control agent containing the compound; and a method for controlling pests by applying the compound.

(57) 要約: 長年にわたり、多数の有害生物防除剤が使用されているが、効力が不十分である、害虫等が抵抗性を獲得しその使用が制限されるなど、種々の課題を有するものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない新規な有害生物防除剤の開発が望まれている。〔式中、各記号は明細書に記載の通りである〕で表されるピリダジノン系化合物又はその塩、該化合物を含む有害生物防除剤、該化合物を施用して有害生物を防除する方法。

(74) 代理人: 弁理士法人 T. S. パートナーズ (T.S. PARTNERS); 〒1010047 東京都千代田区内神田一丁目 1 8 番 1 3 号 内神田中央ビル 7 階 (JP).

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

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第21条(3))

明 細 書

発明の名称：

ピリダジノン系化合物又はその塩及びそれらを含む有害生物防除剤

技術分野

[0001] 本発明は、新規なピリダジノン系化合物又はその塩及びそれらを有効成分として含む有害生物防除剤に関する。

背景技術

[0002] 特許文献1には、4-（ヘテロシクリル）ピリダジノン系化合物が記載されている。当該化合物は、ピリダジノン環の2位にアルキル、シクロアルキル等を有するものであり、後記式（1）で表される化合物のように同位置に芳香族環を含むものではなく、両化合物は化学構造が異なる。

特許文献2及び3には、ピリダジノン系化合物が記載されている。当該化合物は、ピリダジノン環の2位にアルキル、シクロアルキル、テトラヒドロピラニル等を有するものであり、後記式（1）で表される化合物のように同位置に芳香族環を含むものではなく、両化合物は化学構造が異なる。

特許文献4には、ピリダジノン系化合物が記載されている。当該化合物は、ピリダジノン環の4位に $A-R^3$ （Aは NR^4 を含み、 R^4 は $C_1\sim C_6$ のアルキルを示すか、または R^3 と一緒になって5員環あるいは6員環を形成してもよい）を有するものであり、後記式（1）で表される化合物のように同位置にピラゾール又はトリアゾールを含むものではなく、両化合物は化学構造が異なる。

[0003] 特許文献5にはピリダジノン系化合物を含む抗菌性組成物が記載されている。特許文献6には4位置換ピリダジノン系化合物及びc-Met阻害薬が記載されている。特許文献7にはピリダジノン系化合物及び増殖性疾患の治療薬が記載されている。特許文献8にはピリダジノン系化合物及びP2X7受容体阻害剤が記載されている。

しかしながら、特許文献5～8には、後記式（1）で表される化合物のよ

うに、ピリダジノン環の2位が芳香族環であると同時に、ピリダジノン環の4位がピラゾール又はトリアゾールである化合物について具体的に開示はなく、加えて、農園芸用の有害生物や、動物寄生性の生物の防除について開示はない。

[0004] 本願の優先日後に公開された特許文献9にはピリダジノン系化合物が記載されている。当該化合物はピリダジノン環の5位がOH基であって、後記式(1)で表される化合物のようにOH基が修飾された化合物については開示がない。

先行技術文献

特許文献

[0005] 特許文献1：国際公開第2011/045271号
特許文献2：国際公開第2009/086041号
特許文献3：特開2012-56903号公報
特許文献4：特開昭63-185966号公報
特許文献5：国際公開第2015/143164号
特許文献6：国際公開第2008/103277号
特許文献7：国際公開第2008/080056号
特許文献8：国際公開第2010/126104号
特許文献9：国際公開第2023/189602号

発明の概要

発明が解決しようとする課題

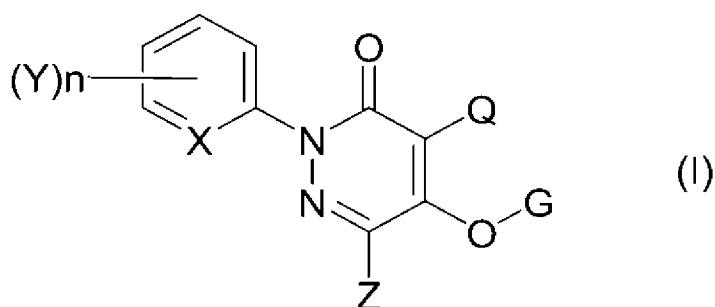
[0006] 長年にわたり、多数の有害生物防除剤が使用されているが、効力が不十分である、害虫等が抵抗性を獲得しその使用が制限されるなど、種々の課題を有するものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない新規な有害生物防除剤の開発が望まれている。本発明の目的は、有害生物に対して高活性な化合物を提供すること、該化合物を含有する有害生物防除剤を提供すること、該化合物を施用して有害生物を防除する方法を提供することである。

課題を解決するための手段

[0007] 本発明者らは、より優れた有害生物防除剤を見出すべく、ピリダジノン系化合物につき種々検討した。その結果、ピリダジノン環の2位に芳香族環を有すると同時に、ピリダジノン環の4位にピラゾール又はトリアゾールがその窒素原子を介して結合した新規なジアリールピリダジノン系化合物である、後記式(1)で表されるピリダジノン系化合物又はその塩が、有害生物に対し防除効果を有することを見出し、本発明を完成した。

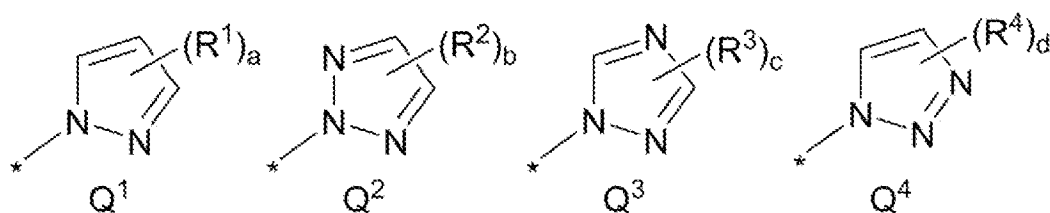
即ち本発明は、式(1)：

[0008] [化1]



(式中、QはQ¹、Q²、Q³又はQ⁴：

[0009] [化2]



(各式中、*は結合位置を示す)であり；

XはCH、C(R^A)又はNであり；

Y及びR^Aは各々ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、シアノ又は-C(=O)R^Bであり；
Zはアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、シクロアルキルアルキル又はハロアルキルであり；

R¹、R²、R³及びR⁴は各々ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ハロア

ルキル、アルコキシ、シクロアルキルオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、シアノ、ニトロ、アルデヒド、 $-CH(=NOR^C)$ 、1, 3-ジオキサソラン-2-イル又は1, 3-ジオキサソラン-2-イルであり；

R^B は水素原子又はアルキルであり；

R^C はアルキルであり；

n は0～4の整数であり；

a は0～3の整数であり；

b 、 c 及び d は各々0、1又は2であり；

G は R^D で置換されてもよいアルキル、 $-C(=O)E$ 又はアルキルスルホニルであり；

R^D はアルコキシ、シアノ、アルコキシカルボニル又はアルコキシカルボニルオキシであり；

E はアルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ジアルキルアミノ、 N -アルコキシ- N -アルキルアミノ、 V^A で置換されてもよいフェニル、 V^A で置換されてもよいピリジル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルアルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシアルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルアルケニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ、 V^A で置換されてもよいナフチルオキシ、シクロアルキルアルコキシ、ヘテロシクロアルキルアルコキシ、 V^B で置換されてもよいフェニルアルコキシ、アルキルチオ又は2-イミダゾリジノンであり；

V^A はハロゲンであり；

V^B はハロゲン又はアルキルである)で表されるピリダジノン系化合物又はそ

の塩に関する。

- [0010] また本発明は、前記式（１）で表されるピリダジノン系化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤に関し、当該化合物又はその塩の有害生物防除有効量を、望ましくない生物又はそれが生育する場所に施用し、望ましくない生物を防除する方法に関する。

発明の効果

- [0011] 前記式（１）で表されるピリダジノン系化合物又はその塩は、有害生物に対する防除効果を奏する。

発明を実施するための形態

- [0012] 前記式（１）中のハロゲン原子又は置換基としてのハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲン原子の数は１又は２以上であってよく、２以上の場合、各ハロゲン原子は同一でも相異なってもよい。また、ハロゲン原子の置換位置は何れの位置でもよい。
- [0013] 前記式（１）中のアルキル又はアルキル部分としては、例えば、メチル、エチル、ノルマルプロピル、イソプロピル、ノルマルブチル、イソブチル、セカンダリーブチル、ターシャリーブチル、２，２－ジメチルブチル、２，３－ジメチルブチル、２，２，３－トリメチルブチル、ノルマルペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、２－メチルペンチル、３－メチルペンチル、２，２－ジメチルペンチル、２，３－ジメチルペンチル、２，４－ジメチルペンチル、３，３－ジメチルペンチル、３－エチルペンチル、ノルマルヘキシル、２－メチルヘキシル、３－メチルヘキシル、ノルマルヘプチル又はノルマルオクチルのような直鎖又は分岐鎖状の炭素数１から８（ C_1-C_8 ）の基が挙げられる。
- [0014] 前記式（１）中のアルコキシ又はアルコキシ部分としては、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ノルマルブトキシ、イソブトキシ、セカンダリーブトキシ、ターシャリーブトキシ、２，２－ジメチルブトキシ、２，３－ジメチルブトキシ、ノルマルペンチルオキシ、イソペン

チルオキシ、ネオペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、ノルマルヘキシルオキシ又はノルマルヘプチルオキシのような直鎖又は分岐鎖状の炭素数1から7 (C_1-C_7) の基が挙げられる。

[0015] 前記式(1)中のアルケニル又はアルケニル部分としては、例えば、ビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、イソプロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-ヘキセニル、2, 3-ジメチル-2-ブテニル、1-ヘプテニル又は1-オクテニルのような、任意の位置に少なくとも1つの二重結合を有する、直鎖又は分岐鎖状の炭素数2から8 (C_2-C_8) の基が挙げられる。

[0016] 前記式(1)中のアルキニル又はアルキニル部分としては、例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-3-ブチニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル又は1-ヘプチニルのような、任意の位置に少なくとも1つの三重結合を有する、直鎖又は分岐鎖状の炭素数2から7 (C_2-C_7) の基が挙げられる。

[0017] 前記式(1)中のシクロアルキル又はシクロアルキル部分としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルのような、炭素原子数3から6 (C_3-C_6) の基が挙げられる。シクロアルキル又はシクロアルキル部分における環は、環上の任意の位置においてアルキル基により置換されていてもよく、そのようなシクロアルキル又はシクロアルキル部分としては、例えば、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロプロピル、1, 2-ジメチルシクロプロピル、2, 2-ジメチルシクロプロピル、1-メチルシクロブチル、1-メチルシクロペンチルのような、炭素原子数3から6 (C_3-C_6) の基(この場合の炭素原子数は、置換による

アルキル基の炭素原子数を含む)が挙げられる。

[0018] 前記式(1)中のヘテロシクロアルキル又はヘテロシクロアルキル部分としては、例えば、オキシラニル、チイラニル、アジリジニル、オキセタニル、チエタニル、アゼチジニル、ジヒドロフリル、テトラヒドロフリル、ジヒドロチオフェニル、テトラヒドロチオフェニル、ピロリニル、ピロリジニル、ジオキソリル、ジオキソラニル、ジチオラニル、オキサチオラニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、オキサゾリニル、オキサゾリジニル、イソオキサゾリニル、イソキサゾリジニル、チアゾリニル、チアゾリジニル、イソチアゾリニル、イソチアゾリジニル、テトラヒドロピラニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ジヒドロチオピラニル、ジオキサニル、ピペリジニル、ピペラジニル、テトラヒドロピラジニル、テトラヒドロピリダジニル又はモルホリニルのような、炭素原子以外に酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1種以上の原子を1つ以上含む3員～6員の基が挙げられる。

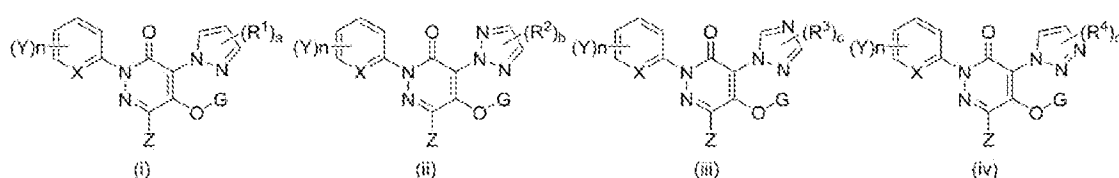
[0019] 前記式(1)中のピリジルとしては、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジルのいずれでもよく、窒素原子の位置は特に限定されない。

[0020] 前記式(1)において、「置換されてもよい」とあるのは、置換又は無置換であることを意味する。

[0021] 前記式(1)中、 n が2以上の整数の場合、各置換基 Y は同一でも相異なってもよい。同様に、 a が2以上の整数の場合、各置換基 R^1 は同一でも相異なってもよい。同様に、 b 、 c 又は d が2である場合、 R^2 、 R^3 及び R^4 の各置換基は、各々同一でも相異なってもよい。

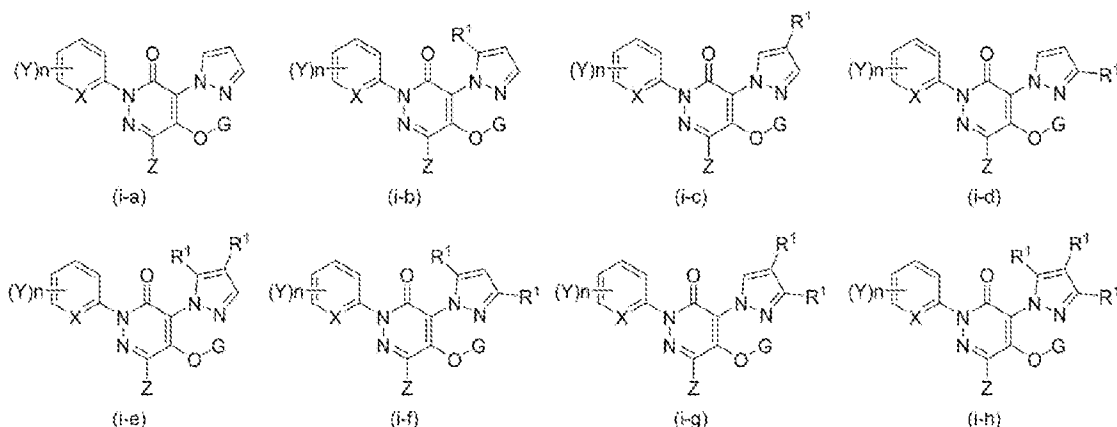
[0022] 前記式(1)中、 Q は $Q^1 \sim Q^4$ で表されることから、式(1)の化合物は、具体的には、下記式(i)～式(iv)で表される。

[0023] [化3]



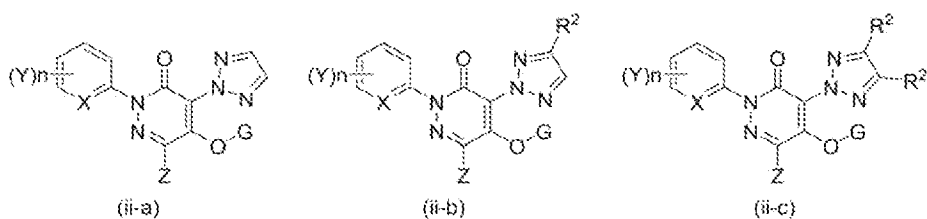
[0024] 前記式 (i) の化合物は、 Q^1 における置換基の数及び位置に応じて、下記式 (i-a) ~ 式 (i-h) の化合物を包含する。

[0025] [化4]



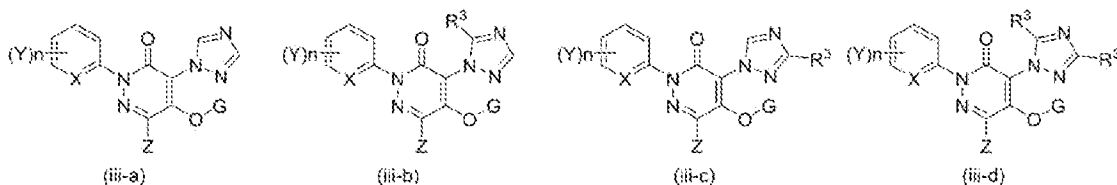
[0026] 同様に、前記式 (ii) の化合物は、 Q^2 における置換基の数及び位置に応じて、下記式 (ii-a) ~ 式 (ii-c) の化合物を包含する。

[0027] [化5]



[0028] 同様に、前記式 (iii) の化合物は、 Q^3 における置換基の数及び位置に応じて、下記式 (iii-a) ~ 式 (iii-d) の化合物を包含する。

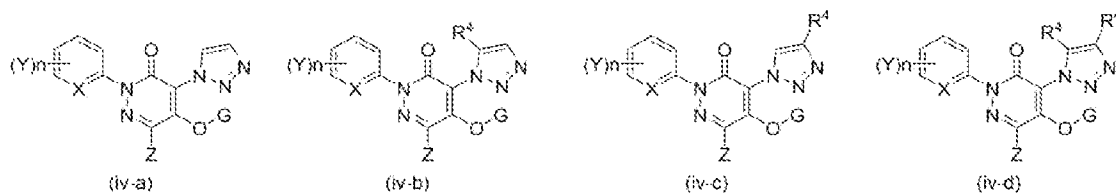
[0029] [化6]



[0030] 同様に、前記式 (iv) の化合物は、 Q^4 における置換基の数及び位置に応じて、下記式 (iv-a) ~ 式 (iv-d) の化合物を包含する。

[0031]

[化7]



[0032] なお、各式 (i) ~ 式 (iv)、式 (i-a) ~ 式 (i-h)、式 (iii-a) ~ 式 (iii-c)、式 (iii-a) ~ 式 (iii-d) 及び式 (iv-a) ~ 式 (iv-d) の各化合物における各記号は、式 (I) 中のそれらと同じ意味を表す。また、本明細書における式 (I) の化合物に関する説明は、式 (I) に包含される前記各式の化合物に関する説明も包含する。

[0033] 式 (I) 中、Q としては Q¹ 又は Q³ が好ましく、すなわち、前記の式 (i) 又は式 (iii) で表される化合物が好ましい。また、式 (i) 又は式 (iii) で表される化合物としては、式 (i-c)、式 (i-d)、式 (i-g) 又は式 (iii-c) で表される化合物が好ましい。

[0034] 前記式 (I) の化合物の塩としては、当該技術分野で許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば、塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。

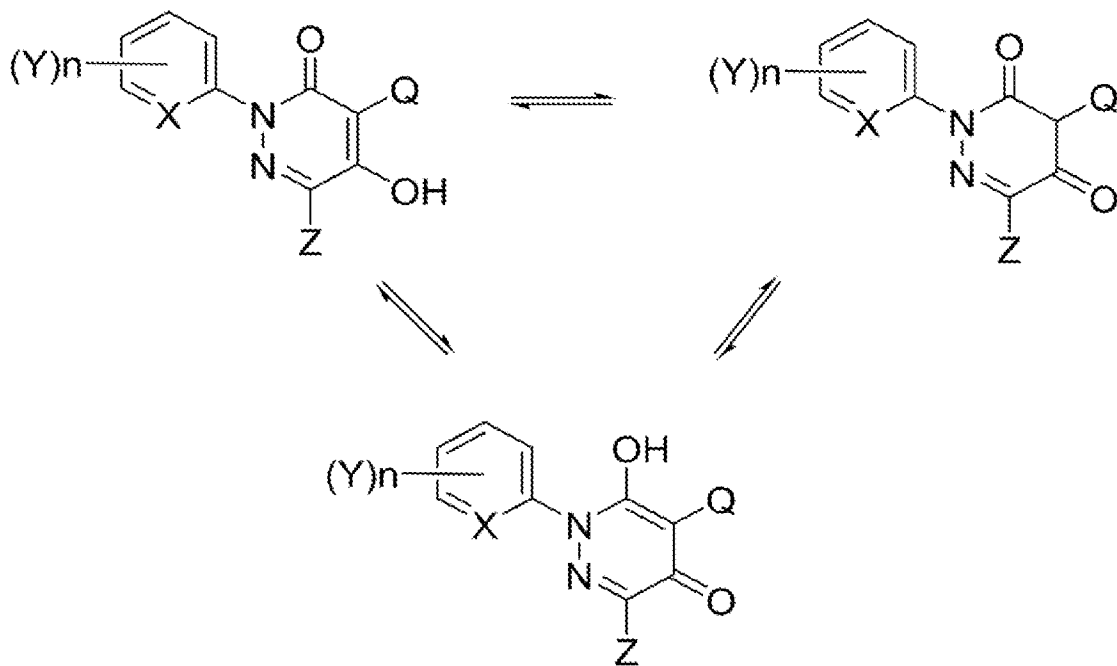
[0035] 前記式 (I) の化合物又はその塩には、ジアステレオ異性体や光学異性体のような異性体が存在する場合があるが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。本明細書においては、特に言及しない限り、異性体は混合物として記載する。尚、本発明には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記異性体以外の各種異性体も含まれる。また、異性体の種類によっては、前記一般式 (I) とは異なる化学構造となる場合があるが、当業者であればそれら化学構造が一般式 (I) と異性体の関係にあることが十分認識できるため、本発明の範囲内であることは明らかである。

[0036] 前記式 (I) の化合物又はその塩（以下、本発明化合物ともいう）は、以下の製造方法、又は通常の塩の製造方法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。例えば、本発明の化合物 (I) は

、ピリダジノン環及びピラゾリル基、トリアゾリル基、フェニル基、ピリジル基上の置換基に、本分野において周知の種々の置換基変換反応（例えば、アルキル化反応、ハロアルキル化反応、鈴木カップリング反応などのクロスカップリング反応、ザンドマイヤー型反応、ハロゲン化反応、酸化反応、還元反応等）を、適用することによって製造することも可能である。また、必要に応じて、出発物質または中間体中の任意の官能基は、本分野で周知の保護基を用いて保護してもよい。これらの保護基は、本分野で周知の方法を使用して、反応順序内の適切な段階で除去することができる。また、反応を実施するにあたり、必要な場合は窒素やアルゴンなどの不活性ガス雰囲気下で実施してもよい。また、以下の製造方法において、ジアステレオ異性体や光学異性体のような異性体が存在する場合もあるが、以下の記載においては、各々の異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物の双方を包含する。例えば、化学構造式中に炭素－窒素二重結合に由来する幾何異性体が存在する場合もあるが、その場合において、化学構造式中、波線は炭素－窒素二重結合に由来する幾何異性体のうちいずれの幾何異性体も包含することを意味する。また、例えば、化合物（I）の前駆体として有用な後記式（II）の化合物又はその塩は、以下のような互変異性体が存在し得るが、後記式（II）の化合物又はその塩は、各々の互変異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物の双方を包含する。

[0037]

[化8]

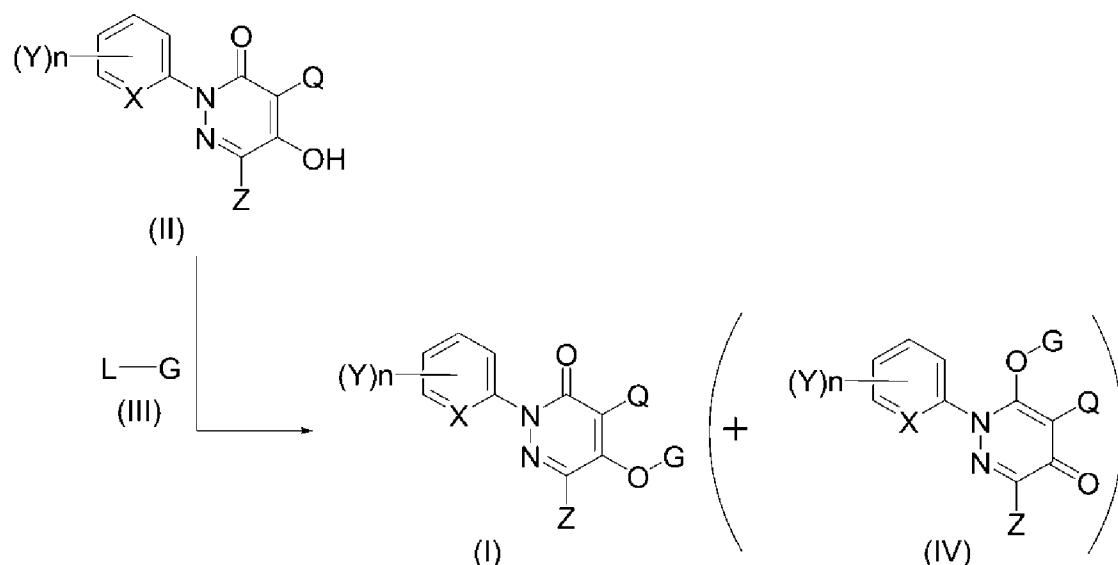


[0038] 製法〔1〕

本発明化合物は、式（ⅠⅠ）の化合物と式（ⅠⅠⅠ）の化合物とを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。式（ⅠⅠⅠ）の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造することができる。本製法において、式（Ⅰ）の化合物の異性体である式（ⅠⅤ）の化合物が生成する可能性もあるが、精製等の通常操作により式（Ⅰ）の化合物を単離することができる。

[0039]

[化9]



[0040] 式中、Lはハロゲン原子であり、その他の記号は前述の通りである。

[0041] 塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウム等のアルカリ土類金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化バリウム等のアルカリ土類金属水酸化物；水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラジド、カリウムヘキサメチルジシラジド等の金属アミド類；ナトリウムメトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類；トリエチルアミン、4-メチルモルホリン、ジイソプロピルエチルアミンなどの第三級アミン類；1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、2, 6-ルチジンなどが挙げられる。塩基は、式(II)の化合物1当量に対して0. 5～10当量使用できる。

[0042] 製法〔1〕の反応は、必要に応じて触媒の存在下で行ってもよく、触媒としては、ヨウ化ナトリウム、ヨウ化カリウムなどが挙げられる。触媒は、式(II)の化合物1当量に対して0. 005～0. 8当量使用できる。

[0043] 製法〔1〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶

媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

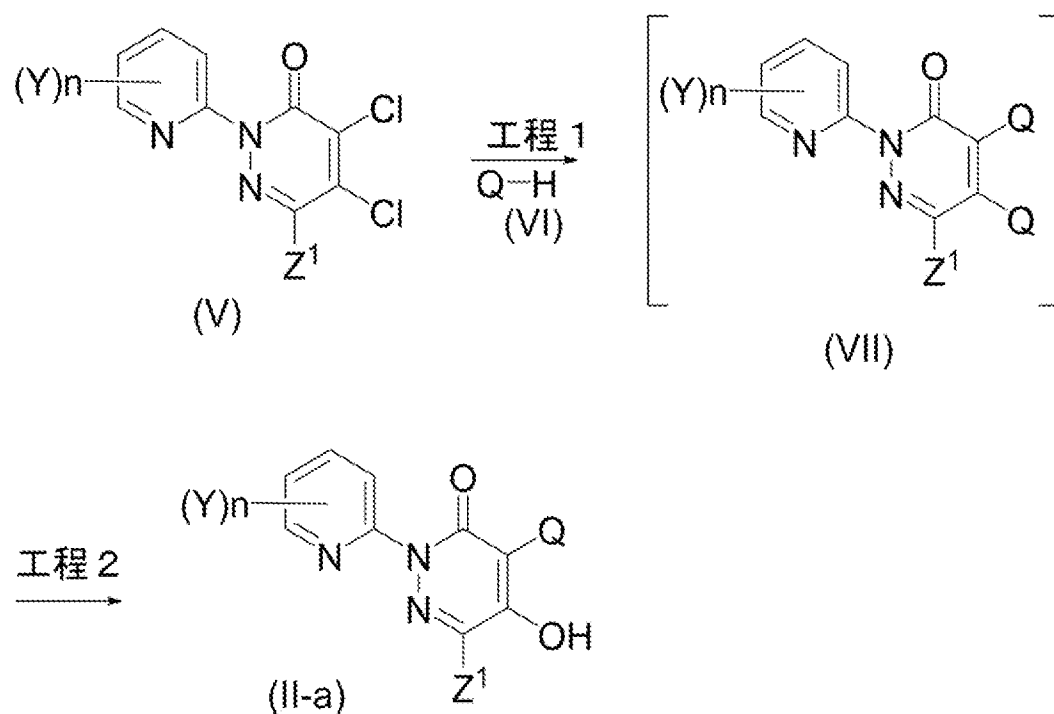
[0044] 製法〔1〕の反応温度は、 -20°C ～ 150°C 程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0045] 中間体製法〔1〕

前記式(ⅠⅠ)の化合物中、XがNである式(ⅠⅠ-a)の化合物は、式(V)の化合物と式(VⅠ)の化合物とを反応させて式(VⅠⅠ)の化合物を得る工程1と、式(VⅠⅠ)の化合物を塩基の存在下で反応させる工程2を、連続的に行うことにより製造することができる。

[0046]

[化10]



[0047] 式中、Z¹はアルキルであり、その他の記号は前述の通りである。

[0048] 中間体製法〔1〕の工程1では、式(V)の化合物と式(VI)の化合物とを塩基の存在下で反応させ、式(VII)の化合物を製造している。式(VI)の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造できる。

[0049] 塩基としては、例えば水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物などが挙げられる。塩基は、式(V)の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

[0050] 中間体製法〔1〕における工程1の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、前記製法〔1〕と同様のものなどから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0051] 中間体製法〔1〕における工程1の反応温度は、−20℃～150℃程度

である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0052] 中間体製法〔1〕の工程2では、工程1で得られた式(VIII)の化合物と塩基を反応させることにより、式(IX-a)の化合物を製造している。

[0053] 塩基としては、前記工程1と同様のものなどが挙げられる。

[0054] 中間体製法〔1〕における工程2の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；水；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

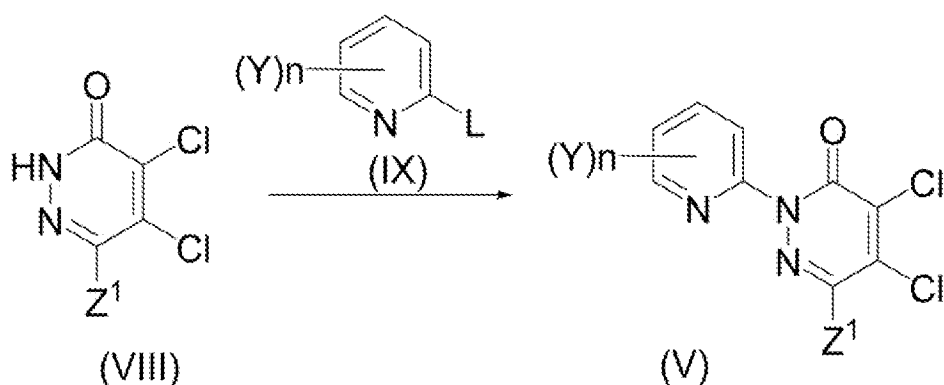
[0055] 中間体製法〔1〕における工程2の反応温度は、-20℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0056] 中間体製法〔1-1〕

前記式(V)の化合物は、式(VIII)の化合物と式(IX)の化合物とを、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。式(IX)の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造することができる。

[0057]

[化11]



[0058] 式中の記号は前述の通りである。

[0059] 塩基としては、例えば水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；トリエチルアミン、4-メチルモルホリン、ジイソプロピルエチルアミンなどの第三級アミン類；などが挙げられる。塩基は、式（V I I I）の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

[0060] 中間体製法〔1-1〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、前記製法〔1〕と同様のものなどから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

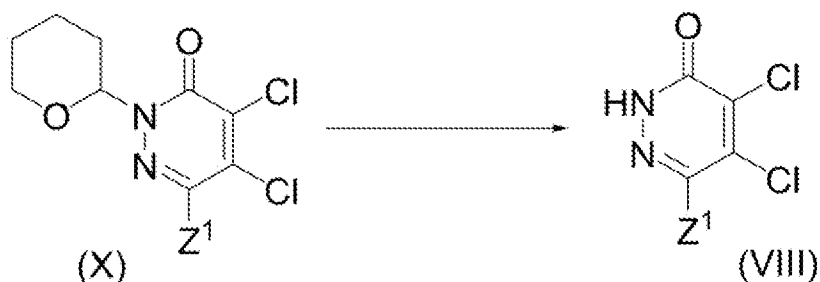
[0061] 中間体製法〔1-1〕の反応温度は、0℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0062] 中間体製法〔1-2〕

前記式（V I I I）の化合物は、公知の文献（例えば、Protective Groups in Organic Synthesis Fourth Edition, John Wiley & Sons, Inc等）の記載に準じて製造することができる。例えば、式（V I I I）の化合物は、式（X）の化合物を酸の存在下で反応させることにより製造することができる。

[0063]

[化12]



[0064] 式中の記号は前述の通りである。

[0065] 酸としては、例えば塩酸などの無機酸；酢酸、ギ酸、トリフルオロ酢酸などの有機酸；が挙げられる。酸は、式（X）の化合物1当量に対して0.1～10当量使用できる。また、場合により溶媒を兼ねて過剰量使用してもよい。

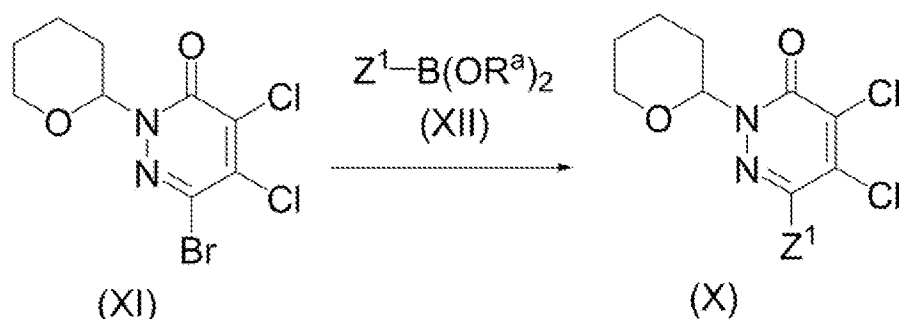
[0066] 中間体製法〔1－2〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1，4－ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；N，N－ジメチルホルムアミド、N，N－ジメチルアセトアミド、N－メチル－2－ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；アセトン、エチルメチルケトンなどのケトン類；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0067] 中間体製法〔1－2〕の反応温度は、0℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0068] 中間体製法〔1－3〕

前記式 (X) の化合物は、式 (X I) の化合物と式 (X I I) の化合物とを、金属触媒及び塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。式 (X I I) の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造することができる。

[0069] [化13]



[0070] 式中、2つの R^a は、それぞれ独立して水素原子又は(C_1-C_6)アルキルであり、2つの R^a が(C_1-C_6)アルキルである場合には、各々同一でも相異なってもよい。2つの R^a が一緒になって $-CH_2CH_2-$ 又は $-C(CH_3)_2C(CH_3)_2-$ を形成してもよく、その他の記号は前述の通りである。

[0071] 金属触媒としては、一般にクロスカップリング反応で使用されるものであればよい。例えば、パラジウム-炭素、塩化パラジウム、酢酸パラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウムジクロリド、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウムジクロリドジクロロメタン付加物等のパラジウム触媒；金属銅、酢酸銅(I)、酢酸銅(II)、酸化銅(I)、酸化銅(II)、ヨウ化銅等の銅触媒；などが挙げられる。金属触媒は、式 (X I) の化合物 1 当量に対して 0.001~0.5 当量使用できる。

[0072] 塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第三級アミン類；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウム等のアルカリ土類金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化バリウム等のアルカリ土類金属水酸化物；リン酸ナトリウム、リン酸カリウム等のアルカリ金属リン酸塩；リン酸

カルシウム等のアルカリ土類金属リン酸塩；などから1種又は2種以上を適宜選択し、混合して使用することができる。塩基は、式(X I)の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

[0073] 中間体製法〔1-3〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；アセトン、エチルメチルケトンなどのケトン類；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類；水；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

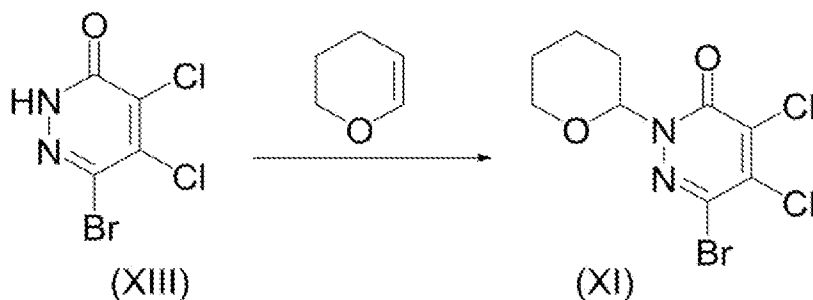
[0074] 中間体製法〔1-3〕の反応温度は、20℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0075] 中間体製法〔1-4〕

前記式(X I)の化合物は、公知の文献（例えば、Protective Groups in Organic Synthesis Fourth Edition, John Wiley & Sons, Inc等）の記載に準じて製造することができる。例えば、式(X I)の化合物は、式(X I I I)の化合物と3,4-ジヒドロ-2H-ピランとを、酸の存在下で反応させることにより製造することができる。式(X I I I)の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造することができる。

[0076]

[化14]



[0077] 酸としては、例えばメタンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸ピリジニウムなどの有機酸が挙げられる。酸は、式(XIII)の化合物1当量に対して0.1～10当量使用できる。

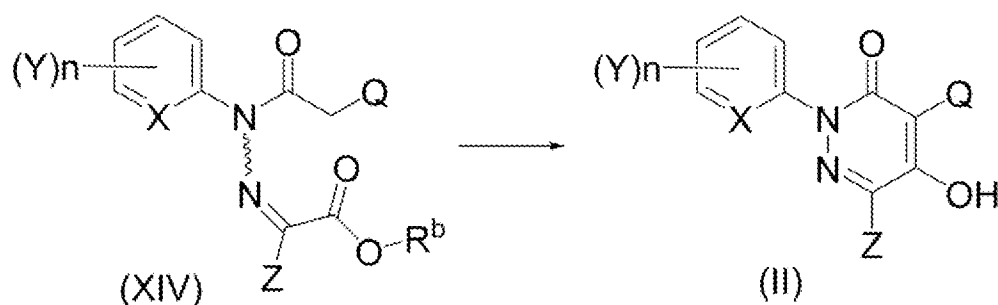
[0078] 中間体製法〔1-4〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0079] 中間体製法〔1-4〕の反応温度は、10℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0080] 中間体製法〔2〕

前記式(II)の化合物は、式(XIV)の化合物を塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

[0081] [化15]



[0082] 式中、 R^b は(C_1-C_6)アルキルであり、その他の記号は前述の通りである。

[0083] 塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウム等のアルカリ土類金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化バリウム等のアルカリ土類金属水酸化物；水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；ノルマルブチルリチウム、ターシャリーブチルリチウム等のアルキルリチウム類；リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラジド、カリウムヘキサメチルジシラジド等の金属アミド類；ナトリウムメトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類；トリエチルアミン、4-メチルモルホリン、ジイソプロピルエチルアミンなどの第三級アミン類；1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、2, 6-ルチジンなどが挙げられる。塩基は、式(XIV)の化合物1当量に対して0. 5～10当量使用できる。

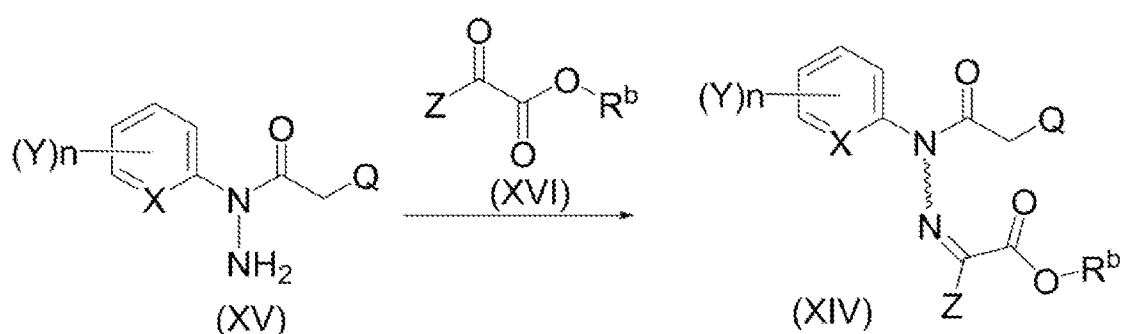
[0084] 中間体製法〔2〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、前記中間体製法〔1-2〕と同様のものなどから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0085] 中間体製法〔2〕の反応温度は、 -20°C ～ 150°C 程度である。反応時間は、0. 5時間～24時間程度である。

[0086] 中間体製法〔2-1〕

前記式 (XIV) の化合物は、式 (XV) の化合物と式 (XVI) の化合物とを、必要に応じて酸の存在下で、反応させることにより製造することができる。式 (XVI) の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造することができ、例えば、公知の文献（例えば、US 2004087569A1（6頁目の[0092]、7頁目の[0093]）等）の記載に準じて製造することができる。

[0087] [化16]



[0088] 式中の記号は前述の通りである。

[0089] 酸としては、例えば塩酸、硫酸などの無機酸；酢酸、ギ酸、メタンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸などの有機酸；が挙げられる。酸は、式 (XV) の化合物 1 当量に対して 0.1 ~ 10 当量使用できる。

[0090] 中間体製法〔2-1〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセ

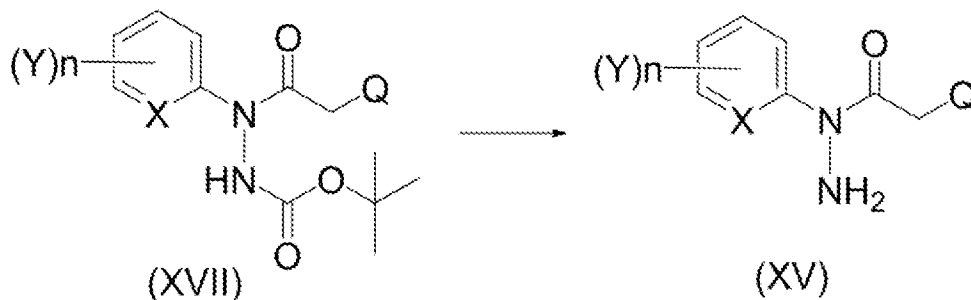
トニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0091] 中間体製法〔2-1〕の反応温度は、 -20°C ～ 150°C 程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0092] 中間体製法〔2-2〕

前記式(XV)の化合物は、公知の文献(例えば、Protective Groups in Organic Synthesis Fourth Edition, John Wiley & Sons, Inc等)の記載に準じて製造することができる。例えば、式(XV)の化合物は、式(XVII)の化合物を酸の存在下で反応させることにより製造することができる。

[0093] [化17]



[0094] 式中の記号は前述の通りである。

[0095] 酸としては、例えば塩酸などの無機酸；トリフルオロ酢酸などの有機酸；などが挙げられる。酸は、式(XVII)の化合物1当量に対して0.1～1.0当量使用できる。また、場合により溶媒を兼ねて過剰量使用してもよい。

[0096] 中間体製法〔2-2〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエ

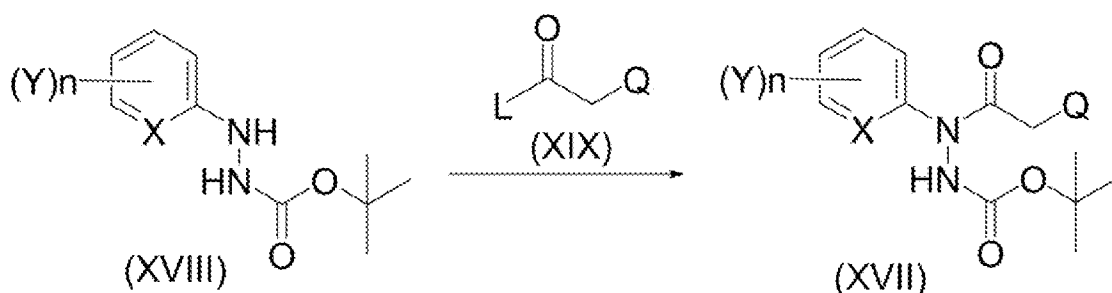
タン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0097] 中間体製法〔2-2〕の反応温度は、0℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0098] 中間体製法〔2-3〕

前記式(XV11)の化合物は、式(XV111)の化合物と式(X1X)の化合物とを、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。式(X1X)の化合物は市販されているか或いは中間体製法〔2-6〕の方法で製造することができる。

[0099] [化18]



[0100] 式中の記号は前述の通りである。

[0101] 塩基としては、前記中間体製法〔2〕と同様のものなどが挙げられる。塩基は、式(XV111)の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

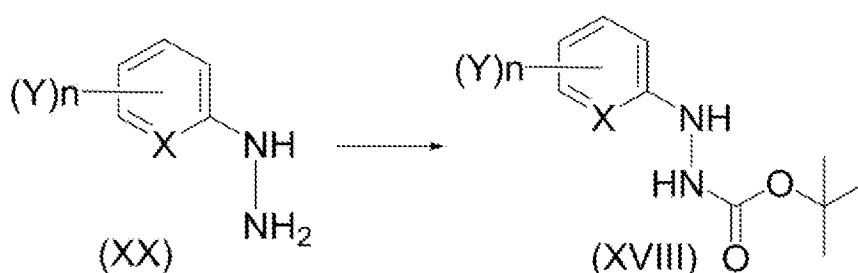
[0102] 中間体製法〔2-3〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、前記中間体製法〔1-2〕と同様のものなどから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0103] 中間体製法〔2-3〕の反応温度は、-20℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0104] 中間体製法〔2-4〕

前記式（X V I I I）の化合物は、公知の文献（例えば、Protective Groups in Organic Synthesis Fourth Edition, John Wiley & Sons, Inc等）の記載に準じて製造することができる。例えば、式（X V I I I）の化合物は、式（X X）の化合物と、例えば二炭酸ジ-*tert*-ブチル（（Boc）₂O）などの保護化試薬とを、必要に応じて塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

[0105] [化19]



[0106] 式中の記号は前述の通りである。

[0107] 中間体製法〔2-4〕の反応は、必要に応じて塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウム等のアルカリ土類金属炭酸塩；水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；トリエチルアミン、4-メチルモルホリン、ジイソプロピルエチルアミンなどの第三級アミン類；1, 8-ジアザビシクロ〔5. 4. 0〕-7-ウンデセン、4-(ジメチルアミノ)ピリジンなどが挙げられる。塩基は、式（X X）の化合物1当量に対して0. 5～10当量使用できる。

[0108] 中間体製法〔2-4〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；N, N-ジメチル

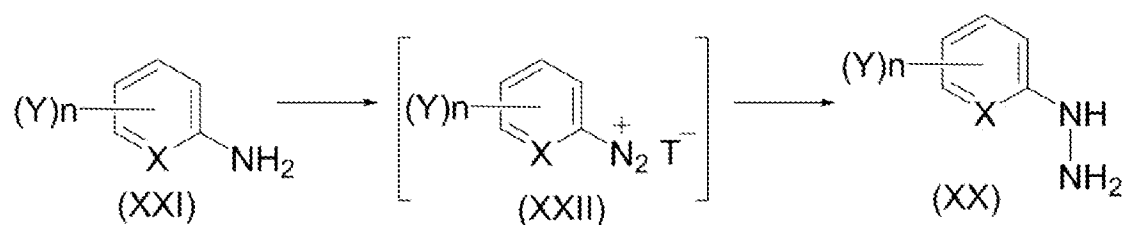
ホルムアミド、N，N－ジメチルアセトアミド、N－メチル－2－ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；水；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0109] 中間体製法〔2－4〕の反応温度は、0℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0110] 中間体製法〔2－5〕

前記式（XX）の化合物は、市販品を使用できる他、式（XXI）の化合物と亜硝酸ナトリウム等の亜硝酸塩とを、酸を含む水溶液中で反応させて、該当する式（XXII）のジアゾニウム塩を調製した後、調製したジアゾニウム塩と還元剤とを、酸を含む水溶液中で反応させることにより製造することができる。式（XXI）の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造することができ、例えば、公知の文献（例えば、国際公開第2021/097057号（348頁、Intermediate A-7のStep 1～Step 3）等）の記載に準じて製造することができる。また、式（XXI）の化合物は中間体製法〔2－5－1〕の方法で製造することもできる。

[0111] [化20]



[0112] 式中、T⁻は塩化物イオン、硫酸イオン、酢酸イオン及びトリフルオロ酢酸アニオンであり、他の記号は前述の通りである。

[0113] 酸としては、例えば塩酸、硫酸などの無機酸；酢酸、トリフルオロ酢酸などの有機酸；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。酸は、式（XXI）の化合物1当量に対して通常1当量以上、場合により溶媒を兼ねて過剰量用いられる。

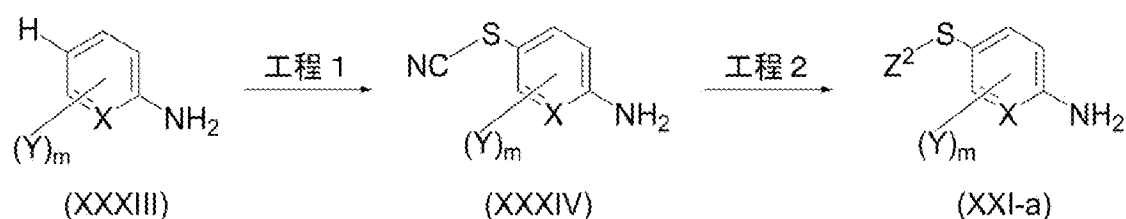
[0114] 還元剤としては、塩化スズ(II)などが挙げられる。還元剤は、式 (XXXI) の化合物 1 当量に対して 0.5 ～ 10 当量使用できる。

[0115] 中間体製法〔2-5〕の反応温度は、 -20°C ～ 100°C 程度である。反応時間は、0.5 時間 ～ 24 時間程度である。

[0116] 中間体製法〔2-5-1〕

中間体製法〔2-5〕における前記式 (XXXI) の化合物中、Y としてアルキルチオを有する式 (XXXI-a) の化合物は、例えば、次の工程 1 及び工程 2 の反応により製造することができる。

[0117] [化21]



[0118] 式中、 m は 0 ～ 3 の整数であり、 Z^2 は第一級のアシルであり、その他の記号は前述の通りである。

[0119] 中間体製法〔2-5-1〕の工程 1 では、式 (XXXIII) の化合物とチオシアン酸アンモニウムとを、酸化剤の存在下で反応させ、式 (XXXIV) の化合物を製造している。式 (XXXIII) の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造できる。

[0120] 酸化剤としては、例えばペルオキソ二硫酸カリウム、ペルオキソ二硫酸アンモニウムなどが挙げられる。酸化剤は、式 (XXXIII) の化合物 1 当量に対して 0.5 ～ 10 当量使用できる。

[0121] 中間体製法〔2-5-1〕の工程 1 は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；アセトニト

リル、プロピオニトリルなどのニトリル類；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類；水；酢酸などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0122] 中間体製法〔2-5-1〕の工程1の反応温度は、0℃～100℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0123] 中間体製法〔2-5-1〕の工程2では、工程1で得られた式(XXXIV)の化合物と第一級アルコールとを、塩基の存在下で反応させ、式(XXI-a)の化合物を製造している。

[0124] 第一級アルコールとしては、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールなどが挙げられる。

[0125] 塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウム等のアルカリ土類金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化バリウム等のアルカリ土類金属水酸化物；水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；ナトリウムメトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類；などが挙げられる。塩基は、式(XXXIV)の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

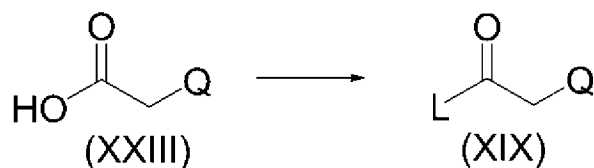
[0126] 中間体製法〔2-5-1〕の工程2の反応温度は、0℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0127] 中間体製法〔2-6〕

前記式(XIX)の化合物は、式(XXXIII)の化合物とハロゲン化剤とを反応させることにより製造することができる。式(XXXIII)の化合物は市販されているか或いは中間体製法〔2-7〕や中間体製法〔2-9〕の方法で製造することができる。

[0128]

[化22]



[0129] 式中の記号は前述の通りである。

[0130] ハロゲン化剤としては、特に制限されないが、例えば塩化チオニル、塩化オキサリル、塩化ホスホリル、塩化スルフリル、三塩化リン、五塩化リンなどが挙げられる。ハロゲン化剤は、式 (XXIII) の化合物 1 当量に対して 0.5～20 当量使用できる。また、場合によっては、式 (XXIII) の化合物 1 当量に対して 20 当量以上使用してもよい。

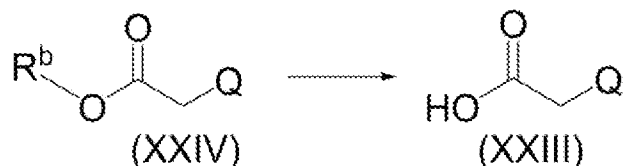
[0131] 中間体製法〔2-6〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、前記中間体製法〔1-2〕と同様のものなどから 1 種又は 2 種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0132] 中間体製法〔2-6〕の反応温度は、0℃～150℃程度である。反応時間は、0.5 時間～24 時間程度である。

[0133] 中間体製法〔2-7〕

前記式 (XXIII) の化合物は、式 (XXV) の化合物を塩基の存在下で加水分解することにより製造することができる。

[0134] [化23]



[0135] 式中の記号は前述の通りである。

[0136] 塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウム等のアルカリ土類金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化バリウム等のアルカリ土類金属水

酸化物；などが挙げられる。塩基は、式（XXIV）の化合物 1 当量に対して 0.5～10 当量使用できる。

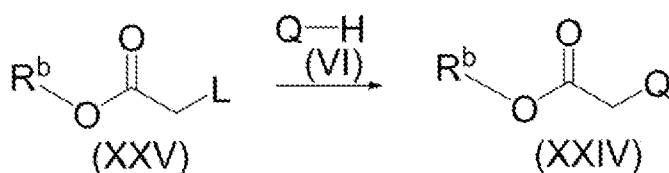
[0137] 中間体製法〔2-7〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類；水；などから 1 種又は 2 種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0138] 中間体製法〔2-7〕の反応温度は、0℃～150℃程度である。反応時間は、0.5 時間～24 時間程度である。

[0139] 中間体製法〔2-8〕

前記式（XXIV）の化合物は、市販品を使用できる他、式（XXV）の化合物と式（VI）の化合物とを、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。式（XXV）の化合物は市販されている。

[0140] [化24]



[0141] 式中の記号は前述の通りである。

[0142] 塩基としては、製法〔1〕と同様のものなどが挙げられる。塩基は、式（XXV）の化合物 1 当量に対して 0.5～10 当量使用できる。

[0143] 中間体製法〔2-8〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく

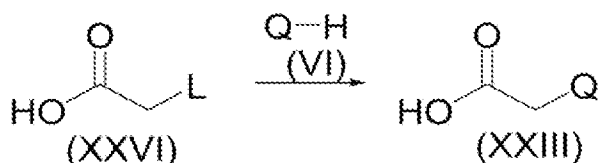
、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0144] 中間体製法〔2-8〕の反応温度は、0℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0145] 中間体製法〔2-9〕

前記式(XXIII)の化合物は、式(XXVI)の化合物と式(VI)の化合物とを、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。式(XXVI)の化合物は市販されている。

[0146] [化25]



[0147] 式中の記号は前述の通りである。

[0148] 塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウム等のアルカリ土類金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化バリウム等のアルカリ土類金属水酸化物；水素化ナトリウムのようなアルカリ金属水素化物；リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラジド、カリウムヘキサメチルジシラジド等の金属アミド類；ナトリウムメトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド類；などが挙げられる。塩基は、式(XXVI)の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

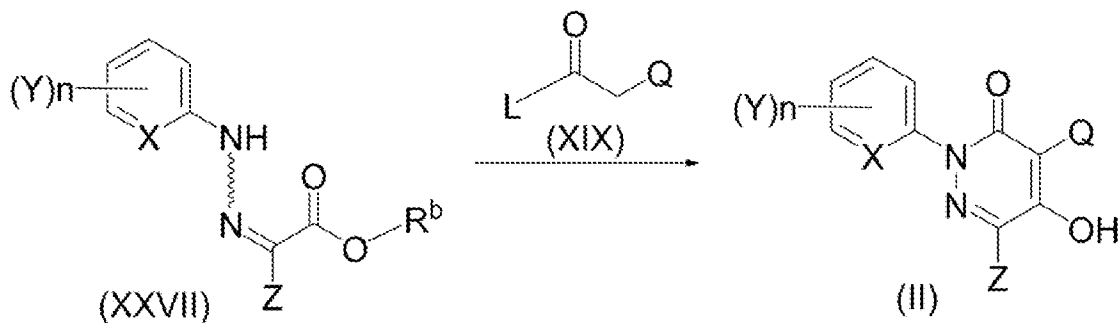
[0149] 中間体製法〔2-9〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；水；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0150] 中間体製法〔2-9〕の反応温度は、20℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0151] 中間体製法〔3〕

前記式(ⅠⅠ)の化合物は、式(XXVⅠⅠ)の化合物と式(XⅠX)の化合物とを反応させることにより製造することができる。

[0152] [化26]



[0153] 式中の記号は前述の通りである。

[0154] 中間体製法〔3〕の反応は、必要に応じて塩基の存在下で行うことができる。塩基としては、前記中間体製法〔2〕と同様のものなどが挙げられる。塩基は、式(XXVⅠⅠ)の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

[0155] 中間体製法〔3〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テト

ラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；アセトン、エチルメチルケトンなどのケトン類；ニトロメタン、ニトロエタンなどのニトロアルカン類；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

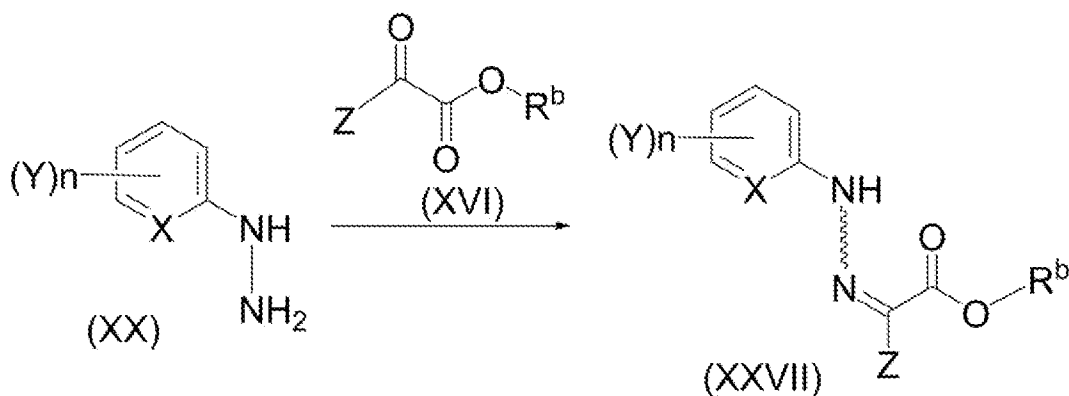
[0156] 中間体製法〔3〕の反応温度は、 -20°C ～ 150°C 程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0157] 中間体製法〔3-1〕

前記式(XXVII)の化合物は、式(XX)の化合物と式(XVI)の化合物とを、必要に応じて酸の存在下で反応させることにより製造することができる。

中間体製法〔3-1〕の反応は、前記中間体製法〔2-1〕と同様の方法で行うことができる。

[0158] [化27]



[0159] 式中の記号は前述の通りである。

[0160] 酸としては、例えば塩酸、硫酸などの無機酸；酢酸、ギ酸、メタンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸などの有機酸；が挙げられる。酸は、式（XX）の化合物1当量に対して0.1～10当量使用できる。

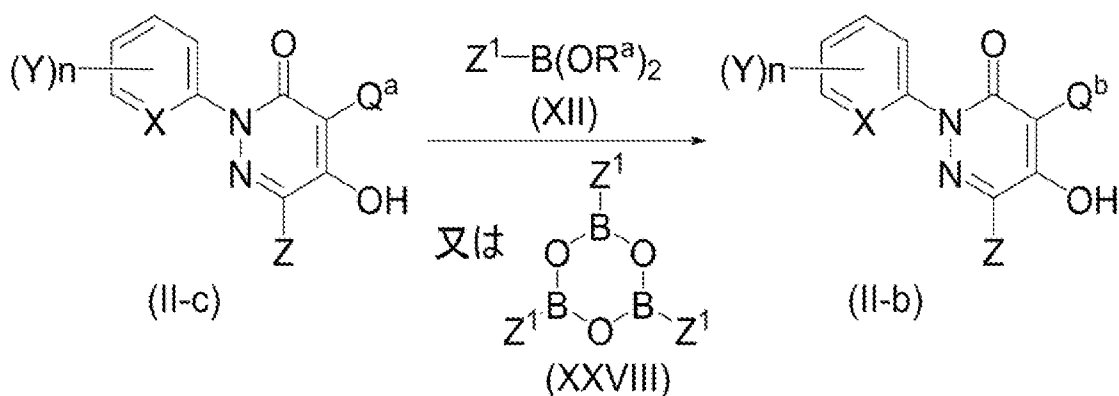
[0161] また、式（XXVII）の化合物は、公知の文献（例えば、Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 2014, 24, 1944-1947等）の記載に準じて製造することができる。

[0162] 中間体製法〔4〕

前記式（II）の化合物中、QがQ^bである式（II-b）の化合物は、式（II-c）の化合物と式（XI）又は式（XXVII）の化合物とを反応させることにより製造することができる。式（XI）又は式（XXVII）の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造できる。

中間体製法〔4〕の反応は、前記中間体製法〔1-3〕と同様の方法で行うことができる。

[0163] [化28]



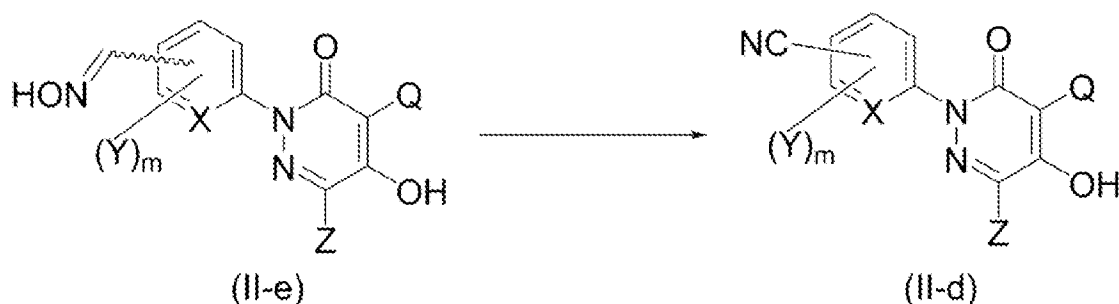
[0164] 式中、Q^aは環上の置換基として少なくとも1つの塩素、臭素又はヨウ素を有するQ¹、Q²、Q³又はQ⁴であり、Q^bは環上の置換基として少なくとも1つのアルキルを有するQ¹、Q²、Q³又はQ⁴であり、その他の記号は前述の通りである。また式（XXVII）中の複数のZ¹は同一でも相異なっても

よい。

[0165] 中間体製法〔5〕

前記式（ⅠⅠ）の化合物中、Yとしてシアノを有する式（ⅠⅠ-d）の化合物は、式（ⅠⅠ-e）の化合物と無水酢酸とを反応させることにより製造することができる。

[0166] [化29]



[0167] 式中の記号は前述の通りである。

[0168] 中間体製法〔5〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0169] 中間体製法〔5〕の反応温度は、50℃～200℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0170] 中間体製法〔5〕の反応は、必要に応じて、反応実施中の容器内に下記に挙げる塩基や溶媒を追加してもよい。また、反応の後処理や精製を行った後に得られた混合物と下記に挙げる塩基や溶媒とを混合してもよい。塩基や溶媒を加えた後の攪拌時間は0.5時間～12時間程度である。

[0171] 追加する塩基としては、前記中間体製法〔2-7〕と同様のものなどが挙げられる。塩基は、式（ⅠⅠ-e）の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。また、場合によっては、式（ⅠⅠ-e）の化合物1当量に対

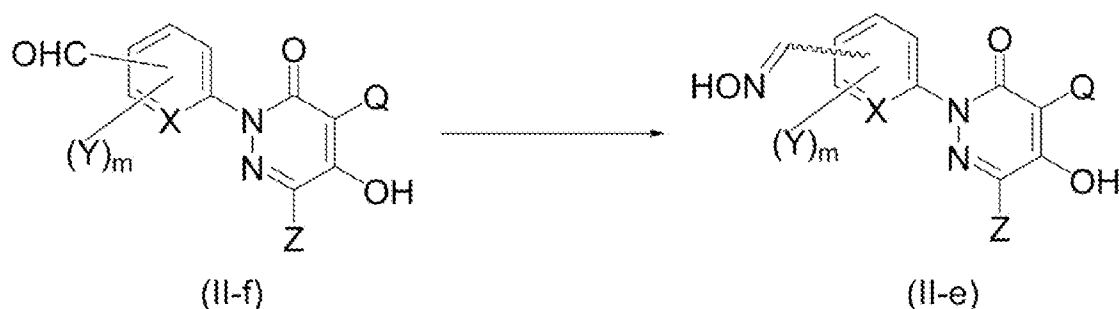
して10当量以上使用してもよい。

[0172] 追加する溶媒としては、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類；水；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0173] 中間体製法〔5-1〕

前記式(II-e)の化合物は、式(II-f)の化合物とヒドロキシルアミンとを、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。ヒドロキシルアミンは、ヒドロキシルアミン溶液又はヒドロキシルアミン塩を使用しても良い。

[0174] [化30]



[0175] 式中の記号は前述の通りである。

[0176] ヒドロキシルアミン溶液としては、例えばヒドロキシルアミン水溶液、ヒドロキシルアミン-エタノール混合溶液などが挙げられる。また、ヒドロキシルアミン塩としては、例えばヒドロキシルアミン塩酸塩、ヒドロキシルアミン硫酸塩などが挙げられる。

[0177] 塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の第三級アミン類；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウム等のアルカリ土類金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属

水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化バリウム等のアルカリ土類金属水酸化物；酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類；などから1種又は2種以上を適宜選択し、混合して使用することができる。塩基は、式(II-f)の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

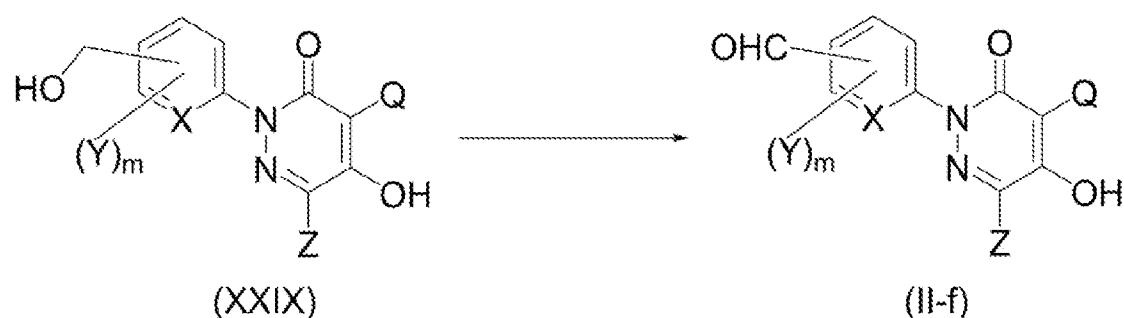
[0178] 中間体製法〔5-1〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類；水；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0179] 中間体製法〔5-1〕の反応温度は、-20℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0180] 中間体製法〔5-2〕

前記式(II)の化合物中、Yとしてホルミル基を有する式(II-f)の化合物は、式(XXIX)の化合物と酸化剤とを反応させることにより製造することができる。

[0181] [化31]



[0182] 式中の記号は前述の通りである。

[0183] 酸化剤としては、例えばジメチルスルホキシドー活性化剤、2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジン1-オキシド、1, 1, 1-トリアセトキシ-1, 1-ジヒドロ-1, 2-ベンゾヨードキソール-3-(1H)-オン、二酸化マンガン、クロロクロム酸ピリジニウム、ニクロム酸ピリジニウムなどが挙げられる。

[0184] ジメチルスルホキシドー活性化剤による酸化の場合、活性化剤としては、例えば無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸などの酸無水物；塩化チオニル、塩化オキサリルなどの酸塩化物；塩素、N-クロロスクシンイミドなどが挙げられる。

[0185] 2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジン1-オキシドを触媒量で用いることができ、その場合、再酸化剤として、例えば次亜塩素酸ナトリウム、ヨードベンゼンジアセタートなどを用いる。

[0186] 中間体製法〔5-2〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；アセトン、エチルメチルケトンなどのケトン類；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコールなどのアルコール類；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

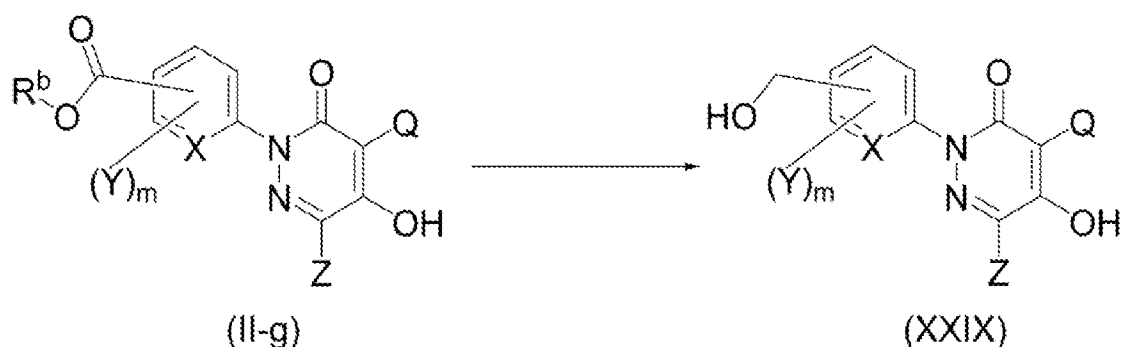
[0187] 中間体製法〔5-2〕の反応温度は、-78℃～150℃程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0188] 中間体製法〔5-3〕

前記式(XXIX)の化合物は、式(III-g)の化合物と還元剤とを反応させることにより製造することができる。式(III-g)の化合物は、中

間体製法〔2〕又は中間体製法〔3〕の方法で製造することができる。

[0189] [化32]



[0190] 式中の記号は前述の通りである。

[0191] 還元剤としては、特に制限されないが、例えば、水素化アルミニウムリチウム、水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化ビス（2-メトキシエトキシ）アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、ボラン-テトラヒドロフラン錯体などが挙げられる。還元剤は、式（II-g）の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

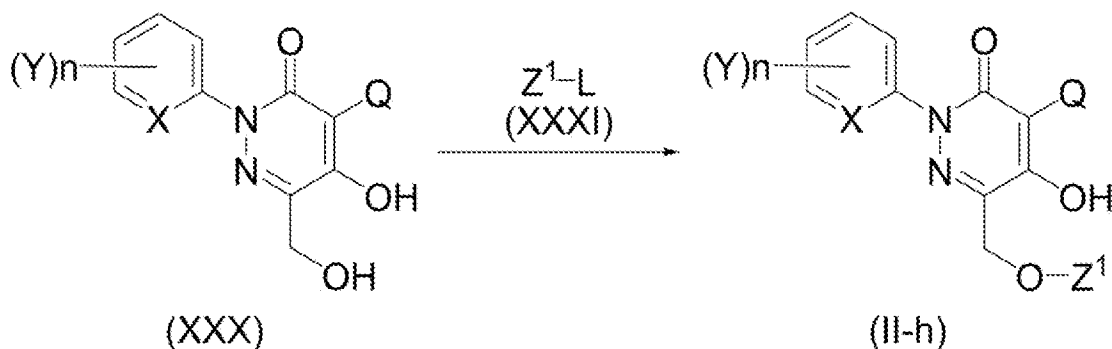
[0192] 中間体製法〔5-3〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；ジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1,4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類；などから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0193] 中間体製法〔5-3〕の反応温度は、 -20°C ～ 150°C 程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0194] 中間体製法〔6〕

前記式 (I I) の化合物中、Z がアルコシアルキルである式 (I I-h) の化合物は、式 (XXX) の化合物と式 (XXX I) の化合物とを、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。式 (XXX I) の化合物は、市販されているか或いは既知の方法に準じて製造できる。

[0195] [化33]



[0196] 式中の記号は前述の通りである。

[0197] 塩基としては、前記製法〔1〕と同様のものなどが挙げられる。塩基は、式 (XXX) の化合物 1 当量に対して 0.5 ~ 10 当量使用できる。

[0198] 中間体製法〔6〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、前記製法〔1〕と同様のものなどから 1 種又は 2 種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

[0199] 中間体製法〔6〕の反応温度は、0℃ ~ 150℃程度である。反応時間は、0.5 時間 ~ 24 時間程度である。

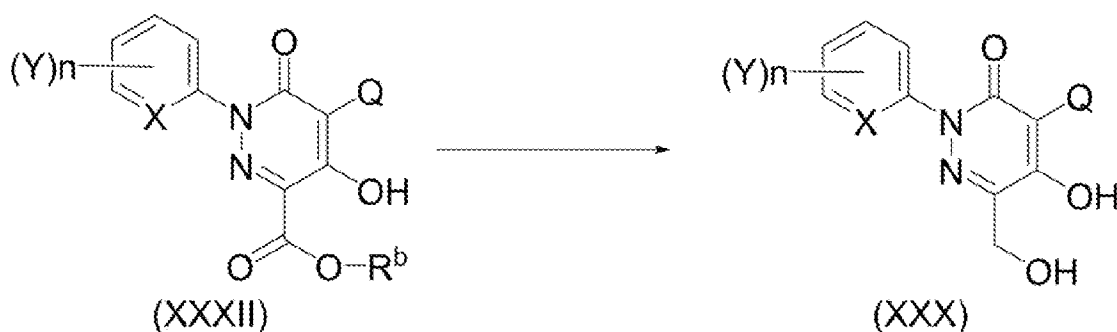
[0200] 中間体製法〔6〕の反応は、必要に応じて、反応実施中の容器内に下記に挙げる塩基や水を追加しても良い。塩基追加後の攪拌時間は 0.5 時間 ~ 12 時間程度である。

[0201] 追加する塩基としては、前記中間体製法〔2-7〕と同様のものなどが挙げられる。塩基は、式 (XXX) の化合物 1 当量に対して 0.5 ~ 10 当量使用できる。また、場合によっては、式 (XXX) の化合物 1 当量に対して 10 当量以上使用してもよい。

[0202] 中間体製法〔6-1〕

前記式（XXX）の化合物は、式（XXXI）の化合物と還元剤とを反応させることにより製造することができる。式（XXXI）の化合物は、中間体製法〔2〕及び中間体製法〔2-1〕、又は中間体製法〔3〕及び中間体製法〔3-1〕において、前記式（I）中のZを $-C(=O)OR^b$ と読み替えることにより、各製法及び各中間体製法に準じて製造することができる。

[0203] [化34]



[0204] 式中の記号は前述の通りである。

[0205] 還元剤としては、特に制限されないが、例えば、水素化アルミニウムリチウム、水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化ビス（2-メトキシエトキシ）アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、ボラン-テトラヒドロフラン錯体などが挙げられる。還元剤は、式（XXXI）の化合物1当量に対して0.5～10当量使用できる。

[0206] 中間体製法〔6-1〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、前記中間体製法〔5-3〕と同様のものなどから1種又は2種以上を適宜選択して、または混合して使用することができる。

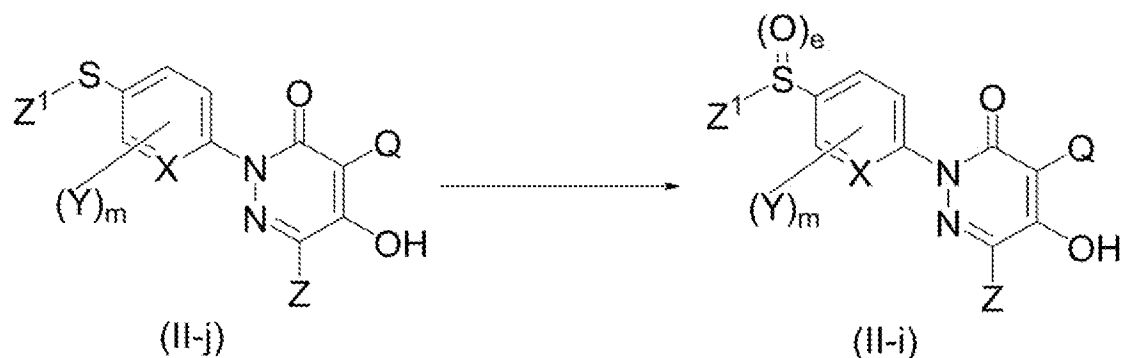
[0207] 中間体製法〔6-1〕の反応温度は、 -20°C ～ 150°C 程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0208] 中間体製法〔7〕

前記式（II）の化合物中、Yとしてアルキルスルフィニル、アルキルスルホニルを有する式（II-i）の化合物は、式（II-j）の化合物と酸

化剤とを反応させることにより製造することができる。式 (I I-j) の化合物は、中間体製法〔1〕及び中間体製法〔1-1〕～〔1-4〕、中間体製法〔2〕及び中間体製法〔2-1〕～〔2-9〕、又は中間体製法〔3〕及び中間体製法〔3-1〕の方法で製造することができる。

[0209] [化35]



[0210] 式中、eは1又は2であり、その他の記号は前述の通りである。

[0211] 酸化剤としては、例えば過酸化水素、過酢酸、過安息香酸、メタクロロ過安息香酸などの過酸化物が挙げられる。また、酸化剤として過酸化水素を用いる場合は、必要に応じて例えばタングステン酸ナトリウムなどを加えてもよい。

[0212] 中間体製法〔7〕の反応は、必要に応じて溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、特に制限されないが、例えばジエチルエーテル、ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル、1, 4-ジオキサン、ジメトキシエタンなどのエーテル類；塩化メチレン、ジクロロエタン、クロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンなどの芳香族炭化水素類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホランなどの非プロトン性極性溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリルなどのニトリル類；酢酸エチル、プロピオン酸エチルなどのエステル類；ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンなどの脂肪族炭化水素類；水；などから1種又は2種以上を適宜選択

して、または混合して使用することができる。

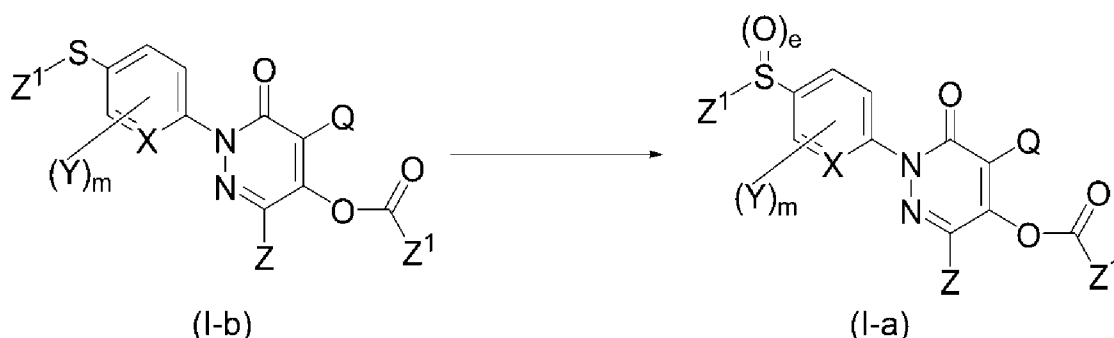
[0213] 中間体製法〔7〕の反応温度は、 -20°C ～ 100°C 程度である。反応時間は、0.5時間～24時間程度である。

[0214] 製法〔2〕

前記式（1）の化合物中、Yとしてアルキルスルフィニル、アルキルスルホニルを有する式（1-a）の化合物は、式（1-b）の化合物と酸化剤とを反応させることにより製造することができる。

製法〔2〕の反応は、前記中間体製法〔7〕と同様の方法で行うことができる。

[0215] [化36]



[0216] 式中の記号は前述の通りである。

[0217] 酸化剤としては、例えば過酸化水素、過酢酸、過安息香酸、メタクロロ過安息香酸などの過酸化物が挙げられる。また、酸化剤として過酸化水素を用いる場合は、必要に応じて例えばタングステン酸ナトリウムなどを加えてもよい。

[0218] 次に本発明化合物を含有する有害生物防除剤の望ましい態様について以下に記述する。

本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、例えば農園芸分野で問題となる害虫、ダニ、線虫又は土壌害虫の防除剤、即ち農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤として有用である。また、動物寄生生物の防除剤、即ち殺動物寄生生物剤として有用である。

[0219] 農園芸分野で問題となる前記害虫としては、アブラムシ類（モモアカアブ

ラムシ、ワタアブラムシ等)、ウンカ類(トビイロウンカ等)、ヨコバイ類、カイガラムシ類、カメムシ類、コナジラミ類(タバココナジラミ等)、アザミウマ類、バッタ類、ハナバエ類、コガネムシ類、アリ類、コナガ、ヨトウムシ、ハスモンヨトウ、コドリング、ボールワーム、タバコバッドワーム、マイマイガ、コブノメイガ、チャノコカクモンハマキ、コロラドハムシ、ウリハムシ、ボールウィービル、タマナヤガ、カブラヤガ等のような農業害虫類;ナメクジ、マイマイ等のような腹足類;イエダニ、ゴキブリ類、イエバエ、アカイエカ等のような衛生害虫類;バクガ、アズキゾウムシ、コクヌストモドキ、ゴミムシダマシ類等のような貯穀害虫類;イガ、ヒメカツオブシムシ、シロアリ類等のような衣類、家屋害虫類;などが挙げられる。

農園芸分野で問題となる前記ダニとしては、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、チャノホコリダニ、ミカンサビダニ、ネダニ等のような植物寄生性ダニ類;ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、ミナミツメダニ等のような屋内塵性ダニ類;などが挙げられる。

農園芸分野で問題となる前記線虫としては、ネコブセンチュウ類、シストセンチュウ類、ネグサレセンチュウ類、イネシンガレセンチュウ、イチゴメセンチュウ、マツノザイセンチュウ等のような植物寄生性線虫類;などが挙げられる。

農園芸分野で問題となる前記土壌害虫としては、ダンゴムシ、ワラジムシ等のような等脚類;などが挙げられる。

[0220] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、上記の中でも例えばカメムシ目害虫(Hemiptera)、アザミウマ目害虫(Thysanoptera)、コウチュウ目害虫(Coleoptera)、ダニ目害虫(Acari)、チョウ目害虫(Lepidoptera)、線虫類(Nematoda)の防除に適しており、なかでもカメムシ目害虫(Hemiptera)、ダニ目害虫(Acari)の防除に特に有効である。

これらの害虫及び線虫の具体的な例は、例えば以下のようなものなどが挙げられる。

[0221] カメムシ目害虫 (Hemiptera) に分類される、エンドウヒゲナガアブラムシ (*Acyrtosiphon pisum*)、オカボノクロアブラムシ (*Tetraneura nigriabdominalis*)、カンシャワタアブラムシ (*Ceratovacuna lanigera*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ダイズアブラムシ (*Aphis glycines*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、トウモロコシアブラムシ (*Rhopalosiphum maidis*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ヒエノアブラムシ (*Melanaphis sacchari*)、マメクロアブラムシ (*Aphis fabae*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricida*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ムギワラギクオマルアブラムシ (*Brachycaudus helichrysi*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*)、レタスヒゲナガアブラムシ (*Nasonovia ribisnigri*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、ヨーロッパリンゴアブラムシ (*Aphis pomi*)、イングリッシュグレインエイフィッド (*Sitobion avenae*)、オオバコアブラムシ (*Dysaphis plantaginea*) 等のアブラムシ類 (Aphididae)；ブドウネアブラムシ (*Daktulosphaira vitifoliae*)、ピーカンリーフフィロキセラ (*Phylloxera notabilis*)、ピーカンフィロキセラ (*Phylloxera devastatrix*)、サザンピーカンリーフフィロキセラ (*Phylloxera russellae*) 等のネアブラムシ類 (Phylloxeridae)；ツガカサアブラムシ (*Adelges tsugae*)、ヒメカサアブラムシ (*Aphrastasia pectinatae*)、バルサムウーリーアフィッド (*Adelges piceae*) 等のカサアブラムシ類 (Adelgidae)；オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、チャトゲコナジラミ (*Aleurocanthus camelliae*)、ヒサカキワタフキコナジラミ (*Pealius euryae*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*) 等のコナジラミ類 (Aleyrodidae)；キタウンカ (*Javesella pellucida*)、クロフツノウンカ (*Perkinsiella saccharicida*)、セジロウンカ (*Sog*

atella furcifera)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、ライスデルファシッド (*Tagosodes orizicolus*) 等のウンカ類 (*Delphacidae*) ; イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus*)、ジャガイモヒメヨコバイ (*Empoasca fabae*)、シロオオヨコバイ (*Cofana spectra*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、フタテンミドリヒメヨコバイ (*Amrasca biguttula*)、コーンリーフホッパー (*Dalbulus maidis*) 等のヨコバイ類 (*Cicadellidae*) ; ヨーロピアンスピトルバグ (*Philaenus spumarius*) 等のアワフキムシ類 (*Aphrophoridae*) ; *Mahanarva fimbriolata* 等のコガシラアワフキムシ類 (*Cercopidae*) ; アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、イネクロカメムシ (*Scotinophara lurida*)、オオトゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris lewisi*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha halys*)、シラホシカメムシ (*Eysarcoris ventralis*)、チャバネアオカメムシ (*Plautia stali*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris aeneus*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、ムラサキシラホシカメムシ (*Eysarcoris annamita*)、ブラックパディーバグ (*Scotinophara coarctata*)、ブラウスティンクバグ (*Euschistus heros*)、グリーンベリースティンクバグ (*Dichelops melanacanthus*)、レッドバンデッドスティンクバグ (*Piezodorus guildinii*)、ライススティンクバグ (*Oebalus pugnax*) 等のカメムシ類 (*Pentatomidae*) ; subterranean stink bug (*Scaptocoris castanea*) 等のツチカメムシ類 (*Cydnidae*) ; クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocorisa acuta*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*) 等のホソヘリカメムシ類 (*Alydidae*) ; アシビロヘリカメムシ (*Leptoglossus australis*)、ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*) 等のヘリカメムシ類 (*Coreidae*) ; アメリカコバネナガカメムシ (*Blissus leucopterus*)、カンシヤコバネナガカメムシ (*Cavelerius saccharivorus*)、コバネヒョウタンナ

ガカメムシ (*Togo hemipterus*) 等のナガカメムシ類 (*Lygaeidae*) ; アカスジカスミカメ (*Stenotus rubrovittatus*) 、アカヒゲホソミドリカスミカメ (*Trigonotylus caelestialium*) 、サビイロカスミカメ (*Lygus lineolaris*) 、マキバカスミカメ (*Lygus rugulipennis*) 、フタトゲムギカスミカメ (*Stenodema calcarata*) 等のカスミカメムシ類 (*Miridae*) ; アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*) 、ウメシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis prunicola*) 、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*) 、シュロマルカイガラムシ (*Abgrallaspis cyanophylli*) 、ナシマルカイガラムシ (*Diaspidiotus perniciosus*) 、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*) 等のマルカイガラムシ類 (*Diaspididae*) ; ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*) 等のカタカイガラムシ類 (*Coccidae*) ; イセリアカイガラムシ (*Icerya purchasi*) 、キイロワタフキカイガラムシ (*Icerya seychellarum*) 等のワタフキカイガラムシ類 (*Margarodidae*) ; ガハニコナカイガラムシ (*Pseudococcus calceolariae*) 、クロテンコナカイガラムシ (*Phenacoccus solenopsis*) 、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*) 、ナガオコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinus*) 、ナスコナカイガラムシ (*Phenacoccus solani*) 、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*) 、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*) 、ライスミーリーバグ (*Brevinnia rehi*) 等のコナカイガラムシ類 (*Pseudococcidae*) ; ジャガイモトガリキジラミ (*Bactericera cockerelli*) 、チュウゴクナシキジラミ (*Cacopsylla chinensis*) 、ナシキジラミ (*Cacopsylla pyrisuga*) 、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*) 、ミカントガリキジラミ (*Trioza erythrae*) 、pear sucker (*Cacopsylla pyricola*) 等のキジラミ類 (*Psyllidae*) ; アワダチソウグンバイ (*Corythucha marmorata*) 、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyrioides*) 、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*) 、プラタナスグンバイ (*Corythucha ciliata*) 等のグンバイムシ類 (*Tingidae*) ; トコジラミ (*Cimex lectularius*) 、ネツタイトコジラミ (*Cimex hemipterus*) 等のトコジラミ類 (*Cimicidae*) ; *Quesada gigas*等のセミ類 (*Cicadidae*) ; オオサシガメ (*Triatoma rubrofasci*

ata)、ブラジルサシガメ (*Triatoma infestans*)、ベネズエラサシガメ (*Rhodonius prolixus*)、*Triatoma dimidiata*等のサシガメ類 (Reduviidae)。

[0222] アザミウマ目害虫 (Thysanoptera) に分類される、イネアザミウマ (*Stenchaetothrips biformis*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、モトジロアザミウマ (*Echinothrips americanus*)、アボカドスリップス (*Scirtothrips perseae*) 等のアザミウマ類 (Thripidae)；イネクダアザミウマ (*Haplothrips aculeatus*) 等のクダアザミウマ類 (Phlaeothripidae)。

[0223] コウチュウ目害虫 (Coleoptera) に分類される、イネトゲハムシ (*Dicladispa armigera*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、クビアカクビボソハムシ (*Oulema melanopus*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、サツマイモヒサゴトビハムシ (*Chaetocnema confinis*)、ジユウイチホシウリハムシ (*Diabrotica undecimpunctata* Mannerheim)、タバコノミハムシ (*Epitrix hirtipennis*)、ヨツモンカメノコハムシ (*Lacoptera quadrimaculata*)、バンデッドキューカンバービートル (*Diabrotica balteata*)、ビーンリーフビートル (*Cerotoma trifurcata*)、キャベッジステムフリービートル (*Psylliodes chrysocephala*)、コーンフリービートル (*Chaetocnema pulicaria*)、キャベッジフリービートル (*Phyllotreta cruciferae*)、キューカービットビートル (*Diabrotica speciosa*)、グレープコラスピス (*Colaspis brunnea*)、ホップフリービートル (*Psylliodes punctulata*)、ノーザンコーンルートワーム (*Diabrotica barberi*)、ポテトフリービートル (*Epitrix cucumeris*)、サザンコーンリーフビートル (*Myochrous denticollis*)、ウエスタンブラックフリービートル (*Phyllotreta pusilla*)、ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera virgifera*)、メキシカンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera zeae*) 等のハムシ類

(Chrysomelidae) ; スレンダーシードコーンビートル (*Clivina impressifrons*)、シードコーンビートル (*Stenolophus lecontei*) 等のオサムシ類 (Carabidae) ; アオドウガネ (*Anomala albopilosa*)、クロコガネ (*Holotrichia kiotonensis*)、オオクロコガネ (*Holotrichia parallela*)、クロマルコガネ (*Tomarus gibbosus*)、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ナガチャコガネ (*Heptophylla picea*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、ヨーロピアンチェーファー (*Rhizotrogus majalis*)、ジューンビートル (*Phyllophaga crinita*)、*Phyllophaga anxia*、*Phyllophaga crassissima*、アブデルスツノカブト (*Diloboderus abderus*) 等のコガネムシ類 (Scarabaeidae) ; ワタミヒゲナガゾウムシ (*Araecerus coffeae*) 等のヒゲナガゾウムシ類 (Anthribidae) ; アリモドキゾウムシ (*Cylas formicarius*) 等のホソクチゾウムシ類 (Aponidae) ; アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、ブラジルマメゾウムシ (*Zabrotes subfasciatus*) 等のマメゾウムシ類 (Bruchidae) ; マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*)、コーヒーベリーボラー (*Hypothenemus hampei*) 等のキクイムシ類 (Scolytidae) ; アルファルフアタコゾウムシ (*Hypera postica*)、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、イモゾウムシ (*Euscepes postfasciatus*)、グラナリアコクゾウムシ (*Sitophilus granarius*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、ココクゾウムシ (*Sitophilus oryzae*)、サビヒョウタンゾウムシ (*Scepticus griseus*)、シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus*)、シロスジオサゾウムシ (*Rhabdoscelus lineaticollis*)、トビイロヒョウタンゾウムシ (*Scepticus uniformis*)、ワタミハナゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、コットンルートボラー (*Eutinobothrus brasiliensis*)、サザンコーンビルバグ (*Sphenophorus callosus*)、シュガーケーンウィービル (*Sphenophorus levis*)、*Aracanthus mourei*、ソイビーンストークウィービル (*Sternechus subsignatus*) 等のゾウムシ類 (Curculionidae) ; ガイマイゴミムシダマシ (*Alphitobius diaperinus*)、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)、ヒラ

タコクヌストモドキ (*Tribolium confusum*) 等のゴミムシダマシ類 (*Tenebrionidae*) ; オオニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctomaculata*) 、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*) 等のテントウムシ類 (*Coccinellidae*) ; コナナガシンクイ (*Rhizopertha dominica*) 、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*) 等のナガシンクイムシ類 (*Bostrychidae*) ; ヒョウホンムシ類 (*Ptinidae*) ; クビアカツヤカミキリ (*Aromia bungii*) 、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*) 、*Migdolus fryanus*等のカミキリムシ類 (*Cerambycidae*) ; オキナワカンシャクシコメツキ (*Melanotus okinawensis*) 、クシコメツキ (*Melanotus legatus*) 、トビイロムナボソコメツキ (*Agriotes fuscicollis*) 、アエオルス属 (*Aeolus* spp.) 、アシフトコメツキ属 (*Anchastus* spp.) 、コノデルス属 (*Conoderus* spp.) 、クテニセラ属 (*Ctenicera* spp.) 、リモニウス属 (*Limonius* spp.) 等のコメツキムシ類 (*Elateridae*) ; アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*) 等のハネカクシ類 (*Staphylinidae*) ; ハラジロカツオブシムシ (*Dermestes maculatus*) 、ヒメアカカツオブシムシ (*Trogoderma granarium*) 、ヒメマルカツオブシムシ (*Anthrenus verbasci*) 等のカツオブシムシ類 (*Dermestidae*) ; ジンサンシバンムシ (*Stegobium paniceum*) 、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*) 等のシバンムシ類 (*Anobiidae*) ; アカチビヒラタムシ (*Cryptolestes ferrugineus*) 等のチビヒラタムシ類 (*Laemophloeidae*) ; ノコギリヒラタムシ (*Oryzaephilus surinamensis*) 等のホソヒラタムシ類 (*Silvanidae*) ; ブロッサムビートル (*Brassicogethes aeneus*) 等のケシキスイムシ類 (*Nitidulidae*) 。

- [0224] ダニ目害虫 (*Acari*) に分類される、オリゴニカス属 (*Oligonychus* spp.) 、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*) 、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) 、ミカンハダニ (*Panonychus citri*) 、ミツユビナミハダニ (*Tetranychus evansi*) 、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*) 等のハダニ類 (*Tetranychidae*) ; カキサビダニ (*Aceria diospyri*) 、シソサビダニ (*Shevtchenkella* sp.) 、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*) 、チャノナガサビダニ (*Ac*

aphylla theavagrans)、トマトサビダニ (Aculops lycopersici)、ニセナシサビダニ (Eriophyes chibaensis)、ミカンサビダニ (Aculops pelekassi)、リュウキュウミカンサビダニ (Phyllocoptruta citri)、リンゴサビダニ (Aculus schlechtendali)、Aceria tosichella等のフシダニ類 (Eriophyidae) ; チャノホコリダニ (Polyphagotarsonemus latus) 等のホコリダニ類 (Tarsonemidae) ; ミナミヒメハダニ (Brevipalpus phoenicis) 等のヒメハダニ類 (Tenuipalpidae) ; ケナガハダニ類 (Tuckerellidae) ; ケナガコナダニ (Tyrophagus putrescentiae)、ハウレンソウケナガコナダニ (Tyrophagus similis) 等のコナダニ類 (Acaridae) ; コナヒョウヒダニ (Dermatophagoides farinae)、ヤケヒョウヒダニ (Dermatophagoides pteronyssinus) 等のチリダニ類 (Pyroglyphidae) 。

- [0225] チョウ目害虫 (Lepidoptera) に分類される、アズキノメイガ (Ostrinia scapulalis)、アワノメイガ (Ostrinia furnacalis)、イッテンオオメイガ (Scirpophaga incertulas)、イネハカジノメイガ (Marasmia exigua)、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、シバツトガ (Pediasia teterrellus)、ニカメイガ (Chilo suppressalis)、ハイマダラノメイガ (Hellula undalis)、モンキクロノメイガ (Herpetogramma luctuosale)、ワタノメイガ (Hartmalodes derogata)、ダークヘッドストライプドボーラー (Chilo polychrysus)、イネミズメイガ (Nymphula depunctalis)、イネシロオオメイガ (Scirpophaga innotata)、サトウキビメイガ (Diatraea saccharalis)、ナスノメイガ (Leucinodes orbonalis)、ヨーロピアンコーンボーラー (Ostrinia nubilalis) 等のツトガ類 (Crambidae) ; スジコナマダラメイガ (Ephestia kuehniella)、スジマダラメイガ (Cadra cautella)、ノシメマダラメイガ (Plodia interpunctella)、フタモンマダラノメイガ (Euzophera batangensis)、モロコシマダラメイガ (Elasmopalpus lignosellus) 等のメイガ類 (Pyralidae) ; アフリカシロナヨトウ (Spodoptera exempta)、アワヨトウ (Mythimna separata)、イネキンウワバ (Plusia festucae)、イネヨトウ (Sesamia inferens)、シロイチモジヨトウ (Spodoptera exigua)

、シロナヨトウ (*Spodoptera mauritia*)、タマナギンウワバ (*Autographa nigrisigna*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、フタオビコヤガ (*Naranga aenescens*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、サザンアーミーワーム (*Spodoptera eridania*)、soybean looper (*Chrysodeixis includens*)、*Spodoptera cosmioidea*、*Trichoplusia* spp.、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、カブラヤガ (*Agrotis segetum*)、スジキリヨトウ (*Spodoptera depravata*)、タバコガ (*Helicoverpa assulta*)、ナカジロシタバ (*Aedia leucomelas*)、African pink stem borer (*Sesamia calamistis*)、cotton leafworm (*Alabama argillacea*)、hop vine borer moth (*Hydraecia immanis*)、ソイビーンルーパー (*Pseudoplusia includens*)、velvetbean caterpillar (*Anticarsia gemmatilis*) 等のヤガ類 (Noctuidae)；オオモンシロチョウ (*Pieris brassicae*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類 (Pieridae)；アズキサヤムシガ (*Matsumuraeses azukivora*)、カクモンハマキ (*Archips xylosteanus*)、カンシャシנקイハマキ (*Tetramoera schistaceana*)、コドリリング (*Cydia pomonella*)、スモモヒメシנקイ (*Grapholita dimorpha*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、ナシヒメシנקイ (*Grapholita molesta*)、マメシנקイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、citrus fruit borer (*Citripestis sagittiferella*)、グレープベリーモス (*Lobesia botrana*)、*Epinotia aporema* 等のハマキガ類 (Tortricidae)；キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*)、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*) 等のホソガ類 (Gracillariidae)；モモシנקイガ (*Carposina sasakii*) 等のシנקイガ類 (Carposinidae)；ギンモンハモグリガ (*Lyonetia prunifoliella*)、モモハモ

グリガ (*Lyonetia clerkella*)、coffee leaf miner (*Leucoptera coffeella*) 等のハモグリガ類 (*Lyonetiidae*) ; マイマイガ (*Lymantria dispar*)、チャドクガ (*Euproctis pseudoconspersa*) 等のドクガ類 (*Lymantriidae*) ; コナガ (*Plutella xylostella*) 等のコナガ類 (*Plutellidae*) ; イモキバガ (*Helcystogramma triannulella*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*)、モモキバガ (*Anarsia lineatella*)、ワタアカミムシガ (*Pectinophora gossypiella*) 等のキバガ類 (*Gelechiidae*) ; アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等のヒトリガ類 (*Arctiidae*) ; giant sugarcane borer (*Telchin licus*) 等のカストニアガ類 (*Castniidae*) ; ヒメボクトウ (*Cossus insularis*) 等のボクトウガ類 (*Cossidae*) ; ウメエダシャク (*Cystidia couaggaria*)、ヨモギエダシャク (*Ascotis selenearia*) 等のシャクガ類 (*Geometridae*) ; アオイラガ (*Parasa consocia*)、イラガ (*Monema flavescens*)、ヒロヘリアオイラガ (*Parasa lepida*) 等のイラガ類 (*Limacodidae*) ; カキノヘタムシガ (*Stathmopoda masinissa*) 等のニセマイコガ類 (*Stathmopodidae*) ; クロメンガタスズメ (*Acherontia lachesis*) 等のスズメガ類 (*Sphingidae*) ; キクビスカシバ (*Nokona feralis*)、コスカシバ (*Synanthedon hector*)、ヒメコスカシバ (*Synanthedon tenuis*) 等のスカシバガ類 (*Sesiidae*) ; イネツトムシ (*Parnara guttata*) 等のセセリチョウ類 (*Hesperiidae*) ; イガ (*Tinea translucens*)、コイガ (*Tineola bisselliella*) 等のヒロズコガ類 (*Tineidae*) ; ナミアゲハ (*Papilio Xuthus*)、キアゲハ (*Papilio machaon hippocrates*) 等のアゲハチョウ類 (*Papilionidae*) 。

- [0226] 線虫類 (*Nematoda*) に分類される、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*) 等のアフエレンコイデス類 (*Aphelenchoididae*) ; キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、*Pratylenchus brachyurus*、*Radopholus similis*等のプラティレンクス類 (*Pratylenchidae*) ; キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイ

モネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ジャガイモシロシストセンチュウ (*Globodera pallida*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、guava root-knot nematodes (*Meloidogyne enterolobii*) 等のヘテロデラ類 (*Heteroderidae*) ; *Rotylenchulus reniformis*等のホプロライムス類 (*Hoplolaimidae*) ; イチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*)、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*) 等のアングイナ類 (*Anguinidae*) ; ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*) 等のティレンクルス類 (*Tylenchulidae*) ; ブドウオオハリセン (*Xiphinema index*) 等のロンギドルス類 (*Longidoridae*) ; トリコドルス類 (*Trichodoridae*) ; マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 等のパラシタアフェレンクス類 (*Parasitaphelenchidae*) 。

[0227] 本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類等の防除に特に有効である。その中でも、植物寄生性ダニ類、農業害虫類の防除にさらに優れた効果を示すため、殺虫剤又は殺ダニ剤として非常に有用である。

また、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、有機リン剤、カーバメート剤、合成ピレスロイド剤、ネオニコチノイド剤等の既存薬剤に対する各種抵抗性害虫の防除にも有効である。

さらに本発明化合物は、優れた浸透移行性を有していることから、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤を土壌に処理することによって土壌有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹脚類、等脚類の防除と同時に茎葉部の害虫類をも防除することができる。

[0228] 本発明化合物を含有する殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤の別の望ましい態様としては、前記した農業害虫類、腹足類、植物寄生性ダニ類、植物寄生性線虫類、土壌害虫類等を総合的に防除する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤が挙げられる。

[0229] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、例えば、トマト、ミニトマト、ピーマン、ナス、キュウリ、ズッキーニ、スイカ、メロン、カボチャ、オクラ、トウガラシ、シロウリ、トウガン、ニガウリ、マクワウリなどの果菜類；レタス、リーフレタス、ハウレンソウ、キャベツ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス、ブロッコリー、カリフラワー、ハクサイ、ツルムラサキ、ネギ、ミズナ、シソ、コマツナ、セルリーなどの葉菜類；バレイショ、サツマイモ、ダイコン、ニンジン、ゴボウ、レンコン、サトイモ、コンニャク、ヤマノイモ、ショウガ、カブ、ラッキョウ、ミョウガ、モリアザミなどの根菜類；ダイズ、アズキ、エンドウマメ、インゲンマメ、ラッカセイ、ソラマメ、エダマメなどの豆類；イネ、コムギ、エンバク、ライムギ、トウモロコシなどの穀類；リンゴ、カンキツ類、ナシ、ブドウ、イチゴ、クルミ、アーモンド、バナナ、イチジク、パイナップル、モモ、ネクタリン、チェリー、アプリコット、ココナッツ、アボカド、カキ、プラム、ピスタチオ、キウイフルーツ、ビワなどの果樹・果実・種実類；コウライシバ、ベントグラスなどの芝類；キク、ユリ、バラ、カーネーション、ダリア、ガーベラ、セントポーリア、チューリップ、スイセン、ペチュニア、スズラン、ボタン、シクラメン、ハウセンカ、トルコギキョウなどの花卉類；ツツジ類などの花木類；ワタ、ナタネ、ビート、チャ、タバコ、コーヒー、オリーブ、サトウキビ、ホップ、ゴマ、パセリ、タイム、ローズマリー、バジル、ラベンダーなどの工芸作物類；ラン、サボテン類、シダ植物類などの観葉植物；クローバ、アルファルファ、オーチャードグラス、ジョンソングラスなどの牧草類等の農園芸上有用な植物に対して用いることができる。

[0230] なお、これら植物には、除草剤（例えば、イソキサフルトールなどのH P P D阻害剤；イマゼタピル、チフェンスルフロンメチルなどのA L S阻害剤；グリホサートなどのE P S P合成酵素阻害剤；グルホシネートなどのグルタミン合成酵素阻害剤、セトキシジムなどのアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤；ブロモキシニル；ジカンバ；2，4-Dなど）に対する耐性を、古典的な育種法により付与された植物が含まれる。さらに、遺伝子組換え技

術や遺伝子編集技術により作出された形質転換植物も含まれる。形質転換植物の一例としては、前記除草剤に耐性の形質転換植物、害虫抵抗性の形質転換植物、植物成分に関する形質転換植物、植物病原耐性の形質転換植物なども含まれる。

[0231] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、通常、該化合物と各種補助剤とを混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、顆粒水溶剤、水溶剤、乳剤、液剤、ペースト剤、エアゾール剤、微量散布剤等の種々の形態に製剤して使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオリナイト、セリサイト、クレイ、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉等の固形担体；水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、アルコール等の溶剤；脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸塩ホルムアルデヒド縮合物のような陰イオン系の界面活性剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂

脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルアリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤；オリーブ油、カボック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィン等の植物油や鉱物油；シリコンオイル等が挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選んで使用することもでき、例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤、等通常使用される各種補助剤も使用することができる。本発明化合物と各種補助剤との配合割合（重量比）は0.001：99.999～95：5、望ましくは0.005：99.995～90：10である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、又は水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油等）を添加して使用することができる。

[0232] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の施用は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病害虫の種類や発生状況等の相違により一概に規定できないが、一般に0.1～50,000ppm、望ましくは1～30,000ppmの有効成分濃度で行ない、その単位面積あたりの施用量は、1ヘクタール当り本発明化合物が0.01～50,000g、望ましくは1～30,000gである。また、本発明には、このような施用方法による害虫、ダニ、線虫又は土壌害虫の防除方法、特に植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植

物寄生性線虫類の防除方法も含まれる。

[0233] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の種々の製剤、又はその希釈物の施用は、通常、一般に行なわれている施用方法すなわち、散布（例えば、噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粒、水面施用等）、土壌施用（混入、灌注等）、表面施用（塗布、粉衣、被覆等）、浸漬毒餌等により行うことができる。また、家畜に対して前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での有害虫、特に有害昆虫の発生及び生育を阻害することも可能である。また、いわゆる超高濃度少量散布法(*ultra low volume application method*)により施用することもできる。この方法においては、活性成分を100%含有することが可能である。

[0234] 例えば、本発明化合物を含有する有害生物防除剤を植物へ施用する場合、害虫、ダニ、線虫、土壌害虫などの有害生物に直接、及び／又は土壌若しくは植物体に、有効量の有害生物防除剤を施用することにより有害生物を防除できる。前記植物体は、有害生物防除剤が施用される植物の地上部（例えば、茎、葉、幹）、地下部（例えば、根部）又は種子を意味する。前記種子は有性生殖によって形成される散布体（いわゆる種子）、植物の器官（例えば、塊茎、鱗茎、球茎、根茎、種芋）、或いは果樹類、花木類又は花き類の挿穂（例えば、果樹類であるブドウの枝など）などを意味する。

[0235] この場合、本発明化合物を含有する有害生物防除剤の植物への施用は、例えば、土壌処理、茎葉処理、灌注処理、種子処理、樹幹注入処理、又は水稻育苗箱施用等により行うことができる。一般に土壌処理、茎葉処理、灌注処理の場合、その施用適量は1ヘクタールあたり本発明化合物が、0.01g～50,000g、望ましくは1g～30,000gとすることができる。種子処理の場合、その施用適量は1kgの種子あたり0.01g～200g、望ましくは0.05～100gとすることができる。水稻育苗箱施用の場合、その施用適量は1個の育苗箱あたり本発明化合物が0.001g～3,000g、望ましくは0.01g～1,000gとすることができる。樹幹注入処理の場合、その施用適量は1樹あたり本発明化合物が0.001g～

5, 000 g、望ましくは0.01 g～3, 000 g程度とすることができる。

[0236] 上記において、土壌処理とは、例えば、本発明化合物を液体製剤（液剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、乳剤など）又は固形製剤（粒剤、粉剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤など）等に調製して、そのまま又は水に希釈して、植物体の移植前又は播種前に土壌全面に散布し混和する方法、植物体を植えるために開けた穴の中（植え穴）に散布する方法、或いは播種又は植物体を植えるために一定の幅に掘った浅い溝に散布する方法などが挙げられる。

[0237] 茎葉処理とは、例えば、本発明化合物を液体製剤（液剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、乳剤など）又は固形製剤（水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤など）等に調製して、水に希釈して植物体全体に散布する方法などが挙げられる。

[0238] 灌注処理とは、例えば、本発明化合物を液体製剤（液剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤など）又は固形製剤（水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤など）等に調製して、そのまま又は水に希釈して育苗用の栽培容器、栽培中の植物体の株元又はその近傍などに灌注する方法などが挙げられる。

[0239] 種子処理とは、例えば、本発明化合物を液体製剤（水性懸濁剤、油性懸濁剤、乳剤、液剤など）又は固形製剤（粉剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤など）に調製して、そのまま又は水に希釈して、種子と攪拌し種子表面に付着させる方法；コーティング資材とともに混和し種子の表面に付着させる方法；種子に吹き付け付着させる方法；種子を浸漬して薬剤を浸透させる方法などが挙げられる。

[0240] 水稻育苗箱施用とは、例えば、本発明化合物を固形製剤（粒剤、粉剤など）又は液体製剤（水性懸濁剤、油性懸濁剤、液剤など）等に調製して、そのまま又は水に希釈して、播種の前、播種の後、播種の前後両方、育苗箱での生育時、又は水田への移植前に、育苗箱へ散布する方法が挙げられる。そして、育苗箱へ播種時に培土との混和、例えば、本発明化合物を固形製剤（粒

剤、粉剤、顆粒水和剤など）に調製して床土、覆土又は培土の全体に混和させる方法なども挙げられる。

[0241] 樹幹注入処理とは、例えば、本発明化合物を液体製剤（液剤など）等に調製してそのまま樹幹にあけた穴から植物体に注入する方法などが挙げられる。

[0242] また、本発明化合物を含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤等と混用又は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。

前記混用又は併用とは、本発明化合物と他の成分とを、同時に、別々に又は時間間隔をおいて使用することを意味する。

他の農薬としては、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、抗ウイルス剤、誘引剤、抗生物質、植物ホルモン、植物成長調整剤等が挙げられる。特に、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物の1種又は2種以上とを混用又は併用した殺虫用組成物、殺ダニ用組成物、殺線虫用組成物又は殺土壌害虫用組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物は各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような殺虫用組成物、殺ダニ用組成物、殺線虫用組成物又は殺土壌害虫用組成物も含まれる。

[0243] 本発明化合物並びに他の殺虫剤、及び／又は殺線虫剤の有効成分化合物との混合比（本発明化合物：他の有効成分化合物）は、気象条件、製剤形態、対象作物、施用時期、施用場所、害虫や線虫の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、重量比で、一般に1：300～300：1であり、望ましくは1：100～100：1とすることができる。また、施用適量は1ヘクタール当りの総有効成分化合物量は、0.1～70,000g、望ましくは5～50,000gとすることができる。本発明には、このような混合殺虫及び殺線虫組成物の施用による害虫及び線虫の防除方法も含まれ

る。

[0244] 上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壌害虫剤、すなわち殺害虫剤の有効成分化合物（一般名又は日本植物防疫協会試験コード）としては、例えば、下記の化合物群から適宜選択することができる。特に記載がない場合であっても、これら化合物に、塩、アルキルエステル、光学異性体のような各種構造異性体などが存在する場合は、当然それらも含まれる。

[0245] プロフェノホス (profenofos)、ジクロロボス (dichlorvos)、フェナミホス (fenamiphos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、E P N ((RS)-(O-ethyl 0-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate))、ダイアジノン (diazinon)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル (chlorpyrifos-methyl)、アセフェート (acephate)、プロチオホス (prothiofos)、ホスチアゼート (fosthiazate)、カズサホス (cadusafos)、ジスルホトン (disulfoton)、イソキサチオン (isoxathion)、イソフェンホス (isofenphos)、エチオン (ethion)、エトリムホス (etrimfos)、キナルホス (quinalphos)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジメトエート (dimethoate)、スルプロホス (sulprofos)、チオメトン (thiometon)、バミドチオン (vamidothion)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリダフェンチオン (pyridaphenthion)、ピリミホスメチル (pirimiphos-methyl)、プロパホス (propaphos)、ホサロン (phosalone)、ホルモチオン (formothion)、馬拉チオン (malathion)、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、シアノホス (cyanophos)、トリクロルホン (trichlorfon)、メチダチオン (methidathion)、フェントエート (phenthioate)、オキシデプロホス (oxydeprofos、別名ESP)、アジンホスメチル (azinphos-methyl)、フェンチオン (fenthion)、ヘプテノホス (heptenophos)、パラチオン (parathion)、ホスホカルブ (phosphocarb)、デメトン-S-メチル (demeton-S-methyl)、モノクロトホス (monocrotophos)、メタミドホス (methamidophos)、イミシアホス (imicyafos)、パラチオ

ン-メチル (parathion-methyl)、テルブホス (terbufos)、ホスファミドン (phosphamidon)、ホスメット (phosmet)、ホレート (phorate) のような有機リン酸エステル系化合物；

カルバリル (carbaryl)、プロポキスル (propoxur)、アルジカルブ (aldicarb)、カルボフラン (carbofuran)、チオジカルブ (thiodicarb)、メソミル (methomyl)、オキサミル (oxamyl)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、ピリミカルブ (pirimicarb)、フェノブカルブ (fenobucarb)、カルボスルファン (carbosulfan)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、ベンダイオカルブ (bendiocarb)、フラチオカルブ (furathiocarb)、イソプロカルブ (isoprocab)、メトルカルブ (metolcarb)、キシリルカルブ (xylylcarb)、XMC (3,5-xylyl methylcarbamate)、フェノチオカルブ (fenothiocarb) のようなカーバメート系化合物；

[0246] カルタップ (cartap)、チオシクラム (thiocyclam)、シュウ酸水素チオシクラム (thiocyclam oxalate)、チオシクラム塩酸塩 (thiocyclam hydrochloride)、ベンスルタップ (bensultap)、チオスルタップ (thiosultap)、モノスルタップ (monosultap；別名チオスルタップモノナトリウム (thiosultap-monosodium)、ビスルタップ (bisultap；別名チオスルタップジナトリウム (thiosultap-disodium)、ポリチアラン (polythialan) のようなネライストキシン誘導体；

ジコホル (dicofol)、テトラジホン (tetradifon)、エンドスルファン (endosulfan)、ジエノクロル (dienochlor)、ディルドリン (dieldrin)、メトキシクロル (methoxychlor) のような有機塩素系化合物；

酸化フェンブタスズ (fenbutatin oxide)、シヘキサチン (cyhexatin)、アゾシクロチン (azocyclotin) のような有機スズ系化合物；

フェンバレレート (fenvalerate)、ペルメトリン (permethrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、アルファ-シペルメトリン (alpha-cypermethrin)、ゼータ-シペルメトリン (zeta-cypermethrin)、シーター-シペルメトリン (theta-cypermethrin)、ベーター-シペルメトリン (beta-cypermethrin)、

デルタメトリン (deltamethrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、ガンマシハロトリン (gamma-cyhalothrin)、ラムダシハロトリン (lambda-cyhalothrin)、テフルトリン (tefluthrin)、カップーテフルトリン (kappa-tefluthrin)、エトフェンプロックス (etofenprox)、フルフェンプロックス (flufenprox)、シフルトリン (cyfluthrin)、ベータシフルトリン (beta-cyfluthrin)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルバリネート (fluvalinate)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、ピレスリン (pyrethrins)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、テトラメスリン (tetramethrin)、レスメトリン (resmethrin)、プロトリフェンブト (protrifenbute)、ビフェントリン (bifenthrin)、カップービフェントリン (kappa-bifenthrin)、アクリナトリン (acrinathrin)、アレスリン (allethrin)、タウフルバリネート (tau-fluvalinate)、トラロメトリン (tralomethrin)、プロフルトリン (profluthrin)、メトフルトリン (metofluthrin)、イプシロンメトフルトリン (epsilon-metofluthrin)、ヘプタフルトリン (heptafluthrin)、フェノトリン (phenothrin)、フルメトリン (flumethrin)、モムフルオロトリン (momfluorothrin)、イプシロンモムフルオロトリン (epsilon-momfluorothrin)、シラフルオフエン (silafluofen)、クロロプラレトリン (chloroprallethrin) のようなピレスロイド系化合物；

[0247] ジフルベンズロン (diflubenzuron)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、ルフエヌロン (lufenuron)、ノバルロン (novaluron)、トリフルムロン (triflumuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ビストリフルロン (bistrifluron)、ノビフルムロン (noviflumuron)、フルアズロン (fluazuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron) のようなベンゾイルウレア系化合物；

メトプレン (methoprene)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、ジオフェノラン (diofenolan) のような幼若

ホルモン様化合物；

ピリダベン (pyridaben) のようなピリダジノン系化合物；

フェンピロキシメート (fenpyroximate)、シエノピラフェン (cyenopyrafen)、シエトピラフェン (cyetpyrafen) のようなピラゾール系化合物；

アセトプロール (acetoprole)、エチプロール (ethiprole)、フィプロニル (fipronil)、フルフィプロール (flufiprole)、ピラフルプロール (pyrafluprole)、ピリプロール (pyriprole)、ニコフルプロール (nicofluprole)、バニリプロール (vaniliprole) のようなフェニルピラゾール系化合物；

ピフルブミド (pyflubumide)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、ジンプロピリダズ (dimpropyridaz) のようなピラゾールカルボキサミド系化合物；

クロラントラニリプロール (chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、シクラニリプロール (cyclaniliprole)、テトラクロラントラニリプロール (tetrachlorantraniliprole)、テトラニリプロール (tetraniliprole)、チクロピラゾフロル (tyclopiazoflor)、フルクロルジニリプロール (fluchloridiniliprole)、チオラントラニリプロール (tiorantraniliprole)、ピオキサニリプロール (pioxaniliprole) のようなピリジルピラゾール系化合物；

[0248] イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyram)、アセタミプリド (acetamiprid)、チアクロプリド (thiacloprid)、チアメトキサム (thiamethoxam)、クロチアニジン (clothianidin)、ジノテフラン (dinotefuran)、ニチアジン (nithiazine) のようなネオニコチノイド系化合物；

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

ピリダリル (pyridalyl)、フロニカミド (flonicamid) のようなピリジン

系化合物；

スピロジクロフェン (spirodiclofen)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スピロブジフェン (spirobudifen) のようなテトロン酸系化合物；

スピロテトラマト (spirotetramat)、スピロピジオン (spiropidion)、スピドキサマト (spidoxamat) のようなテトラミン酸系化合物；

フルアクリピリム (fluacrypyrim)、ピリミノストロビン (pyriminostrob in)、フルピロキシストロビン (flupyroxystrobin) のようなストロビルリン系化合物；

フルフェネリム (flufenerim)、ピリミジフェン (pyrimidifen) のようなピリミジナミン系化合物；

マラチオン (malathion) のような有機硫黄化合物；

シロマジン (cyromazine) のようなトリアジン系化合物；

ヒドラメチルノン (hydramethylnon) のようなヒドラゾン系化合物；

フルベンジアミド (flubendiamide)、シハロジアミド (cyhalodiamide) のようなフタルアミド系化合物；

[0249] ブロフラニリド (broflanilide)、シプロフラニリド (cyproflanilide)、モドフラネル (modoflaner)、ピペルフラニリド (piperflanilide) のようなメタジアミド系化合物；

ジアフェンチウロン (diafenthion) 、クロロメチウロン (chloromethion) のようなチオウレア系化合物；

アミトラズ (amitraz)、クロルジメホルム (chlordimeform)、クロロメブホルム (chloromebuform) のようなホルムアミジン系化合物；

ピメトロジン (pymetrozine)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazon) のようなピリジンアゾメチン系化合物；

アフォキシラネル (afoxolaner)、フルアラネル (fluralaner)、フルキサメタミド (fluxametamide)、サロラネル (sarolaner)、イソシクロセラム (isocycloseram)、ウミフォキシラネル (umifoxolaner)、チゴラネル (tigolaner)、ミボリラネル (mivorilaner)、イソフルアラナム (isofluala

nam) のようなイソキサゾリン系化合物 ;

フルエンスルホン (fluensulfone) 、トリフルエンフロネート (trifluenfluronate) のようなフルオロアルケニル系化合物 ;

[0250] ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz) 、トリフルメゾピリム (triflumezopyrim) 、フェンメゾジチアズ (fenmezoditiaz) のようなメソイオン系化合物 ;

アフィドピロペン (afidopyropen) のようなピロペン系化合物 ;

また、その他の化合物として、ブプロフェジン (buprofezin) 、ヘキシチアゾクス (hexythiazox) 、トリアザメート (triazamate) 、クロルフェナピル (chlorfenapyr) 、インドキサカルブ (indoxacarb) 、アセキノシル (acequinocyl) 、エトキサゾール (etoxazole) 、1, 3-ジクロロプロペン (1, 3-dichloropropene) 、ベンクロチアズ (benclothiaz) 、ビフェナゼート (bifenazate) 、プロパルギット (propargite) 、クロフェンテジン (clofentezine) 、メタフルミゾン (metaflumizone) 、シフルメトフェン (cyflumetofen) 、フェナザキン (fenazaquin) 、アミドフルメト (amidoflumet) 、スルフルラミド (sulfluramid) 、ヒドラメチルノン (hydramethylnon) 、メタアルデヒド (metaldehyde) 、スルホキサフロル (sulfoxaflor) 、ベルブチン (verbutin) 、フルヘキサホン (fluhexafon) 、チオキサザフェン (tioxazafen) 、フロメトキン (flometoquin) 、フルピラジフロン (flupyradifurone) 、フルアザインドリジン (fluazaindolizine) 、アシノナピル (acynonapyr) 、ベンズピリモキサン (benzpyrimoxan) 、フルピリミン (flupyrimin) 、オキサゾスルフィル (oxazosulfyl) 、シクロブトリフルラム (cyclobutrifluram) 、フルペンチオフェノクス (flupentiofenox) 、インダザピロキサメット (indazapyroxamet) 、スルフィフルミン (sulflumin) 、ビスルフルフェン (bisulflufen) 、シベンゾキサスルフィル (cybenzoxasulfyl) 、チアピラクロル (tiapyrachlor) 、ベンチオフルミン (bentioflumin) のような化合物など。

[0251] また、下記化合物と組み合わせてもよい。

Bacillus thuringiensis aizawai, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, *Bacillus thuringiensis*, *Paecilomyces lilacinus*, *Bacillus methylophilus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus amyloliquefaciens*, 又は *Bacillus licheniformis* が生成する結晶タンパク毒素、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤などのような微生物農薬；

[0252] アバメクチン (abamectin)、エマメクチン安息香酸塩 (emamectin benzoate)、イベルメクチン (ivermectin)、ミルベメクチン (milbemectin)、ミルベマイシンオキシム (milbemycin oxime)、レピメクチン (lepimectin)、スピノサド (spinosad)、スピネトラム (spinetoram) のような抗生物質及び半合成抗生物質；

アザジラクチン (azadirachtin)、ロテノン (rotenone)、リアノジン (ryanodine) のような天然物；

ディート (deet) のような忌避剤；

パラフィン油、鉱物油 (mineral oil) のような物理的防除剤；

レドプロナ (ledprona) のようなRNAi農薬。

[0253] 上記他の農薬中の、殺菌剤の有効成分化合物（一般名又は日本植物防疫協会試験コード）としては、例えば、下記の化合物群から適宜選択することができる。特に記載がない場合であっても、これら化合物に、塩、アルキルエステル、光学異性体のような各種構造異性体などが存在する場合は、当然それらも含まれる。

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

アメトクトラジン (ametoctradin) のようなトリアゾロピリミジン系化合物；

トリシクラゾール (tricyclazole) のようなトリアゾロベンゾチアゾール系化合物；

フルアジナム (fluazinam) のようなピリジナミン系化合物；

トリアジメホン (triadimefon)、ビテルタノール (bitertanol)、トリフルミゾール (triflumizole)、エタコナゾール (etaconazole)、プロピコナゾール (propiconazole)、ペンコナゾール (penconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、ミクロブタニル (myclobutanil)、シプロコナゾール (cyproconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、フルコナゾールシス (furconazole-cis)、プロクロラズ (prochloraz)、メトコナゾール (metconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、オキシポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、トリアジメノール (triadimenol)、フルトリアホル (flutriafol)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、ブロムコナゾール (bromiconazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、シメコナゾール (simeconazole)、ペフラゾエート (pefurazoate)、イプコナゾール (ipconazole)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、アザコナゾール (azaconazole)、トリチコナゾール (triticonazole)、イマザリル (imazalil)、イプフェントリフルコナゾール (ipfentrifluconazole)、メフェントリフルコナゾール (mefentrifluconazole)、フルオキシチオコナゾール (fluoxytioconazole) のようなアゾール系化合物；

キノメチオナート (chinomethionat) のようなキノキサリン系化合物；

[0254] マンネブ (maneb)、ジネブ (zineb)、マンゼブ (mancozeb)、ポリカーバメート (polycarbamate)、メチラム (metiram)、プロピネブ (propineb)、チラム (thiram) のようなジチオカーバメート系化合物；

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

ベノミル (benomyl)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、カルベンダジム (carbendazim)、チアベンダゾール (thiabendazole)、フベ

リダゾール (fuberidazole) のようなベンゾイミダゾール系化合物；

シモキサニル (cymoxanil) のようなシアノアセトアミド系化合物；

メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルーM (metalaxyl-M；別名メフェノキサム (mefenoxam))、オキサジキシル (oxadixyl)、オフラセ (ofurace)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシルーM (benalaxyl-M、別名キララキシル (kiralaxyl、chiralaxyl))、フララキシル (furalaxyl)、バリフェナレート (valifenalate) のようなフェニルアミド系化合物；

シプロフラム (cyprofuram)、カルボキシシン (carboxin)、オキシカルボキシシン (oxycarboxin)、チフルザミド (thi.fluzamide)、ボスカリド (boscalid)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、イソチアニル (isotianil)、チアジニル (tiadinil)、ピラジフルミド (pyraziflumid) のようなアニリド系化合物；

[0255] ジクロフルアニド (dichlofluanid)、トリルフルアニド (tolylfluanid) のようなスルファミド系 (スルフェン酸系) 化合物；

水酸化第二銅 (cupric hydroxide)、有機銅 (oxine copper)、無水硫酸銅、ノニルフェノールスルホン酸銅、8-ヒドロキシキノリン銅、ドデシルベンゼンスルホン酸ビスエチレンジアミン銅錯塩(II) (別名DBEDC) のような銅系化合物；

ホセチルアルミニウム (fosetyl-Al)、トルクロホスメチル (tolclofos-Methyl)、エジフェンホス (edifenphos)、イプロベンホス (iprobenfos) のような有機リン系化合物；

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

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

[0256] フルトラニル (flutolanil)、メプロニル (mepronil)、ベノダニル (benodanil)、フルフェノキサジアザム (flufenoxadiazam) のようなベンズアニリド系化合物；

カルプロパミド (carpropamid)、ジクロシメット (diclocymet)、シルチオファム (silthiofam)、フェノキサニル (fenoxanil) のようなアミド系化合物；

ベンゾビンジフルピル (benzovindiflupyr)、ビキサフェン (bixafen)、フルインダピル (fluindapyr)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、フラメトピル (furametpyr)、イソピラザム (isopyrazam)、ペンフルフェン (penflufen)、ペンチオピラド (penthiopyrad)、ピジフルメトフェン (pydiflumetofen)、セダキサン (sedaxane)、イソフルシプラム (isoflucypram)、インピルフルキサム (inpyrfluxam)、ピラプロポイン (pyrapropoyne)、フルベネテラム (flubeneteram) のようなピラゾールカルボキサミド系化合物；

[0257] フルオピコリド (fluopicolide)、フルオピラム (fluopyram)、ゾキサミド (zoxamide)、フルオピモミド (fluopimomide) のようなベンズアミド系化合物；

フェンフラム (fenfuram) のようなフラニリド系化合物；

イソフェタミド (isofetamid) のようなチオフエンアミド系化合物；

トリホリン (triforine) のようなピペラジン系化合物；

ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリソキサゾール (pyrisoxazole)、アミノピリフェン (aminopyrifen) のようなピリジン系化合物；

フェナリモル (fenarimol)、フェリムゾン (ferimzone)、ヌアリモール (nuarimol)、フルメチルスルホリム (flumetylsulforim) のようなピリミジン系化合物；

フェンプロピジン (fenpropidin) のようなピペリジン系化合物；

フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、トリデモルフ (tridemorph) のようなモルホリン系化合物；

水酸化トリフェニルスズ (fentin hydroxide)、酢酸トリフェニルスズ (fentin acetate) のような有機スズ系化合物；

ペンシクロン (pencycuron) のような尿素系化合物；

[0258] ジメトモルフ (dimethomorph)、フルモルフ (flumorph)、ピリモルフ (pyrimorph)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、ベンチアバリカルブ-イソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl)、マンジプロパミド (mandipropamid) のようなカルボン酸アミド系化合物；

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

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

アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クレソキシムメチル (kresoxim-methyl)、メトミノストロビン (metominostrobin)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、オリサストロビン (orysastrobin)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、ピラオキシストロビン (Pyraoxystrobin)、ピラメトストロビン (Pyrametostrobin)、クモキシストロビン (coumoxystrobin)、エノキサストロビン (enoxastrobin)、フェナミンストロビン (fenaminstrobin)、フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、トリクロピリカルブ (triclopyricarb)、マンデストロビン (mandestrobin) のようなストロビルリン系化合物；

[0259] ファモキサドン (famoxadone)、オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin)、フルオキサピプロリン (fluoxapiprolin) のようなオキサゾール系化合物；

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

フェンアミドン (フェナミドン、fenamidone) のようなイミダゾリノン系化合物；

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

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

ジチアノン (dithianon) のようなアントラキノン系化合物；

メプチルジノカップ (meptyldinocap) のようなクロトン酸系化合物；

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

イミノクタジン (iminooctadine)、ドジン (dodine)、グアザチン (guazatine) のようなグアニジン系化合物；

ブチルアミン (butylamine)、セボクチラミン (seboctylamine) のような脂肪族窒素系化合物；

[0260] テブフロキン (tebufloquin)、キノキシフェン (quinoxifen)、キノフメリン (quinofumelin)、イプフルフェノキン (ipflufenquin) のようなキノリン系化合物；

フルチアニル (flutianil) のようなチアゾリジン系化合物；

プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、トルプロカルブ (tolprocarb) のようなカーバメート系化合物；

ピカルブトラゾクス (picarbutrazox)、メチルテトラプロール (metyltetraprole) のようなテトラゾール系化合物；

アミスルブロム (amisulbrom)、シアゾファミド (cyazofamid) のようなスルホンアミド系化合物；

メトラフェノン (metrafenone)、ピリオフェノン (pyriofenone) のようなアリルフェニルケトン系化合物；

プロベナゾール (probenazole)、ジクロベンチアゾクス (dichlobentiazo x) のようなベンゾチアゾール系化合物；

フェンピラザミン (fenpyrazamine) のようなフェニルピラゾール系化合物；

イソプロチオラン (isoprothiolane) のようなジチオラン系化合物；

フェンピコキサミド (fenpicoxamid)、フロリルピコキサミド (florylpicoxamid)、メタリルピコキサミド (metarylpicoxamid) のようなピコリンア

ミド系化合物；

ピリダクロメチル (pyridachlometyl) のようなピリダジン系化合物；

硫黄 (Sulfur)、石灰硫黄剤のような硫黄系化合物；

クロロインコナジド (chloroinconazide) のようなヒドラジド系化合物；

[0261] その他の化合物として、ピロキロン (pyroquilon)、ジクロメジン (diclo mezine)、クロルピクリン (chloropicrin)、ダゾメット (dazomet)、メタムナトリウム塩 (metam-sodium)、プロキナジド (proquinazid)、スピロキサミン (spiroxamine)、ジピメチトロン (dipymetitrone)、フェノピラミド (fenopyramid)、フェネプタミドキン (feneptamidoquin) など；

Bacillus amyloliquefaciens strain QST713、Bacillus amyloliquefaciens strain FZB24、Bacillus amyloliquefaciens strain MBI600、Bacillus amyloliquefaciens strain D747、Pseudomonas fluorescens、Bacillus subtilis、Trichoderma atroviride SKT-1のような微生物殺菌剤；及び

ティーツリー油 (Tea tree oil) のような植物抽出物。

[0262] 次に本発明の望ましい実施形態のいくつかを例示するが、これらは本発明を限定するものではない。

[0263] (1) 前記式 (1) で表されるピリダジノン系化合物又はその塩。

(2) Y 及び R^Aは各々ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルスルホニル、シアノ又は -C(=O)R^Bである (1) に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(3) Y 及び R^Aは各々ハロゲン、(C₁-C₄) アルキル、(C₂-C₄) アルケニル、(C₂-C₄) アルキニル、(C₃-C₆) シクロアルキル、(C₁-C₄) ハロアルキル、(C₁-C₄) アルコキシ、(C₁-C₄) ハロアルコキシ、(C₁-C₄) アルキルチオ、(C₁-C₄) アルキルスルフィニル、(C₁-C₄) アルキルスルホニル、シアノ又は -C(=O)R^Bであり；

Zは (C₁-C₅) アルキル、(C₃-C₆) シクロアルキル、(C₁-C₄) アルコキシ (C₁-C₄) アルキル、(C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₄)

アルキル又は (C_1-C_4) ハロアルキルであり；

R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は各々ハロゲン、(C_1-C_4) アルキル、(C_3-C_6) シクロアルキル、(C_1-C_4) ハロアルキル、(C_1-C_4) アルコキシ、(C_3-C_6) シクロアルキルオキシ、(C_1-C_4) ハロアルコキシ、(C_1-C_4) アルキルチオ、(C_1-C_4) アルキルスルフィニル、(C_1-C_4) アルキルスルホニル、(C_1-C_4) ハロアルキルチオ、(C_1-C_4) ハロアルキルスルフィニル、(C_1-C_4) ハロアルキルスルホニル、シアノ、ニトロ、アルデヒド、 $-CH(=NOR^C)$ 、1, 3-ジオキサソ-2-イル又は1, 3-ジオキサソラン-2-イルであり；

R^B は水素原子又は(C_1-C_4) アルキルであり；

R^C は(C_1-C_4) アルキルであり；

Gは R^D で置換されてもよい(C_1-C_4) アルキル、 $-C(=O)E$ 又は(C_1-C_4) アルキルスルホニルであり；

R^D は(C_1-C_4) アルコキシ、シアノ、(C_1-C_4) アルコキシカルボニル又は(C_1-C_4) アルコキシカルボニルオキシであり；

Eは(C_1-C_8) アルキル、(C_2-C_8) アルケニル、(C_3-C_6) シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、(C_1-C_8) ハロアルキル、(C_2-C_8) ハロアルケニル、(C_1-C_4) ジアルキルアミノ、 $N-(C_1-C_4)$ アルコキシ- $N-(C_1-C_4)$ アルキルアミノ、 V^A で置換されてもよいフェニル、 V^A で置換されてもよいピリジル、(C_3-C_6) シクロアルキル(C_1-C_4) アルキル、ヘテロシクロアルキル(C_1-C_4) アルキル、(C_1-C_4) アルコキシ(C_1-C_3) アルキル、(C_1-C_4) アルキルチオ(C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル(C_1-C_4) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ(C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル(C_2-C_4) アルケニル、(C_1-C_7) アルコキシ、(C_2-C_7) アルケニルオキシ、(C_2-C_7) アルキニルオキシ、(C_3-C_6) シクロアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、(C_1-C_7) ハロアルコキシ、(C_1-C_4) アルコキシ(C_1-C_3) アルコキシ、 V^A で置換されてもよい

フェニルオキシ、 V^A で置換されてもよいナフチルオキシ、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_3) アルコキシ、ヘテロシクロアルキル (C_1-C_3) アルコキシ、 V^B で置換されてもよいフェニル (C_1-C_3) アルコキシ、 (C_1-C_7) アルキルチオ又は2-イミダゾリジノンであり、当該Eにおけるヘテロシクロアルキル及びヘテロシクロアルキル部分は各々炭素原子以外に酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1種以上の原子を1つ以上含む3員～6員の基であり；

V^B はハロゲン又は (C_1-C_4) アルキルである(1)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(4) Y 及び R^A は各々ハロゲン、 (C_1-C_4) アルキル、 (C_2-C_4) アルケニル、 (C_2-C_4) アルキニル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_4) ハロアルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) アルキルスルホニル、シアノ又は $-C(=O)R^B$ である(3)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

[0264] (5) Z は (C_1-C_5) アルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル又は (C_1-C_4) ハロアルキルであり；

R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は各々ハロゲン、 (C_1-C_4) アルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_4) ハロアルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) アルキルチオ、 (C_1-C_4) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) アルキルスルホニル、シアノ、ニトロ、アルデヒド、 $-CH(=NOR^C)$ 又は1, 3-ジオキサラン-2-イルであり；

E は (C_1-C_8) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、 (C_1-C_8) ハロアルキル、 (C_1-C_4) ジアルキルアミノ、 $N-(C_1-C_4)$ アルコキシ- $N-(C_1-C_4)$ アルキルアミノ、 V^A で置換されてもよいフェニル、 V^A で置換されてもよいピリジル、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、ヘテロシクロア

ルキル (C_1-C_4) アルキル、(C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルキル、(C_1-C_4) アルキルチオ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_1-C_4) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_2-C_4) アルケニル、(C_1-C_7) アルコキシ、(C_2-C_7) アルケニルオキシ、(C_2-C_7) アルキニルオキシ、(C_3-C_6) シクロアルキルオキシ、(C_1-C_7) ハロアルコキシ、(C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルコキシ、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ、 V^A で置換されてもよいナフチルオキシ、 V^B で置換されてもよいフェニル (C_1-C_3) アルコキシ、(C_1-C_7) アルキルチオ又は2-イミダゾリジノンであり、当該Eにおけるヘテロシクロアルキル及びヘテロシクロアルキル部分は各々炭素原子以外に酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1種以上の原子を1つ以上含む3員～6員の基である(3)又は(4)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(6) Qが Q^1 又は Q^3 で表される(1)～(5)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(7) XがCH又は $C(R^A)$ で表される(1)～(6)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(8) Xが $C(R^A)$ で表される(1)～(6)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(9) XがCHで表される(1)～(6)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(10) XがNで表される(1)～(6)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(11) Xが $C(R^A)$ 又はNで表される(1)～(6)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(12) XがCHの場合はnが1～3の整数であり、Xが $C(R^A)$ 又はNの場合はnが1又は2である(1)～(6)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(13) a、b、c及びdが各々1又は2である(1)～(12)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(14) 前記式(i)で表されるピリダジノン系化合物又はその塩。

(15) 前記式(i-c)、式(i-d)又は式(i-g)で表される(14)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(16) aが1又は2である(14)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(17) 前記式(i i)で表されるピリダジノン系化合物又はその塩。

(18) bが1又は2である(17)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(19) 前記式(i i i)で表されるピリダジノン系化合物又はその塩。

(20) 前記式(i i i-c)で表される(19)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(21) cが1又は2である(19)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(22) 前記式(i v)で表されるピリダジノン系化合物又はその塩。

(23) dが1又は2である(22)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(24) Y及びR^Aは各々ハロゲン、(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₁-C₄)ハロアルキル又は(C₁-C₄)ハロアルコキシである(1)～(23)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(25) R¹、R²、R³及びR⁴は各々ハロゲン、(C₁-C₄)アルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)アルキルチオ又は(C₁-C₄)アルキルスルフィニルである(1)～(24)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(26) R¹、R²、R³及びR⁴は各々ハロゲン、(C₁-C₄)アルキル又

は (C_1-C_4) ハロアルキルである (1) ~ (24) のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(27) Gは R^D で置換されてもよい (C_1-C_4) アルキル、 $-C(=O)$ E又はアルキルスルホニルであり；

R^D は (C_1-C_4) アルコキシ、シアノ、 (C_1-C_4) アルコキシカルボニル又は (C_1-C_4) アルコキシカルボニルオキシであり；

Eは (C_1-C_8) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、 (C_1-C_8) ハロアルキル、 (C_1-C_4) ジアルキルアミノ、 $N-(C_1-C_4)$ アルコキシ- $N-(C_1-C_4)$ アルキルアミノ、 V^A で置換されてもよいフェニル、 V^A で置換されてもよいピリジル、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、ヘテロシクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルチオ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_1-C_4) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_2-C_4) アルケニル、 (C_1-C_7) アルコキシ、 (C_2-C_7) アルケニルオキシ、 (C_2-C_7) アルキニルオキシ、 (C_3-C_6) シクロアルキルオキシ、 (C_1-C_7) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルコキシ、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ、 V^A で置換されてもよいナフチルオキシ、 V^B で置換されてもよいフェニル (C_1-C_3) アルコキシ、 (C_1-C_7) アルキルチオ又は2-イミダゾリジノンである (1) ~ (26) のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(28) Gは $-C(=O)$ Eであり；

Eは (C_1-C_8) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、 (C_1-C_8) ハロアルキル、 (C_1-C_4) ジアルキルアミノ、 $N-(C_1-C_4)$ アルコキシ- $N-(C_1-C_4)$ アルキルアミノ、 V^A で置換されてもよいフェニル、 V^A で置換されてもよいピリジル、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、ヘテロシクロア

ルキル (C_1-C_4) アルキル、(C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルキル、(C_1-C_4) アルキルチオ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_1-C_4) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_2-C_4) アルケニル、(C_1-C_7) アルコキシ、(C_2-C_7) アルケニルオキシ、(C_2-C_7) アルキニルオキシ、(C_3-C_6) シクロアルキルオキシ、(C_1-C_7) ハロアルコキシ、(C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルコキシ、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ、 V^A で置換されてもよいナフチルオキシ、 V^B で置換されてもよいフェニル (C_1-C_3) アルコキシ、(C_1-C_7) アルキルチオ又は2-イミダゾリジノンであり、当該Eにおけるヘテロシクロアルキル及びヘテロシクロアルキル部分は各々炭素原子以外に酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1種以上の原子を1つ以上含む3員～6員の基である(1)～(26)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(29) Gは $-C(=O)-E$ であり；

Eは(C_1-C_8) アルキル、(C_2-C_8) アルケニル、(C_3-C_6) シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、(C_1-C_8) ハロアルキル、(C_1-C_4) ジアルキルアミノ、 $N-(C_1-C_4)$ アルコキシ- $N-(C_1-C_4)$ アルキルアミノ、 V^A で置換されてもよいフェニル、 V^A で置換されてもよいピリジル、(C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_1-C_4) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_2-C_4) アルケニル、(C_1-C_7) アルコキシ、(C_2-C_7) アルケニルオキシ、(C_3-C_6) シクロアルキルオキシ、(C_1-C_7) ハロアルコキシ、(C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルコキシ、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ又は V^B で置換されてもよいフェニル (C_1-C_3) アルコキシであり、当該Eにおけるヘテロシクロアルキル及びヘテロシクロアルキル部分は各々炭素原子以外に酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1種以上の原子を1つ

以上含む3員～6員の基である(1)～(26)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(30) Gは $-C(=O)E$ であり；

Eは (C_1-C_7) アルコキシ、 (C_2-C_7) アルケニルオキシ、 (C_2-C_7) アルキニルオキシ、 (C_3-C_6) シクロアルキルオキシ、 (C_1-C_7) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルコキシ又は V^B で置換されてもよいフェニル (C_1-C_3) アルコキシである(1)～(26)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(31) Gは $-C(=O)E$ であり；

Eは (C_1-C_8) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、 (C_1-C_8) ハロアルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル、 V^A で置換されてもよいピリジル、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、ヘテロシクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルチオ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_1-C_4) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_2-C_4) アルケニル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ又は V^A で置換されてもよいナフチルオキシであり、当該Eにおけるヘテロシクロアルキル及びヘテロシクロアルキル部分は各々炭素原子以外に酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1種以上の原子を1つ以上含む3員～6員の基である(1)～(26)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(32) Gは $-C(=O)E$ であり；

Eは (C_1-C_8) アルキル、 (C_2-C_8) アルケニル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、 (C_1-C_8) ハロアルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、ヘテロシクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルチオ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル $(C_1$

—C₄) アルキル、V^Aで置換されてもよいフェニルオキシ (C₁—C₃) アルキル又はV^Aで置換されてもよいフェニル (C₂—C₄) アルケニルであり、当該Eにおけるヘテロシクロアルキル及びヘテロシクロアルキル部分は各々炭素原子以外に酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1種以上の原子を1つ以上含む3員～6員の基である(1)～(26)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(33) Gは—C(=O)Eであり；

Eは(C₁—C₈) アルキル、(C₂—C₈) アルケニル、(C₃—C₆) シクロアルキル、(C₁—C₈) ハロアルキル、(C₁—C₄) アルコキシ(C₁—C₃) アルキル、(C₁—C₇) アルコキシ、(C₂—C₇) アルケニルオキシ、(C₃—C₆) シクロアルキルオキシ、(C₁—C₇) ハロアルコキシ又は(C₁—C₄) アルコキシ(C₁—C₃) アルコキシである(1)～(26)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(34) Zは(C₁—C₅) アルキル、(C₃—C₆) シクロアルキル、(C₁—C₄) アルコキシ(C₁—C₄) アルキル又は(C₁—C₄) ハロアルキルである(1)～(33)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(35) Zは(C₁—C₅) アルキル又は(C₃—C₆) シクロアルキルである(1)～(33)に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(36) nが1又は2である(1)～(35)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(37) nが2である(1)～(35)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(38) ピリダジノン環に対しパラ位に結合したYを少なくとも有し、このYは、ハロゲン、(C₁—C₄) ハロアルキル、(C₁—C₄) ハロアルコキシ、(C₁—C₄) アルキルチオ、(C₁—C₄) アルキルスルフィニル、(C₁—C₄) アルキルスルホニル又はシアノである(1)～(37)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(39) ピリダジノン環に対しパラ位に結合したYを少なくとも有し、こ

のYは、ハロゲン、 (C_1-C_4) ハロアルキル又は (C_1-C_4) ハロアルコキシである(1)～(37)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(40) ピリダジノン環に対しパラ位に結合したYを少なくとも有し、このYは、ハロゲンである(1)～(37)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(41) ピリダジノン環に対しパラ位に結合したYを少なくとも有し、このYは、 (C_1-C_4) ハロアルキルである(1)～(37)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(42) ピリダジノン環に対しパラ位に結合したYを少なくとも有し、このYは、 (C_1-C_4) ハロアルコキシである(1)～(37)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(43) ピリダジノン環に対しオルト位にY及び／又は R^A として結合した少なくとも1つの置換基を有し、オルト位に結合した前記置換基は、ハロゲン、 (C_1-C_4) アルキル、 (C_2-C_4) アルケニル、 (C_2-C_4) アルキニル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ又は $-C(=O)R^B$ であり；

R^B は (C_1-C_4) アルキルである(1)～(42)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(44) ピリダジノン環に対しオルト位にY及び／又は R^A として結合した少なくとも1つの置換基を有し、オルト位に結合した前記置換基は、ハロゲン又は (C_1-C_4) アルキルである(1)～(42)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(45) Xが $C(R^A)$ 又はNであり、nが1又は2であり、少なくとも一つのYが、ピリダジノン環に対しパラ位に置換している(1)～(6)、(13)～(44)のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

(46) Xが $C(R^A)$ 又はNであり、nが2であり、これらの2つのYは

、ピリダジノン環に対しパラ位及びオルト位に置換している（１）～（６）、（１３）～（４４）のいずれか一つに記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

[0265] （４７） （１）～（４６）のいずれか一つに記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。

（４８） （１）～（４６）のいずれか一つに記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤。

（４９） （１）～（４６）のいずれか一つに記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤。

（５０） （１）～（４６）のいずれか一つに記載の化合物又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

実施例

[0266] 次に本発明の実施例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。まず、本発明化合物の合成例を記載する。

[0267] 合成例１ ２－〔３－クロロ－５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル〕－６－エチル－５－メトキシカルボニルオキシ－４－〔３－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル〕ピリダジン－３（２Ｈ）－オン（後記化合物No. １－１１１）の合成

（１）６－ブロモ－４，５－ジクロロピリダジン－３（２Ｈ）－オン（１９．０ｇ、７７．９ｍｍｏｌ）、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラン（１３．１ｇ、１５６ｍｍｏｌ）、ｐ－トルエンスルホン酸－水和物（１．４８ｇ、７．７９ｍｍｏｌ）及びテトラヒドロフラン（１３０ｍＬ）の混合物を加熱しながら８０℃で１６時間攪拌下に反応させた。反応後室温まで放冷し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した後、集めた有機抽出物を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル／ヘプタン）で精製し、６－ブロモ－４，５－ジクロロ－２－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－２－イル）ピリダジン－３（２Ｈ）－オ

ン 19.1 g (収率 75%) を得た。このものの¹H-NMR スペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR (CDCl₃, 500MHz): 5.95 (1H, dd), 4.07-4.15 (1H, m), 3.66-3.75 (1H, m), 1.97-2.25 (2H, m), 1.63-1.80 (4H, m)

[0268] (2) 6-ブロモ-4,5-ジクロロ-2-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)ピリダジン-3(2H)-オン (2.0 g、6.1 mmol)、エチルボロン酸 (0.54 g、7.3 mmol)、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウムジクロリドジクロロメタン付加物 (0.50 g、0.61 mmol)、炭酸セシウム (2.3 g、7.0 mmol) 及び 1,4-ジオキサン (18 mL) の混合物を窒素雰囲気下、還流しながら 16 時間攪拌下に反応させた。反応後に氷冷し、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した後、集めた有機抽出物を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン) で精製し、4,5-ジクロロ-6-エチル-2-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)ピリダジン-3(2H)-オン 1.1 g (収率 62%) を得た。このものの¹H-NMR スペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR (CDCl₃, 500MHz): 6.00 (1H, dd), 4.05-4.20 (1H, m), 3.70-3.83 (1H, m), 2.77-2.87 (2H, m), 2.17-2.34 (1H, m), 1.95-2.13 (2H, m), 1.60-1.80 (4H, m), 1.28 (3H, t)

[0269] (3) 4,5-ジクロロ-6-エチル-2-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)ピリダジン-3(2H)-オン (3.9 g、14 mmol) のエタノール (100 mL) 溶液に、室温で濃塩酸 (10 mL) を加えた。その後、混合物を加熱しながら 80℃ で 2 時間攪拌下に反応させた。反応後室温まで放冷した後、得られた混合物を濃縮した。得られた残渣にエタノールを加え減圧下で共沸脱水して、4,5-ジクロロ-6-エチルピリダジン-3(2H)-オン 2.3 g (収率 85%) を得た。このものの¹H-NMR スペクトラムデータは以下の通りである。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 500MHz): 10.47 (1H, brs), 2.80 (2H, q), 1.26 (3H, t)

[0270] (4) 4,5-ジクロロ-6-エチルピリダジン-3(2H)-オン (2.2 g、11 mmol) のN,N-ジメチルホルムアミド (20 mL) 溶液に0℃で水素化ナトリウム (約60%流動パラフィンに分散) (0.53 g、13 mmol) を少量ずつ加えた。0℃で30分間攪拌した後、3-クロロ-2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン (2.7 g、13 mmol) を加えた。その後、混合物を室温で4時間攪拌下に反応させた。反応後に水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した後、集めた有機抽出物を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン) で精製し、4,5-ジクロロ-2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-エチルピリダジン-3(2H)-オン 2.9 g (収率70%) を得た。このものの $^1\text{H-NMR}$ スペクトラムデータは以下の通りである。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 500MHz): 8.81 (1H, d), 8.18 (1H, d), 2.87 (2H, q), 1.27 (3H, t)

[0271] (5) 3-(トリフルオロメチル)ピラゾール (1.5 g、11 mmol) のN,N-ジメチルホルムアミド (21 mL) 溶液に0℃で水素化ナトリウム (約60%流動パラフィンに分散) (0.45 g、11 mmol) を少量ずつ加えた。0℃で30分間攪拌した後、4,5-ジクロロ-2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-エチルピリダジン-3(2H)-オン (2.0 g、5.4 mmol) を加えた。その後、混合物を60℃で2時間攪拌下に反応させた。反応後室温まで放冷し、得られた反応混合物に1N水酸化ナトリウム水溶液 (7 mL、7 mmol) を加えた後、60℃で1時間攪拌下に反応させた。反応後室温まで放冷した後、1N塩酸を加え溶液を酸性に調整した。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した後、集めた有機抽出物を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (

溶離液：酢酸エチル／ヘプタン）で精製し、2-〔3-クロロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-イル〕-6-エチル-5-ヒドロキシ-4-〔3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル〕ピリダジン-3（2H）-オン 1.4 g（収率 57%）を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR (CDCl₃, 300MHz): 12.98 (1H, s), 9.33 (1H, dd), 8.84 (1H, dd), 8.20 (1H, dd), 6.78 (1H, dd), 2.88 (2H, q), 1.31 (3H, t)

[0272] (6) 2-〔3-クロロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-イル〕-6-エチル-5-ヒドロキシ-4-〔3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル〕ピリダジン-3（2H）-オン（0.15 g、0.33 mmol）及びトリエチルアミン（0.23 mL、1.65 mmol）をテトラヒドロフラン（2 mL）に溶解させ、クロロギ酸メチル（94 mg、0.99 mmol）を加えた。その後、室温で3時間攪拌下に反応させた。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル／ヘプタン）で精製し、目的物 0.15 g（収率 91%）を得た。

[0273] 合成例 2 5-アセトキシ-2-〔2, 6-ジメチル-4-（トリフルオロメチル）フェニル〕-6-エチル-4-（4-フルオロ-1H-ピラゾール-1-イル）ピリダジン-3（2H）-オン（後記化合物 No. 1-58）の合成

(1) 水酸化ナトリウム（2.79 g、69.7 mmol）の水（20 mL）溶液に、4-フルオロ-1H-ピラゾール（2.00 g、23.3 mmol）、ブromo酢酸（4.84 g、34.9 mmol）を順に加えた。その後、混合物を加熱しながら 100℃ で 15 時間攪拌下に反応させた。反応後 0℃ まで冷却した後に、2 N 塩酸を加え溶液を酸性に調整した。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機

抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物の2-(4-フルオロ-1H-ピラゾール-1-イル)酢酸2.08 g (収率62%)を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 500MHz): 7.43 (1H, d), 7.37 (1H, d), 4.88 (2H, s)

[0274] (2) 2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)アニリン(2.49 g, 13.16 mmol)の濃塩酸(12 mL)溶液に、0℃で亜硝酸ナトリウム(1.10 g, 15.94 mmol)の水(12 mL)溶液を加え、同温度で1時間攪拌し、ジアゾニウム塩水溶液を調製した。別途、塩化スズ(II)二水和物(8.91 g, 15.5 mmol)を濃塩酸(28 mL)に溶解させたのち、前述のジアゾニウム塩水溶液を室温で滴下した。滴下後、室温で16時間攪拌下に反応させた。反応後にヘプタンを加えろ過し、得られた固体にエタノールを加え減圧下で共沸脱水して、粗生成物の[2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ヒドラジン塩酸塩2.84 g (収率90%)を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR (DMSO-d₆, 500 MHz): 9.77 (3H, br), 7.46 (2H, s), 6.96 (1H, br), 2.43 (6H, s)

[0275] (3) [2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]ヒドラジン塩酸塩(2.00 g, 8.31 mmol)及びトリエチルアミン(4.63 mL, 33.2 mmol)をジクロロメタン(21 mL)に溶解させ、0℃で(Boc)₂O(3.63 g, 16.62 mmol)を加えた。その後、室温で12時間攪拌下に反応させた。反応後、2,2,2-トリフルオロエタノール(0.83 g, 8.31 mmol)、4-ジメチルアミノピリジン(0.10 g, 0.83 mmol)を加えた。室温で1時間攪拌下に反応させた。反応後に混合物を濃縮し残渣を得た。得られた残渣に酢酸エチルと1N塩酸を加え、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮

して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル/ヘプタン）で精製し、2-〔2, 6-ジメチルー4-（トリフルオロメチル）フェニル〕ヒドラジン-1-ギ酸ターシャリーブチル 1.76 g（収率70%）を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 500MHz): 7.22 (2H, s), 6.34 (1H, br), 5.83 (1H, d), 2.40 (6H, s), 1.40 (9H, brs)

[0276] (4) 2-（4-フルオロ-1H-ピラゾール-1-イル）酢酸（0.11 g、0.79 mmol）及びN, N-ジメチルホルムアミド（10 mg、0.14 mmol）をジクロロメタン（3 mL）に溶解させ、塩化オキサリル（0.12 g、0.92 mmol）を加え、室温で2時間攪拌下に反応させた。反応後に減圧下で濃縮し酸塩化物を得た。別途、2-〔2, 6-ジメチルー4-（トリフルオロメチル）フェニル〕ヒドラジン-1-ギ酸ターシャリーブチル（0.20 g、0.66 mmol）のジクロロメタン（3 mL）溶液に、炭酸カリウム（0.18 g、1.31 mmol）を加えた。0℃で前述の酸塩化物のジクロロメタン（2 mL）溶液を滴下した。滴下後、室温で3時間攪拌下に反応させた。反応後に酢酸エチルと水を加え、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル/ヘプタン）で精製し、2-〔2, 6-ジメチルー4-（トリフルオロメチル）フェニル〕-2-〔2-（4-フルオロ-1H-ピラゾール-1-イル）アセチル〕ヒドラジン-1-ギ酸ターシャリーブチル 0.21 g（収率74%）を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz): 7.58 (1H, brs), 7.32-7.52 (7.48H, m), 6.78 (0.87H, brs), 5.11 (2H, brs), 4.53 (1.74H, s), 2.52 (5.22H, s), 2.38 (6H, brs), 1.39-1.55 (16.83H, m)

[0277] (5) 2-〔2, 6-ジメチルー4-（トリフルオロメチル）フェニル〕

－2－〔2－（4－フルオロ－1H－ピラゾール－1－イル）アセチル〕ヒドラジン－1－ギ酸ターシャリーブチル（0.21g、0.49mmol）のジクロロメタン（3mL）溶液に、トリフルオロ酢酸（0.50mL）を加え、室温で3時間攪拌下に反応させた。反応後に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、ろ液を濃縮した。得られた残渣にp－トルエンスルホン酸－水和物（10mg、0.08mmol）、メタノール（5mL）及び2－オキソ酪酸メチル（50mg、0.47mmol）を順に加え、70℃で2時間攪拌下に反応させた。反応後室温まで放冷した後、得られた混合物を濃縮した。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出、集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル/ヘプタン）で精製し、2－〔2－〔2，6－ジメチル－4－（トリフロロメチル）フェニル〕－2－〔2－（4－フルオロ－1H－ピラゾール－1－イル）アセチル〕ヒドラジニリデン〕酪酸メチル0.14g（収率83%）を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz) : 7.39–7.51 (3.28H, m), 7.35 (2H, s), 5.54 (0.64H, s), 5.52 (2H, s), 3.91 (0.96H, s), 3.11 (3H, s), 2.50 (2H, q), 2.21 (1.92H, s), 2.18 (6H, s), 1.90 (0.64H, q), 1.28 (0.96H, t), 1.22 (3H, t)

[0278] (6) 2－〔2－〔2，6－ジメチル－4－（トリフロロメチル）フェニル〕－2－〔2－（4－フルオロ－1H－ピラゾール－1－イル）アセチル〕ヒドラジニリデン〕酪酸メチル（0.14g、0.33mmol）のアセトニトリル（4mL）溶液に1，8－ジアザビシクロ〔5.4.0〕－7－ウンデセン（0.15mL、0.98mmol）を加え、70℃で2時間攪拌下に反応させた。反応後室温まで放冷した後に酢酸エチルと水を加えた

後に、1 N塩酸を加え溶液を酸性に調整し、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル/ヘプタン）で精製し、2- [2, 6-ジメチル-4-（トリフルオロメチル）フェニル]-6-エチル-4-（4-フルオロ-1H-ピラゾール-1-イル）-5-ヒドロキシピリダジン-3（2H）-オン0.11g（収率85%）を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR (CDCl₃, 500MHz): 13.55 (1H, s), 9.21 (1H, d), 7.66 (1H, d), 7.46 (2H, s), 2.84 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.27 (3H, t)

[0279] (7) 2- [2, 6-ジメチル-4-（トリフルオロメチル）フェニル]-6-エチル-4-（4-フルオロ-1H-ピラゾール-1-イル）-5-ヒドロキシピリダジン-3（2H）-オン（50mg、0.13mmol）及びトリエチルアミン（64mg、0.63mmol）をテトラヒドロフラン（4mL）に溶解させ、アセチルクロリド（30mg、0.38mmol）を加えた。その後、室温で3時間攪拌下に反応させた。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル/ヘプタン）で精製し、目的物45mg（収率81%）を得た。

[0280] 合成例3 2- [3-クロロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-イル]-6-エチル-5-メトキシカルボニルオキシ-4- [3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル] ピリダジン-3（2H）-オン（後記化合物No. 1-111）の別法

(1) 水酸化ナトリウム（2.12g、52.9mmol）の水（30mL）溶液に、3-（トリフルオロメチル）ピラゾール（3.00g、22.1mmol）、ブromo酢酸（3.22g、23.2mmol）を順に加えた。

その後、混合物を加熱しながら100℃で15時間攪拌下に反応させた。反応後0℃まで冷却した後に、2N塩酸を加え溶液を酸性に調整し、さらにヘプタンを加えた。析出した固体をろ過で回収し、粗生成物の2-[3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]酢酸3.41g(収率80%)を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 500MHz): 7.55 (1H, d), 6.62 (1H, d), 5.04 (2H, s)

[0281] (2) 3-クロロ-2-ヒドラジニル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(0.67g、3.15mmol)、2-オキソ酪酸メチル(0.44g、3.78mmol)及びエタノール(10mL)の混合物を加熱しながら60℃で15時間攪拌下に反応させた。反応後に混合物を濃縮し残渣を得た。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出、集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン)で精製し、2-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]ヒドラジニリデン}酪酸メチル0.79g(収率81%)を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 500MHz): 8.54 (1H, s), 7.82 (1H, s), 3.91 (3H, s), 2.69 (2H, q), 1.20 (3H, t)

[0282] (3) 2-[3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]酢酸(308mg、1.59mmol)、N,N-ジメチルホルムアミド(5mg、0.070mmol)及びジクロロメタン(8mL)の混合物を氷浴中で数分攪拌した後、塩化オキサリル(0.15mL、1.74mmol)をゆっくりと滴下した。滴下終了後、3時間室温で攪拌した後に、減圧下で濃縮し酸塩化物を得た。別途、窒素雰囲気下、2-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]ヒドラジニリデン}酪酸メチル(420mg、1.36mmol)のテトラヒドロフラン(8mL)溶液に、氷浴中でリチウムヘキサメチルジシラジドのテトラヒドロフラン溶液(1.

0.4 mL、1.3 mmol、1.36 mmol)を加えた。氷浴中で1時間攪拌した後、前述の酸塩化物を加えた。その後、室温で18時間攪拌下に反応させた。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出、集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル／ヘプタン）で精製し、2-〔3-クロロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-イル〕-6-エチル-5-ヒドロキシ-4-〔3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル〕ピリダジン-3（2H）-オン0.12 g（収率20%）を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz): 12.98 (1H, s), 9.33 (1H, dd), 8.84 (1H, dd), 8.19 (1H, dd), 6.78 (1H, dd), 2.88 (2H, q), 1.31 (3H, t)

[0283] (4) 合成例1の(6)の記載に準じて、2-〔3-クロロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-イル〕-6-エチル-5-ヒドロキシ-4-〔3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル〕ピリダジン-3（2H）-オンから、目的物である2-〔3-クロロ-5-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-イル〕-6-エチル-5-メトキシカルボニルオキシ-4-〔3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル〕ピリダジン-3（2H）-オンを合成した。

[0284] 合成例4 2-〔2, 6-ジメチル-4-（トリフルオロメチル）フェニル〕-5-イソブチリルオキシ-4-（3-メチル-1H-ピラゾール-1-イル）-6-（トリフルオロメチル）ピリダジン-3（2H）-オン（後記化合物No. 1-182）の合成

(1) 合成例2の(1)から(6)の記載に準じて調製した4-（3-ブromo-1H-ピラゾール-1-イル）-2-〔2, 6-ジメチル-4-（トリフルオロメチル）フェニル〕-5-ヒドロキシ-6-（トリフルオロメチル）ピリダジン-3（2H）-オン（81 mg、0.16 mmol）、トリメチルボロキシシン（0.11 mL、0.81 mmol）、〔1, 1'-ビス

(ジフェニルホスフィノ) フェロセン] パラジウムジクロリドジクロロメタン付加物 (13 mg、0.020 mmol) 及び炭酸カリウム (68 mg、0.49 mmol) を、水 (2 mL) 及び 1,4-ジオキサン (4 mL) に溶解させた。その混合物をマイクロウェーブ合成装置で加熱しながら 140 °C で 6 時間攪拌下に反応させた。反応後室温まで放冷した。水と 1 N 塩酸を加えた後に酢酸エチルを加え、セライトろ過を行った。得られたろ液の混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン) で精製し、2-[2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-ヒドロキシ-4-(3-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3(2H)-オン 46 mg (収率 65%) を得た。このものの $^1\text{H-NMR}$ スペクトラムデータは以下の通りである。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz): 8.93 (1H, d), 7.32 (2H, s), 6.18 (1H, d), 2.28 (3H, s), 2.01 (6H, s)

[0285] (2) 2-[2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-ヒドロキシ-4-(3-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3(2H)-オン (25 mg、0.060 mmol) 及びトリエチルアミン (8.8 mg、0.090 mmol) をテトラヒドロフラン (1 mL) に溶解させ、イソブチリルクロリド (8.6 mg、0.080 mmol) を加えた。その後、室温で 12 時間攪拌下に反応させた。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン) で精製し、目的物 10 mg (収率 34%) を得た。

[0286] 合成例 5 4-[5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-

エチル-4-イソブチリルオキシ-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル]-3,5-ジメチルベンゾニトリル(後記化合物No. 1-110)の合成

(1) 合成例2の(1)から(6)の記載に準じて調製した4-[5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-エチル-4-ヒドロキシ-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル]-3,5-ジメチル安息香酸メチル(0.15g、0.37mmol)、水素化アルミニウムリチウム(42mg、1.10mmol)及びテトラヒドロフラン(5mL)の混合物を0℃で3時間攪拌下に反応させた。反応後に0℃で2N塩酸を加えた。セライトろ過を行った後に、ろ液を酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、シリカゲルを充填した漏斗でろ過し、濃縮して粗生成物の4-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-エチル-5-ヒドロキシ-2-[4-(ヒドロキシメチル)-2,6-ジメチルフェニル]ピリダジン-3(2H)-オン93mgを得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz): 13.34 (1H, brs), 9.36 (1H, s), 7.72 (1H, s), 7.22 (2H, s), 4.71 (2H, s), 2.86 (2H, q), 2.12 (6H, s), 1.29 (3H, t)

[0287] (2) 4-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-6-エチル-5-ヒドロキシ-2-[4-(ヒドロキシメチル)-2,6-ジメチルフェニル]ピリダジン-3(2H)-オン(93mg、0.25mmol)のジクロロメタン(5mL)溶液に、活性化二酸化マンガン(0.65g、7.44mmol)を加えて、室温で15時間攪拌下に反応させた。セライトろ過を行った後に、得られたろ液を濃縮して粗生成物の4-[5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-エチル-4-ヒドロキシ-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル]-3,5-ジメチルベンズアルデヒド82mgを得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz): 13.45 (1H, brs), 10.04 (1H, s), 9.32 (1H, s),

7.74–7.75 (3H, m), 2.88 (2H, q), 2.20 (6H, s), 1.29 (3H, t)

[0288] (3) 4 – [5 – (4 – クロロ – 1 H – ピラゾール – 1 – イル) – 3 – エチル – 4 – ヒドロキシ – 6 – オキソピリダジン – 1 (6 H) – イル] – 3, 5 – ジメチルベンズアルデヒド (82 mg、0.22 mmol) 及び酢酸ナトリウム (18 mg、0.22 mmol) をエタノール (3 mL) に溶解させ、ヒドロキシルアミン (50%水溶液) (73 mg、1.10 mmol) を加えた。その後、室温で15時間攪拌下に反応させた。反応後に2 N塩酸 (5 mL) を加えた。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物の (E) – 4 – [5 – (4 – クロロ – 1 H – ピラゾール – 1 – イル) – 3 – エチル – 4 – ヒドロキシ – 6 – オキソピリダジン – 1 (6 H) – イル] – 3, 5 – ジメチルベンズアルドキシム 86 mg を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz) : 13.45 (1H, brs), 9.35 (1H, s), 8.13 (1H, s), 7.73 (1H, s), 7.43 (2H, s), 2.86 (2H, q), 2.13 (6H, s), 1.30 (3H, t)

[0289] (4) (E) – 4 – [5 – (4 – クロロ – 1 H – ピラゾール – 1 – イル) – 3 – エチル – 4 – ヒドロキシ – 6 – オキソピリダジン – 1 (6 H) – イル] – 3, 5 – ジメチルベンズアルドキシム (86 mg、0.22 mmol) と無水酢酸 (5 mL) の混合物を加熱しながら140℃で13時間攪拌下に反応させた。攪拌後に濃縮し混合物を得た。この混合物のテトラヒドロフラン (2 mL) 溶液に2 N水酸化ナトリウム水溶液 (7 mL) を加えた後、室温で2時間攪拌下に反応させた。2 N塩酸を加え酸性に調整し、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して目的物を含む混合物が得られた。その混合物のテトラヒドロフラン (2 mL) 溶液に2 N水酸化ナトリウム水溶液 (2 mL) を加えた後、室温で1時間攪拌下に反応させた。2 N塩酸を加え酸性に調整し、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた

有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して4-[5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-エチル-4-ヒドロキシ-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル]-3,5-ジメチルベンゾニトリル43mg(収率52%)を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz): 13.47 (1H, brs), 9.30 (1H, s), 7.74 (1H, s), 7.52 (2H, s), 2.86 (2H, q), 2.15 (6H, s), 1.28 (3H, t)

[0290] (5) 4-[5-(4-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-3-エチル-4-ヒドロキシ-6-オキソピリダジン-1(6H)-イル]-3,5-ジメチルベンゾニトリル(20mg、0.050mmol)及びジイソプロピルエチルアミン(10mg、0.080mmol)をテトラヒドロフラン(2mL)に溶解させ、イソブチリルクロリド(7mg、0.060mmol)を加えた。その後、室温で3時間攪拌下に反応させた。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン)で精製し、目的物19mg(収率80%)を得た。

[0291] 合成例6 4-(3-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-2-[2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-イソブチルオキシ-6-(メトキシメチル)ピリダジン-3(2H)-オン(後記化合物No. 1-230)の合成

(1) 合成例2の(1)から(6)の記載に準じて調製した5-(3-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-1-[2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-4-ヒドロキシ-6-オキソ-1,6-ジヒドロピリダジン-3-カルボン酸エチル(0.40g、0.88mmol)、水素化アルミニウムリチウム(0.10g、2.63mmol)及びテトラヒドロフラン(18mL)の混合物を0℃で3時間攪拌下に反応させた

。反応後に酢酸エチルと水を加え、得られた混合物を水酸化ナトリウム水溶液で抽出した。集めた水層に2 N塩酸を加え酸性に調整し、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物の4-(3-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-2-[2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-ヒドロキシ-6-(ヒドロキシメチル)ピリダジンを3(2H)-オン0.35 gを得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz): 13.06 (1H, brs), 9.23 (1H, d), 7.49 (2H, s), 6.48 (1H, d), 4.85 (2H, s), 2.18 (6H, s)

[0292] (2) 4-(3-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-2-[2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-ヒドロキシ-6-(ヒドロキシメチル)ピリダジンを3(2H)-オン(0.27 g、0.66 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(4 mL)溶液に0℃で水素化ナトリウム(約60%流動パラフィンに分散)(0.10 g、2.62 mmol)、ヨウ化メチル(0.37 g、2.62 mmol)を加えた。その後、混合物を室温で15時間攪拌下に反応させた。得られた反応混合物に2 N水酸化ナトリウム水溶液を加えた後、室温で1時間攪拌下に反応させた。酢酸エチルで希釈後、0.5 N塩酸を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン)で精製し、4-(3-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-2-[2,6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-ヒドロキシ-6-(メトキシメチル)ピリダジンを3(2H)-オン87 mg(収率31%)を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz): 13.01 (1H, brs), 9.22 (1H, d), 7.48 (2H, s), 6.47 (1H, d), 4.61 (2H, s), 3.49 (3H, s), 2.18 (6H, s)

[0293] (3) 4-(3-クロロ-1H-ピラゾール-1-イル)-2-[2, 6-ジメチル-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-ヒドロキシ-6-(メトキシメチル)ピリダジン-3(2H)-オン(50 mg、0.12 mmol)及びトリエチルアミン(15 mg、0.15 mmol)をテトラヒドロフラン(2.5 mL)に溶解させ、イソブチリルクロリド(15 mg、0.14 mmol)を加えた。その後、室温で12時間攪拌下に反応させた。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン)で精製し、目的物49 mg(収率84%)を得た。

[0294] 合成例7 2-[2, 6-ジクロロ-4-(メチルスルホニル)フェニル]-5-イソブチリルオキシ-6-イソプロピル-4-[3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]ピリダジン-3(2H)-オン(後記化合物No. 1-410)の合成

(1) 2, 6-ジクロロアニリン(3.00 g、18.5 mmol)をジクロロメタン(30 mL)に溶解させ、ペルオキソ二硫酸カリウム(10.0 g、37.0 mmol)、チオシアン酸アンモニウム(2.11 g、27.8 mmol)及び水(0.33 mL)を加えた。その後、室温で15時間攪拌下に反応させた。セライトとシリカゲルを充填した漏斗でろ過を行った後に、得られたろ液を濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶離液: 酢酸エチル/ヘプタン)で精製し、2, 6-ジクロロ-4-チオシアナトアニリン3.91 g(収率96%)を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz): 7.45 (2H, s), 4.79 (2H, brs)

[0295] (2) 2, 6-ジクロロ-4-チオシアナトアニリン(4.03 g、18.4 mmol)をメタノール(40 mL)に溶解させ、ナトリウムメトキシド(2.98 g、55.2 mmol)を加えた。その後、室温で16時間攪拌

下に反応させた。反応後に混合物を濃縮し残渣を得た。酢酸エチルで希釈後、水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出し、集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル／ヘプタン）で精製し、2, 6-ジクロロ-4-(メチルチオ)アニリン 1.75 g（収率 46%）を得た。このものの¹H-NMRスペクトラムデータは以下の通りである。

¹H-NMR(CDCl₃, 300MHz): 7.26 (2H, s), 4.42 (2H, brs), 2.42 (3H, s)

[0296] (3) 合成例 2 の (2)、合成例 3 の (2) から (3) 及び合成例 4 の (2) の記載に準じて、2, 6-ジクロロ-4-(メチルチオ)アニリンから、2-[2, 6-ジクロロ-4-(メチルチオ)フェニル]-5-イソブチリルオキシ-6-イソプロピル-4-[3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]ピリダジン-3(2H)-オン（後記化合物 No. 1-408）を合成した。

[0297] (4) 2-[2, 6-ジクロロ-4-(メチルチオ)フェニル]-5-イソブチリルオキシ-6-イソプロピル-4-[3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]ピリダジン-3(2H)-オン（0.10 g、0.18 mmol）を酢酸エチル（4 mL）に溶解させ、70%メタクロロ過安息香酸（含水晶）（0.11 g、0.46 mmol）を加えた。その後、室温で 14 時間攪拌下に反応させた。酢酸エチルで希釈後、1 N 水酸化ナトリウム水溶液と水を加えた。得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。集めた有機抽出物を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：酢酸エチル／n-ヘプタン）で精製し、目的物 81 mg（収率 77%）を得た。

[0298] 次に、式 (1) の化合物の代表例を第 1 表から第 2 表に挙げる。これらの化合物は、前記合成例或いは前記した種々の製造方法に基づいて合成することができる。

第1表における一般式(1-1)は、式(1)の化合物においてQがQ¹である化合物群と、QがQ³である化合物群とを包含する一般式である。第1表において、一般式(1-1)のW^AがNである場合はQがQ³である化合物群に相当し、それ以外の場合はQがQ¹である化合物群に相当する。

また、第2表における一般式(1-2)は、式(1)の化合物においてQがQ²である化合物群と、QがQ⁴である化合物群とを包含する一般式である。第2表において、一般式(1-2)のW^CがNである場合はQがQ²である化合物群に相当し、それ以外の場合はQがQ⁴である化合物群に相当する。

また、式(1)の化合物の代表例の物性値を第3表及び第4表に示す。第3表には、式(1)の化合物の代表例の¹H-NMRスペクトラムデータを示す。第3表中の¹H-NMRスペクトラムデータのsはシングレット(一重線)、b r sはブロードしたシングレット、dはダブルット(二重線)、tはトリプレット(三重線)、qはカルテット(四重線)、q u i nはクインテット(五重線)、s e x tはセクテット(六重線)、s e pはセプテット(七重線)、mはマルチプレット(多重線)、b rはブロード(幅広線)である。第4表には、式(1)の化合物の代表例の融点を示す。

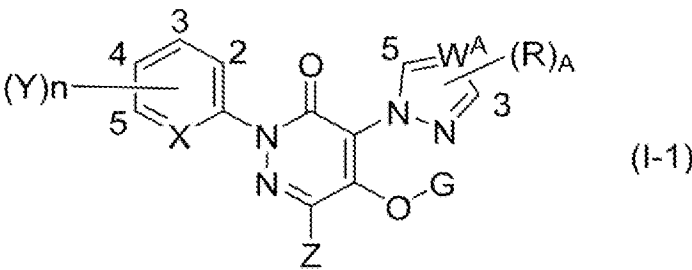
各表中、N o. は化合物番号を示す。また、第1表から第2表で用いた略語は以下の置換基、M eはメチル基、E tはエチル基、n P rはノルマルプロピル基、i P rはイソプロピル基、n B uはノルマルブチル基、s B uはセカンダリーブチル基、t B uはターシャリーブチル基、c P rはシクロプロピル基、c B uはシクロブチル基、c P e nはシクロペンチル基、c H e xはシクロヘキシル基、D X A Nは1, 3-ジオキサノ-2-イル基、D X O Lは1, 3-ジオキサラン-2-イル基を各々示す。表中、例えば「O M e」はメトキシ基を、「S M e」はメチルチオ基を、「O c P r」はシクロプロピルオキシ基を、各々示している。

また、第1表中、(R)_Aの欄において、例えば「3-CF₃」と記載された化合物は、表中の化学構造式に付与したピラゾール環の「3」の置換位置がCF₃で置換されていること、即ち、ピラゾール環の3位が1つのRによって

置換されている「 $A = 1$ 」の化合物であることを表す。また、第1表中、 $(R)_A$ の欄において、「 $A = 0$ 」と記載された化合物は、 R が置換していないことを表し、 $(Y)_n$ の欄において、「 $n = 0$ 」と記載された化合物は、 Y が置換していないことを表す。また、 Z 及び G の欄において、 $*$ は結合位置を示す。第1表から第2表における他の同様の記載もこれに準じる。

[0299]

[表1]

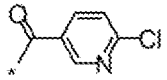
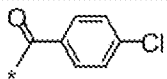
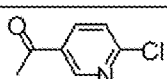


第1表

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-1	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CONPr
1-2	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	COCH ₂ iPr
1-3	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO(CH ₂) ₄ CH ₃
1-4	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	COCH ₂ tBu
1-5	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	COiPr
1-6	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	COsBu
1-7	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	COtBu
1-8	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	COcPr
1-9	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ Et
1-10	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ iPr
1-11	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ Me
1-12	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ nPr
1-13	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ iPr
1-14	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ tBu
1-15	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-16	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ Cl
1-17	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH(Me)Cl
1-18	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe
1-19	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	CONPr
1-20	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	CONBu
1-21	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	COEt
1-22	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	COCH ₂ iPr
1-23	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	COMe
1-24	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	COiPr
1-25	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	COsBu
1-26	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	COtBu
1-27	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	COcPr
1-28	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	COcBu
1-29	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	COcPen
1-30	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	

[表2]

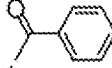
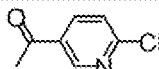
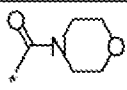
第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-31	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	
1-32	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	CO ₂ Et
1-33	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	CO ₂ nPr
1-34	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-35	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	CONPr
1-36	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	CONBu
1-37	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	COEt
1-38	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	COCH ₂ iPr
1-39	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	COMe
1-40	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	COiPr
1-41	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	COsBu
1-42	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	COtBu
1-43	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	COcPr
1-44	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	
1-45	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	
1-46	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	CO ₂ Et
1-47	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	CO ₂ nPr
1-48	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-49	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CONPr
1-50	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CONBu
1-51	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COEt
1-52	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COCH ₂ iPr
1-53	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COCH ₂ tBu
1-54	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CO(CH ₂) ₄ CH ₃
1-55	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CO(CH ₂) ₅ CH ₃
1-56	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CO(CH ₂) ₆ CH ₃
1-57	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CO(CH ₂) ₇ CH ₃
1-58	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COMe
1-59	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COiPr
1-60	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COsBu

[0301]

[表3]

第1表 (続き)

No.	(Y) _o	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-61	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COtBu
1-62	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COC(Me) ₂ CH ₂ CH ₃
1-63	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COcPr
1-64	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COcBu
1-65	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COcPen
1-66	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	COcHex
1-67	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	
1-68	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ CH(Me)Cl
1-69	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	
1-70	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	
1-71	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CO ₂ Et
1-72	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CO ₂ nPr
1-73	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-74	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CO ₂ CH ₂ C≡CH
1-75	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CON(Me)Me
1-76	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CON(Et)Et
1-77	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	COEt
1-78	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	CO _n Pr
1-79	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	COCH ₂ iPr
1-80	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	COCH ₂ tBu
1-81	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	COMe
1-82	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	COiPr
1-83	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	COtBu
1-84	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	CO ₂ Me
1-85	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	CO ₂ Et
1-86	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	CO ₂ iPr
1-87	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	CO ₂ tBu
1-88	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	CO ₂ CH ₂ iPr
1-89	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	
1-90	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	N	Et	COiPr

[0302]

[表4]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-91	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	cPr	COiPr
1-92	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO ₂ Et
1-93	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	tBu	COiPr
1-94	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	tBu	CO ₂ Et
1-95	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	tBu	COiPr
1-96	2-Me, 4-CF ₃	C-Cl	3-CF ₃	C-H	Et	COMe
1-97	2-Me, 4-CF ₃	C-Cl	3-CF ₃	C-H	Et	COEt
1-98	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COiPr
1-99	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ Et
1-100	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	COiPr
1-101	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ Et
1-102	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N		COiPr
1-103	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N		CO ₂ Et
1-104	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	CF ₃	COiPr
1-105	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	CF ₃	CO ₂ Et
1-106	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	CF ₃	COiPr
1-107	2-Me, 4-OCF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	COiPr
1-108	2-Me, 4-OCF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	CO _n Pr
1-109	2-Me, 4-CF ₂ H	C-Me	3-Cl	C-H	Et	COiPr
1-110	2-Me, 4-CN	C-Me	A=0	C-Cl	Et	COiPr
1-111	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-CF ₃	C-H	Et	CO ₂ Me
1-112	2-Br, 4-CF ₃	N	3-CF ₃	C-Cl	Et	COiPr
1-113	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-Cl	C-NO ₂	Et	COEt
1-114	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-Cl	C-NO ₂	Et	COcPr
1-115	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-Cl	C-NO ₂	Et	COiPr
1-116	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-Cl	C-NO ₂	Et	COCH ₂ iPr
1-117	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-Cl	C-NO ₂	Et	COtBu
1-118	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-Cl	C-NO ₂	Et	COsBu
1-119	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-Cl	C-NO ₂	Et	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-120	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-Cl	C-NO ₂	Et	CO ₂ nPr

[0303]

[表5]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-121	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-CF ₃	C-Me	Et	COiPr
1-122	2-Cl, 4-CF ₃	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	CO ₂ Et
1-123	2-Br, 4-Cl	C-H	3-CF ₃	C-Cl	Et	CO ₂ Et
1-124	2-Et, 4-CF ₃	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-125	2-OMe, 4-CF ₃	C-H	3-CF ₃	C-Cl	Et	CO ₂ Et
1-126	2-Cl, 4-OCF ₃	C-H	3-CF ₃	C-Cl	Et	CO ₂ Et
1-127	2-Me, 4-OCF ₃	C-H	3-CF ₃	C-Cl	Et	COiPr
1-128	2-Me, 4-SO ₂ Me	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-129	2-Me, 4-CF ₃	C-H	3-Cl	N	Me	COiPr
1-130	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-DXOL	C-Br	Et	COiPr
1-131	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-F	Et	COiPr
1-132	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-F	Et	CO ₂ Et
1-133	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	CH(Me)OCO ₂ Me
1-134	2-Me, 4-CF ₃	C-Cl	3-CF ₃	C-H	Et	CH(Me)OCO ₂ Me
1-135	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CH(Me)OCO ₂ Me
1-136	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	CH(Me)OCO ₂ Me
1-137	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	CH(Me)OCO ₂ Me
1-138	2-Me, 4-OCF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	CH(Me)OCO ₂ Me
1-139	2-Me, 4-CH ₂ CF ₃	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	CH(Me)OCO ₂ Me
1-140	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CH(Me)OCO ₂ Et
1-141	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	CH(Me)OCO ₂ iPr
1-142	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-Cl	C-NO ₂	Et	CH(Me)OCO ₂ Me
1-143	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	SO ₂ Me
1-144	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	SO ₂ Et
1-145	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Et	SO ₂ nPr
1-146	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	SO ₂ Me
1-147	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	SO ₂ Me
1-148	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Et	CH ₂ CO ₂ Me
1-149	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₃	N	Et	CO ₂ Et
1-150	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Et	COiPr

[0304]

[表6]

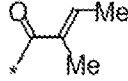
第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-151	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ Et
1-152	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-OCH ₂ CF ₃	N	iPr	COiPr
1-153	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	N	iPr	COiPr
1-154	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	N	iPr	CO ₂ Et
1-155	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	iPr	COiPr
1-156	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	N	Et	COiPr
1-157	2-Me, 4-OCF ₃	C-Me	3-F	N	Et	COiPr
1-158	2-F, 4-CF ₃	C-F	3-Cl	N	Et	CO ₂ Et
1-159	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	Et	CO ₂ Et
1-160	2-Me, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-Cl	Me	COiPr
1-161	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	CO ₂ Et
1-162	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	COiPr
1-163	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	tBu	CO ₂ CH(Me)Cl
1-164	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-CF ₃	Me	COiPr
1-165	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Me	C-Cl	Et	COiPr
1-166	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	C-Me	Et	CO ₂ Et
1-167	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-H	Et	CO ₂ Et
1-168	2-Me, 4-OCF ₃	C-Me	3-Me	C-Cl	Et	COiPr
1-169	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Et	CO ₂ CH(Me)Cl
1-170	2-Me, 4-CF ₃	C-H	3-Br	C-CF ₃	Et	COiPr
1-171	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-cPr	C-Cl	Et	COiPr
1-172	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-Me	Et	COiPr
1-173	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₃	C-Me	Et	COiPr
1-174	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₃	C-Me	iPr	COiPr
1-175	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-I	cPr	COiPr
1-176	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-I	C-H	Et	CO ₂ Et
1-177	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	C-H	Et	COiPr
1-178	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-OMe	C-H	Et	COiPr
1-179	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-SMe	C-H	Et	COiPr
1-180	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-OCH ₂ CF ₃	C-H	Et	COiPr

[0305]

[表7]

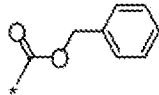
第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-181	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-SOMe	C-H	Et	COiPr
1-182	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	CF ₃	COiPr
1-183	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	cPr	CO ₂ Et
1-184	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₃ H	C-H	Et	COiPr
1-185	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₃ H	C-H	Et	CO ₂ Et
1-186	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COMe
1-187	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COEt
1-188	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CONPr
1-189	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CONBu
1-190	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COCH ₂ iPr
1-191	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COsBu
1-192	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COCH ₂ OMe
1-193	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-194	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COcPr
1-195	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COcBu
1-196	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COcPen
1-197	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COcHex
1-198	2-Me, 4-CH ₂ CF ₃	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	CONPr
1-199	2-Cl, 5-Cl	C-H	3-CF ₃	C-Cl	Et	COiPr
1-200	2-Cl, 3-Cl	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-201	3-Cl, 5-Cl	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-202	3-Cl, 4-Cl	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-203	2-Cl, 5-CF ₃	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-204	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-CF ₃	C-H	Me	Me
1-205	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-CF ₃	C-H	Et	Me
1-206	2-Br, 4-CF ₃	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	Me
1-207	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=O	C-F	Et	Me
1-208	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	tBu	Et
1-209	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-CF ₃	C-H	Et	CH ₂ OMe
1-210	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	SO ₂ Me

[0306]

[表8]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-211	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CH ₂ CN
1-212	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ Me
1-213	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ nPr
1-214	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ nBu
1-215	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ iPr
1-216	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-217	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ CH ₂ iPr
1-218	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ CH ₂ tBu
1-219	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-220	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe
1-221	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ CH ₂ Cl
1-222	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
1-223	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ CH(Me)Cl
1-224	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-CN	C-I	Et	COiPr
1-225	2-Cl, 4-CF ₃	N	A=0	C-SO ₂ Me	Et	COiPr

[0307]

[表9]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-226	2-Me, 4- -CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	iPr	CO ₂ CH(Me)Cl
1-227	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-DXAN	C-Br	Et	COiPr
1-228	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-CHO	C-H	Et	COiPr
1-229	2-Cl, 4-CF ₃	N	3-CH=NOMe	C-H	Et	COiPr
1-230	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	CH ₂ OMe	COiPr
1-231	2-Me, 4-CF ₃	C-CH=CH ₂	3-Cl	C-H	Et	COiPr
1-232	2-Cl, 5-CF ₃	N	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-233	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	N	Me	COiPr
1-234	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	Me	COiPr
1-235	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	N	Me	COiPr
1-236	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	N	iPr	COiPr
1-237	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-F	N	Me	COiPr
1-238	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-F	N	iPr	COiPr
1-239	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Br	N	Me	COiPr
1-240	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Br	N	iPr	COiPr

[0308]

[表10]

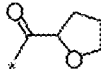
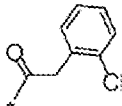
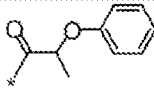
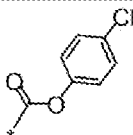
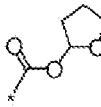
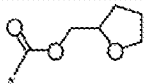
第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-241	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	N	Me	CO ₂ Et
1-242	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	Me	CO ₂ Et
1-243	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	iPr	CO ₂ Et
1-244	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	N	Me	CO ₂ Et
1-245	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	N	iPr	CO ₂ Et
1-246	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-F	N	Me	CO ₂ Et
1-247	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-F	N	iPr	CO ₂ Et
1-248	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Br	N	Me	CO ₂ Et
1-249	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Br	N	iPr	CO ₂ Et
1-250	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	COiPr
1-251	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	iPr	COiPr
1-252	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Me	COiPr
1-253	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	iPr	COiPr
1-254	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-Cl	Me	COiPr
1-255	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-Cl	iPr	COiPr
1-256	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Me	COiPr
1-257	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	iPr	COiPr
1-258	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	iPr	CO ₂ Et
1-259	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	Me	CO ₂ Et
1-260	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-F	iPr	CO ₂ Et
1-261	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-Cl	Me	CO ₂ Et
1-262	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-Cl	iPr	CO ₂ Et
1-263	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	Me	CO ₂ Et
1-264	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	A=0	C-F	iPr	CO ₂ Et
1-265	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	COiPr
1-266	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	C-H	Me	COiPr
1-267	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	C-H	iPr	COiPr
1-268	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	C-H	Me	COiPr
1-269	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	C-H	iPr	COiPr
1-270	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-F	C-H	Me	COiPr

[0309]

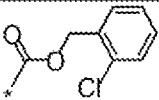
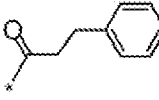
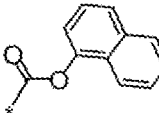
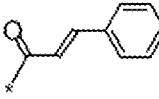
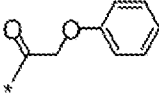
[表11]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-271	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-F	C-H	iPr	COiPr
1-272	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-273	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	C-H	Me	CO ₂ Et
1-274	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-275	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ Et
1-276	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-277	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-F	C-H	Me	CO ₂ Et
1-278	2-Cl, 4-CF ₃	C-Cl	3-F	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-279	2-C≡CH, 4-CF ₃	N	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-280	2-cPr, 4-CF ₃	N	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-281	2-COMe, 4-CF ₃	N	3-CF ₃	C-H	Et	COiPr
1-282	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-283	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
1-284	2-Me, 4-OCF ₃	C-H	3-Cl	N	Me	COiPr
1-285	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COCH ₂ CH ₂ cPen
1-286	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COCH ₂ CH ₂ SMe
1-287	2-Me, 4-OCF ₃	C-H	3-Cl	N	iPr	COiPr
1-288	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-289	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-290	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ cPen
1-291	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-292	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	CH ₂ cPr	COiPr
1-293	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-OcPr	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-294	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-SCF ₃	N	iPr	CO ₂ Et
1-295	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-SO ₂ CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-296	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-SO ₂ CF ₃	C-H	Me	CO ₂ Et
1-297	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	COCH=CHCF ₃
1-298	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	iPr	
1-299	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ CH ₂ cPr
1-300	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	

[0310] [表12]

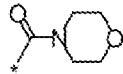
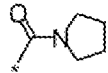
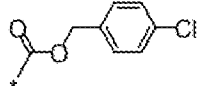
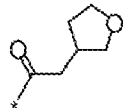
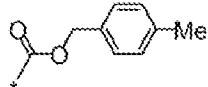
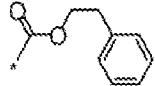
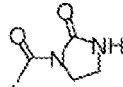
第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _Δ	W ^A	Z	G
1-301	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COCH=CH ₂
1-302	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	N	tBu	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-303	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-304	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₃	C-Me	tBu	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-305	2-Me, 3-F, 4-F, 5-F	C-Me	3-Cl	N	Et	COiPr
1-306	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-307	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COCH(Et)Et
1-308	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-309	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-310	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CON(Me)OMe
1-311	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=O	C-F	iPr	CO ₂ CH(Me)Cl
1-312	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COSCH(Me)Me
1-313	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-314	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-F	N	iPr	CO ₂ CH(Me)Cl
1-315	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-316	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COCHCl ₂
1-317	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	COCCl ₃
1-318	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ C(Me) ₂ CCl ₃
1-319	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CON(Me)Me
1-320	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	CON(Et)Et

[0311]

[表13]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _Δ	W ^A	Z	G
1-321	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-322	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-323	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-324	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-325	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	tBu	CO ₂ CH(Me)Cl
1-326	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-327	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ CH(Me)Cl
1-328	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Et	CO ₂ CH(Me)Cl
1-329	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-330	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	Me	
1-331	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	COCH ₂ iPr
1-332	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ nPr
1-333	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ Me
1-334	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ nPr
1-335	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	COMe
1-336	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ cPr
1-337	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ sBu
1-338	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	Me	CO ₂ nPr
1-339	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	Me	COCH ₂ iPr
1-340	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	Me	CO ₂ sBu

[0312]

[表14]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-341	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	Me	CO ₂ Me
1-342	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-343	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	iPr	CO _n Pr
1-344	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	iPr	COCH ₂ iPr
1-345	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	iPr	COsBu
1-346	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	iPr	CO ₂ Me
1-347	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-348	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO _n Pr
1-349	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	COCH ₂ iPr
1-350	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	COsBu
1-351	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ Me
1-352	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-353	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO _n Pr
1-354	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	COCH ₂ iPr
1-355	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	COsBu
1-356	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ Me
1-357	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-358	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	COiPr
1-359	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	CO ₂ Et
1-360	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	CO _n Pr
1-361	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	COCH ₂ iPr
1-362	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	COsBu
1-363	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	CO ₂ Me
1-364	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-365	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	COiPr
1-366	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO _n Pr
1-367	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	COCH ₂ iPr
1-368	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	COsBu
1-369	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ Me
1-370	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂

[0313]

[表15]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-371	2-Cl, 4-CF ₃	C-H	3-CF ₃	C-H	Et	CO _n Pr
1-372	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	Me	CO ₂ Et
1-373	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	Me	CO _n Pr
1-374	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	Me	COCH ₂ iPr
1-375	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	Me	COsBu
1-376	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	Me	CO ₂ Me
1-377	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-378	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	iPr	COiPr
1-379	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-380	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	iPr	CO _n Pr
1-381	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	iPr	COCH ₂ iPr
1-382	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	iPr	COsBu
1-383	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	iPr	CO ₂ Me
1-384	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-385	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	CO ₂ Et
1-386	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	CO _n Pr
1-387	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	COCH ₂ iPr
1-388	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	COsBu
1-389	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	CO ₂ Me
1-390	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-391	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	COiPr
1-392	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	CO ₂ Et
1-393	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	CO _n Pr
1-394	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	COCH ₂ iPr
1-395	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	COsBu
1-396	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	CO ₂ Me
1-397	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-398	2-Cl, 4-SMe	C-H	3-Cl	C-H	Et	COiPr
1-399	2-Cl, 4-SOMe	C-H	3-Cl	C-H	Et	COiPr
1-400	2-Cl, 4-SO ₂ Me	C-H	3-Cl	C-H	Et	COiPr

[0314]

[表16]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-401	2-Br, 4-SOMe	C-Br	3-Cl	C-H	Me	COiPr
1-402	2-Cl, 4-SMe	C-Cl	3-Cl	C-H	iPr	COiPr
1-403	2-Cl, 4-SOMe	C-Cl	A=0	C-Cl	iPr	COiPr
1-404	2-Br, 4-SOMe	C-Br	3-Cl	C-H	iPr	COiPr
1-405	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ iPr
1-406	2-Br, 4-SO ₂ Me	C-Br	A=0	C-Cl	iPr	COiPr
1-407	2-Cl, 4-SOMe	C-Cl	3-Cl	C-H	iPr	COiPr
1-408	2-Cl, 4-SMe	C-Cl	3-CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-409	2-Cl, 4-SOMe	C-Cl	3-CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-410	2-Cl, 4-SO ₂ Me	C-Cl	3-CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-411	2-Br, 4-SMe	C-Br	3-CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-412	2-Br, 4-SOMe	C-Br	3-CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-413	2-Br, 4-SO ₂ Me	C-Br	3-CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-414	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	N	tBu	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-415	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	CO ₂ CH ₂ Cl
1-416	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	iPr	CO ₂ CH(Me)Cl
1-417	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	Me	CO ₂ CH(Me)Cl
1-418	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ CH(Me)Cl
1-419	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	CO ₂ CH(Me)Cl
1-420	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	iPr	CO ₂ CH(Me)Cl
1-421	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Cl	Me	CO ₂ CH(Me)Cl
1-422	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	Me	CO ₂ CH(Me)Cl
1-423	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	CO ₂ CH(Me)Cl
1-424	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-Br	Me	CO ₂ CH ₂ Cl
1-425	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	Me	CO ₂ CH ₂ Cl
1-426	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Br	N	iPr	CO ₂ CH ₂ Cl
1-427	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	CO ₂ CH ₂ Cl
1-428	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ CH ₂ Cl
1-429	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ CH ₂ Cl
1-430	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ Cl

[0315]

[表17]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-431	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	Me	CO ₂ CH ₂ Cl
1-432	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	3-Me	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ Cl
1-433	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	Me	COiPr
1-434	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ Et
1-435	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	COiPr
1-436	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ Et
1-437	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	tBu	COiPr
1-438	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	tBu	CO ₂ Et
1-439	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	COiPr
1-440	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO ₂ Et
1-441	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N		COiPr
1-442	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N		CO ₂ Et
1-443	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	nPr	COiPr
1-444	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	nPr	CO ₂ Et
1-445	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	nBu	COiPr
1-446	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	nBu	CO ₂ Et
1-447	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	COiPr
1-448	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	CO ₂ Et
1-449	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPen	COiPr
1-450	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPen	CO ₂ Et
1-451	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cHex	COiPr
1-452	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cHex	CO ₂ Et
1-453	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N	Me	COiPr
1-454	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N	Me	CO ₂ Et
1-455	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N	iPr	COiPr
1-456	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N	iPr	CO ₂ Et
1-457	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N	Et	CO ₂ CH(Me)Cl
1-458	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N	tBu	COiPr
1-459	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N	tBu	CO ₂ Et
1-460	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N	cPr	COiPr

[0316]

[表18]

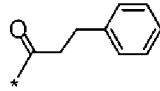
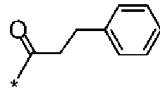
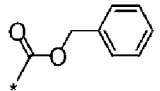
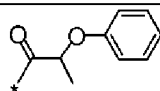
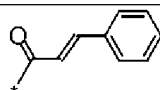
第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-461	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N	cPr	CO ₂ Et
1-462	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N		COiPr
1-463	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	N		CO ₂ Et
1-464	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	COiPr
1-465	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ Et
1-466	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-467	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	Et	CO ₂ CH(Me)Cl
1-468	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ CH(Me)Cl
1-469	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	tBu	CO ₂ CH(Me)Cl
1-470	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H		CO ₂ Et
1-471	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H		CO ₂ CH(Me)Cl
1-472	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	Me	COiPr
1-473	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	Me	CO ₂ Et
1-474	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	iPr	COiPr
1-475	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-476	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	cPr	COiPr
1-477	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	cPr	CO ₂ Et
1-478	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	Et	CO ₂ CH(Me)Cl
1-479	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	C-H	Et	CO ₂ CH(Me)Cl
1-480	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-F	iPr	COiPr
1-481	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-F	iPr	CO ₂ Et
1-482	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Cl	Et	CO ₂ CH(Me)Cl
1-483	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	iPr	COiPr
1-484	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	iPr	CO ₂ Et
1-485	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	cPr	COiPr
1-486	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	cPr	CO ₂ Et
1-487	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	Et	CO ₂ CH(Me)Cl
1-488	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	iPr	COiPr
1-489	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ Et
1-490	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂

[0317]

[表19]

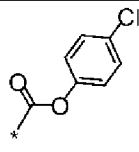
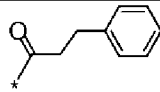
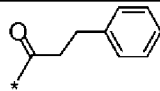
第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-491	2-Me, 4-F	C-Me	3-Cl	N	iPr	COiPr
1-492	2-Me, 4-F	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ Et
1-493	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	COMe
1-494	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl
1-495	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO(CH ₂) ₅ CH ₃
1-496	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	COcPr
1-497	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	COCH ₂ cPr
1-498	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CON(Me)OMe
1-499	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	
1-500	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	
1-501	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	
1-502	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	
1-503	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	
1-504	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-505	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-506	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	COsBu
1-507	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	COsBu
1-508	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	COCH ₂ iPr
1-509	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	COCH ₂ iPr
1-510	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO _n Pr
1-511	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO _n Pr
1-512	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO _n Bu
1-513	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO _n Bu
1-514	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO(CH ₂) ₄ CH ₃
1-515	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO(CH ₂) ₄ CH ₃
1-516	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ Me
1-517	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO ₂ Me
1-518	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ nPr
1-519	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO ₂ nPr
1-520	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ nBu

[0318]

[表20]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _Δ	W ^Δ	Z	G
1-521	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO ₂ nBu
1-522	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	
1-523	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe
1-524	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe
1-525	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe
1-526	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	COC(Me)=CH(Me)
1-527	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ cPen
1-528	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ cPr
1-529	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	COiPr
1-530	2-Me, 4-F	C-Me	3-Cl	C-H	Me	COiPr
1-531	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	COMe
1-532	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	COsBu
1-533	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	Me	COsBu
1-534	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	COCH ₂ iPr
1-535	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO _n Pr
1-536	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO _n Bu
1-537	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO _n Bu
1-538	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO(CH ₂) ₄ CH ₃
1-539	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO(CH ₂) ₄ CH ₃
1-540	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO(CH ₂) ₅ CH ₃
1-541	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	COcPr
1-542	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-543	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	
1-544	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	Me	
1-545	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ Me
1-546	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-547	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ Et
1-548	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ nPr
1-549	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ nPr
1-550	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ nBu

[表21]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-551	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ nBu
1-552	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe
1-553	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	Me	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe
1-554	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-555	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	Me	COiPr
1-556	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-557	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	nPr	COiPr
1-558	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	nPr	CO ₂ Et
1-559	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	nBu	COiPr
1-560	2-Me, 4-I	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	COiPr
1-561	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	COiPr
1-562	2-Me, 4-I	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ Et
1-563	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	nPr	COiPr
1-564	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	nPr	CO ₂ Et
1-565	2-Me, 4-I	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-566	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	nBu	CO ₂ Et
1-567	2-Me, 4-I	C-Me	3-CF ₃	N	iPr	COiPr
1-568	2-Me, 4-I	C-Me	3-CF ₃	N	iPr	CO ₂ Et
1-569	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	COiPr
1-570	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-571	2-Me, 4-I	C-Me	3-Cl	N	iPr	CO ₂ Et
1-572	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	tBu	COiPr
1-573	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	tBu	CO ₂ Et
1-574	2-Me, 4-I	C-Me	3-CF ₃	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-575	2-Me, 4-Br	C-Me	A=0	C-Br	tBu	CO ₂ Et
1-576	2-Me, 4-I	C-Me	3-CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-577	2-Me, 4-I	C-Me	3-CF ₃	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-578	2-Me, 4-I	C-Me	3-CF ₃	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-579	2-Me, 4-I	C-Me	3-Br	N	iPr	COiPr
1-580	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	CH ₂ iPr	COiPr

[0320]

[表22]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^Δ	Z	G
1-581	2-Me, 4-Br	C-Me	3-Br	C-H	CH ₂ iPr	CO ₂ Et
1-582	2-Me, 4-Br	C-Me	A=O	C-Br	CH ₂ iPr	COiPr
1-583	2-Me, 4-I	C-Me	3-Br	N	iPr	CO ₂ Et
1-584	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₃	C-H	Me	COiPr
1-585	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₃	C-H	Me	CO ₂ Et
1-586	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₃	C-H	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-587	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-588	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₃	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-589	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₃	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-590	2-Me, 4-Br	C-Me	A=O	C-CF ₃	Me	COiPr
1-591	2-Me, 4-Br	C-Me	A=O	C-CF ₃	Me	CO ₂ Et
1-592	2-Me, 4-Br	C-Me	A=O	C-CF ₃	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-593	2-Me, 4-Br	C-Me	A=O	C-CF ₃	iPr	COiPr
1-594	2-Me, 4-Br	C-Me	A=O	C-CF ₃	iPr	CO ₂ Et
1-595	2-Me, 4-Br	C-Me	A=O	C-CF ₃	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-596	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	COiPr
1-597	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-598	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	Me	CO ₂ Et
1-599	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	Et	COiPr
1-600	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	Et	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-601	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	Et	CO ₂ Et
1-602	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	cPr	COiPr
1-603	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	cPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-604	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	cPr	CO ₂ Et
1-605	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	tBu	COiPr
1-606	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	tBu	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-607	2-Me, 4-Br	C-Me	3-CF ₂ H	N	tBu	CO ₂ Et
1-608	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	COiPr
1-609	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-CF ₃	C-H	iPr	COiPr
1-610	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-CF ₃	N	iPr	COiPr

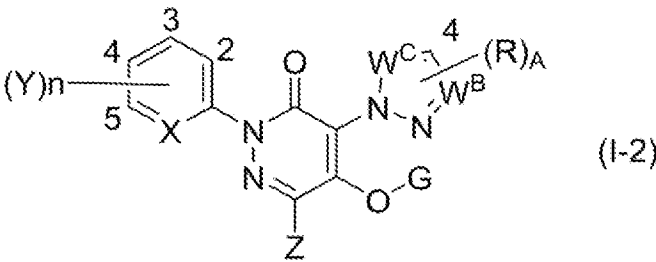
[0321]

[表23]

第1表 (続き)

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^A	Z	G
1-611	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	COiPr
1-612	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Br	N	iPr	COiPr
1-613	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-614	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-CF ₃	C-H	iPr	CO ₂ Et
1-615	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-CF ₃	N	iPr	CO ₂ Et
1-616	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ Et
1-617	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Br	N	iPr	CO ₂ Et
1-618	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-619	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-CF ₃	C-H	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-620	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-CF ₃	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-621	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-CF ₂ H	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-622	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Br	N	iPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-623	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ Et
1-624	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO ₂ Et
1-625	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	tBu	CO ₂ Et
1-626	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	Me	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-627	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	cPr	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-628	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	tBu	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
1-629	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	Me	COiPr
1-630	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	cPr	COiPr
1-631	2-Me, 4-Cl	C-Me	3-Cl	N	tBu	COiPr

[0322] [表24]



第2表

No.	(Y) _n	X	(R) _A	W ^B	W ^C	Z	G
2-1	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-H	N	Et	COiPr
2-2	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	C-H	N	Et	CO ₃ Et
2-3	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	4-Br	N	C-Br	nPr	COiPr
2-4	2-Me, 4-CF ₃	C-Me	A=0	N	C-H	Et	CO ₃ Et

[0323]

[表25]

第3表

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-1	(300MHz/CDCl ₃) 9.17 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.13-3.18 (1H, m), 2.70 (2H, t), 2.16 (6H, s), 1.72-1.84 (2H, m), 1.25 (6H, d), 1.07 (3H, t)
1-2	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.11-3.20 (1H, m), 2.60 (2H, d), 2.16-2.27 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.26 (6H, d), 1.06 (6H, d)
1-3	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.10-3.18 (1H, m), 2.71 (2H, t), 2.16 (6H, s), 1.73-1.81 (2H, m), 1.30-1.44 (4H, m), 1.25 (6H, d), 0.94 (3H, t)
1-4	(300MHz/CDCl ₃) 9.13 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.12-3.21 (1H, m), 2.63 (2H, s), 2.16 (6H, s), 1.26 (6H, d), 1.12 (9H, s)
1-5	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.09-3.17 (1H, m), 2.91-3.01 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.37 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-6	(300MHz/CDCl ₃) 9.10 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.09-3.19 (1H, m), 2.72-2.84 (1H, s), 2.16 (6H, s), 1.56-1.97 (2H, m), 1.36 (3H, d), 1.25 (6H, d), 1.03 (3H, t)
1-7	(300MHz/CDCl ₃) 9.09 (1H, s), 7.46 (2H, s), 3.06-3.15 (1H, m), 2.14 (6H, s), 1.41 (9H, s), 1.25 (6H, d)
1-8	(300MHz/CDCl ₃) 9.09 (1H, s), 7.46 (2H, s), 3.14-3.23 (1H, m), 2.15 (6H, s), 1.91-1.99 (1H, m), 1.26 (6H, d), 1.14-1.25 (4H, m)
1-9	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.39 (2H, q), 3.20-3.30 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.46 (3H, t), 1.27 (6H, d)
1-10	(300MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.91-5.02 (1H, m), 3.20-3.29 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.44 (6H, d), 1.27 (6H, d)
1-11	(300MHz/CDCl ₃) 9.28 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.00 (3H, s), 3.18-3.32 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.27 (6H, d)
1-12	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.28 (2H, t), 3.21-3.30 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.78-1.90 (2H, m), 1.27 (6H, d), 0.88 (3H, t)
1-13	(300MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.09 (2H, d), 3.18-3.33 (1H, m), 2.16 (6H, s), 2.05-2.17 (1H, m), 1.27 (6H, d), 1.05 (6H, d)
1-14	(300MHz/CDCl ₃) 9.23 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.00 (2H, s), 3.20-3.30 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.27 (6H, d), 1.05 (9H, s)
1-15	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.48 (2H, s), 5.97-6.11 (1H, m), 5.40-5.52 (2H, m), 4.78-4.80 (2H, m), 3.20-3.30 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.27 (6H, d)

[0324]

[表26]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-16	(300MHz/CDCl ₃) 9.33 (1H, s), 7.49 (2H, s), 5.86 (2H, s), 3.18-3.27 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.28 (6H, d)
1-17	(300MHz/CDCl ₃) 9.32 (1H, s), 7.49 (2H, s), 6.45 (1H, q), 3.19-3.28 (1H, m), 2.16 (6H, s), 2.00 (3H, d), 1.28 (6H, d)
1-18	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.45-4.48 (2H, m), 3.73-3.76 (2H, m), 3.45 (3H, s), 3.21-3.31 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.26 (6H, d)
1-19	(300MHz/CDCl ₃) 9.12 (1H, s), 7.40 (2H, s), 2.60-2.70 (4H, m), 2.09 (6H, s), 1.67-1.80 (2H, m), 1.18 (3H, t), 1.00 (3H, t)
1-20	(300MHz/CDCl ₃) 9.18 (1H, s), 7.46 (2H, s), 2.68-2.76 (4H, m), 2.16 (6H, s), 1.70-1.80 (2H, m), 1.40-1.52 (2H, m), 1.24 (3H, t), 0.98 (3H, t)
1-21	(300MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 7.50 (2H, s), 2.73-2.81 (4H, m), 2.19 (6H, s), 1.26-1.37 (6H, m)
1-22	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.46 (2H, s), 2.72 (2H, q), 2.59 (2H, d), 2.26-2.14 (7H, m), 1.23 (3H, t), 1.06 (6H, d)
1-23	(300MHz/CDCl ₃) 9.23 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.75 (2H, q), 2.43 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.24 (3H, t)
1-24	(300MHz/CDCl ₃) 9.20 (1H, s), 7.48-7.52 (2H, m), 3.01 (1H, sep), 2.75 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.40 (6H, d), 1.26 (3H, t)
1-25	(300MHz/CDCl ₃) 9.13 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.69-2.81 (3H, m), 2.16 (6H, s), 1.48-1.89 (2H, m), 1.36 (3H, d), 1.24 (3H, t), 1.04 (3H, t)
1-26	(300MHz/CDCl ₃) 9.13 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.72 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.42 (9H, s), 1.25 (3H, t)
1-27	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.49 (2H, s), 2.78 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.91-2.01 (1H, m), 1.21-1.31 (7H, m)
1-28	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.44-3.56 (1H, m), 2.72 (2H, q), 2.34-2.59 (4H, m), 2.00-2.17 (8H, s), 1.23 (3H, t)
1-29	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.06-3.16 (1H, m), 2.73 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.95-2.11 (4H, m), 1.66-1.84 (4H, m), 1.24 (3H, t)
1-30	(300MHz/CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 8.02 (2H, d), 7.48 (2H, d), 7.42 (2H, s), 2.73 (2H, q), 2.13 (6H, s), 1.19 (3H, t)

[0325]

[表27]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-31	(300MHz/CDCl ₃) 9.31 (1H, s), 9.14 (1H, d), 8.34 (1H, dd), 7.56 (1H, d), 7.49 (2H, s), 2.79 (2H, q), 2.20 (6H, s), 1.26 (3H, t)
1-32	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.40 (2H, q), 2.81 (2H, q), 2.17 (6H, s), 1.49 (3H, t), 1.26 (3H, t)
1-33	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.29 (2H, t), 2.81 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.78-1.91 (2H, m), 1.26 (3H, t), 1.06 (3H, t)
1-34	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.48 (2H, s), 5.97-6.11 (1H, m), 5.46 (2H, dd), 4.80 (2H, d), 2.80 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.25 (3H, t)
1-35	(300MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.65-2.76 (4H, m), 2.16 (6H, s), 1.71-1.84 (2H, m), 1.23 (3H, t), 1.05 (3H, t)
1-36	(300MHz/CDCl ₃) 8.46 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.67-2.76 (4H, m), 2.16 (6H, s), 1.68-1.78 (2H, m), 1.38-1.51 (2H, m), 1.23 (3H, t), 0.98 (3H, t)
1-37	(300MHz/CDCl ₃) 8.50 (1H, d), 7.48 (2H, s), 6.38 (1H, d), 2.71-2.78 (4H, m), 2.19 (6H, s), 1.23-1.33 (6H, m)
1-38	(300MHz/CDCl ₃) 8.44 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.74 (2H, q), 2.58 (2H, d), 2.15-2.27 (7H, m), 1.23 (3H, t), 1.05 (6H, d)
1-39	(300MHz/CDCl ₃) 8.50 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.74 (2H, q), 2.41 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.23 (3H, t)
1-40	(300MHz/CDCl ₃) 8.44 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.87-3.01 (1H, m), 2.71 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.35 (6H, d), 1.23 (3H, t)
1-41	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.67-2.78 (3H, m), 2.16 (6H, s), 1.82-1.96 (1H, m), 1.55-1.69 (1H, m), 1.33 (3H, d), 1.23 (3H, t), 1.01 (3H, t)
1-42	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.70 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.40 (9H, s), 1.24 (3H, t)
1-43	(300MHz/CDCl ₃) 8.40 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.74 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.89-1.97 (1H, m), 1.65-1.73 (1H, m), 1.14-1.26 (5H, m), 1.01-1.06 (1H, m)
1-44	(300MHz/CDCl ₃) 8.50 (1H, d), 8.06-8.09 (2H, m), 7.52-7.56 (2H, m), 7.47 (2H, s), 6.30 (1H, d), 2.78 (2H, q), 2.20 (6H, s), 1.25 (3H, t)
1-45	(300MHz/CDCl ₃) 9.12 (1H, d), 8.60 (1H, d), 8.35 (1H, dd), 7.55 (1H, d), 7.48 (2H, s), 6.31 (1H, d), 2.79 (2H, q), 2.20 (6H, s), 1.26 (3H, t)

[0326]

[表28]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-46	(300MHz/CDCl ₃) 8.57 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.38 (1H, d), 4.37 (2H, q), 2.79 (2H, q), 2.17 (6H, s), 1.45 (3H, t), 1.25 (3H, t)
1-47	(300MHz/CDCl ₃) 8.56 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.37 (1H, d), 4.26 (2H, t), 2.79 (2H, q), 2.17 (6H, s), 1.77-1.90 (2H, m), 1.25 (3H, t), 1.05 (3H, t)
1-48	(300MHz/CDCl ₃) 8.57 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.37 (1H, d), 5.98-6.11 (1H, m), 5.36-5.50 (2H, m), 4.78 (2H, d), 2.79 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.49 (3H, t)
1-49	(300MHz/CDCl ₃) 8.39 (1H, dd), 7.61 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.62-2.77 (4H, m), 2.16 (6H, s), 1.75-1.85 (2H, m), 1.39 (3H, t), 1.05 (3H, t)
1-50	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, dd), 7.61 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.63-2.77 (4H, m), 2.19 (6H, s), 1.41-1.79 (4H, m), 1.35 (3H, t), 1.05 (3H, t)
1-51	(300MHz/CDCl ₃) 8.39 (1H, dd), 7.61 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.65-2.77 (4H, m), 2.19 (6H, s), 1.22-1.30 (6H, m)
1-52	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, dd), 7.60 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.72 (2H, q), 2.54 (2H, d), 2.11-2.28 (7H, m), 1.30 (3H, t), 1.10 (6H, d)
1-53	(300MHz/CDCl ₃) 8.36 (1H, dd), 7.61 (1H, dd), 7.28 (2H, s), 2.74 (2H, q), 2.57 (2H, s), 2.19 (6H, s), 1.28 (3H, t), 1.13 (9H, s)
1-54	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, dd), 7.61 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.73 (2H, q), 2.66 (2H, q), 2.19 (6H, s), 0.89-1.80 (12H, m)
1-55	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, dd), 7.61 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.73 (2H, q), 2.66 (2H, q), 2.19 (6H, s), 0.85-1.79 (14H, m)
1-56	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, dd), 7.61 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.73 (2H, q), 2.65 (2H, q), 2.19 (6H, s), 0.85-1.79 (16H, m)
1-57	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, dd), 7.61 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.74 (2H, q), 2.65 (2H, q), 2.19 (6H, s), 0.91-1.79 (18H, m)
1-58	(300MHz/CDCl ₃) 8.42 (1H, d), 7.64 (1H, d), 7.49 (2H, s), 2.74 (2H, q), 2.38 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.26 (3H, t)
1-59	(300MHz/CDCl ₃) 8.37 (1H, dd), 7.60 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.91 (1H, sep), 2.72 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.34 (6H, d), 1.26 (3H, t)
1-60	(300MHz/CDCl ₃) 8.35 (1H, d), 7.65 (1H, d), 7.50 (2H, s), 2.69-2.81 (3H, m), 2.20 (6H, s), 1.55-1.95 (2H, m), 1.19-1.39 (6H, m), 1.05 (3H, t)

[0327]

[表29]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-61	(300MHz/CDCl ₃) 8.32 (1H, dd), 7.60 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.71 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.39 (9H, s), 1.26 (3H, t)
1-62	(300MHz/CDCl ₃) 8.26 (1H, dd), 7.59 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.71 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.75 (2H, q), 1.34 (6H, s), 1.26 (3H, t), 0.95 (3H, t)
1-63	(300MHz/CDCl ₃) 8.33 (1H, dd), 7.64 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 2.75 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.89-1.99 (1H, m), 1.12-1.33 (7H, m)
1-64	(300MHz/CDCl ₃) 8.39 (1H, dd), 7.60 (1H, dd), 7.49 (2H, s), 3.45 (1H, sep), 2.75 (2H, q), 1.85-2.59 (12H, m), 1.26 (3H, t)
1-65	(300MHz/CDCl ₃) 8.35 (1H, dd), 7.60 (1H, dd), 7.48 (2H, s), 3.07 (1H, sep), 2.75 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.65-2.19 (8H, m), 1.57 (3H, t)
1-66	(300MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, d), 7.61 (1H, d), 7.49 (2H, s), 2.65-2.78 (3H, m), 2.20 (6H, s), 1.19-2.10 (13H, m)
1-67	(300MHz/CDCl ₃) 8.51 (1H, d), 8.10-8.19 (2H, m), 7.48-7.75 (5H, m), 7.36 (1H, d), 2.79 (2H, q), 2.24 (6H, s), 1.27 (3H, t)
1-68	(300MHz/CDCl ₃) 8.63 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.44 (1H, q), 6.39 (1H, d), 3.22 (1H, sep), 2.16 (6H, d), 2.00 (3H, d), 1.27 (6H, d)
1-69	(300MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, brs), 8.53 (1H, d), 8.34 (1H, dd), 7.68 (1H, d), 7.50 (2H, s), 7.35 (1H, d), 2.78 (2H, q), 2.23 (6H, s), 1.30 (3H, t)
1-70	(300MHz/CDCl ₃) 8.33 (1H, d), 7.63 (1H, d), 7.48 (2H, s), 2.72 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.40-1.55 (5H, m), 1.28 (3H, t), 0.89-0.99 (2H, m)
1-71	(300MHz/CDCl ₃) 8.51 (1H, dd), 7.65 (1H, dd), 7.49 (2H, s), 4.35 (2H, q), 2.79 (2H, q), 2.20 (6H, s), 1.43 (3H, t), 1.28 (3H, t)
1-72	(300MHz/CDCl ₃) 8.51 (1H, dd), 7.64 (1H, dd), 7.49 (2H, s), 4.25 (2H, t), 2.79 (2H, q), 2.20 (6H, s), 1.78-1.85 (2H, m), 1.27 (3H, t), 1.06 (3H, t)
1-73	(300MHz/CDCl ₃) 8.51 (1H, d), 7.65 (1H, d), 7.49 (2H, s), 5.90-6.10 (1H, m), 5.39-5.51 (2H, m), 4.85-4.90 (2H, m), 2.79 (2H, q), 2.76 (6H, s), 1.28 (3H, t)
1-74	(300MHz/CDCl ₃) 8.56 (1H, d), 7.67 (1H, d), 7.49 (2H, s), 4.88 (2H, d), 2.80 (2H, q), 2.66 (1H, t), 2.19 (6H, s), 1.25 (3H, t)
1-75	(300MHz/CDCl ₃) 8.33 (1H, d), 7.59 (1H, d), 7.48 (2H, s), 3.15 (3H, s), 2.96 (3H, s), 2.78 (2H, q), 2.20 (6H, s), 1.27 (3H, t)

[0328]

[表30]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-76	(300MHz/CDCl ₃) 8.32 (1H, brs), 7.56 (1H, brs), 7.28 (2H, s), 3.18-3.65 (4H, m), 2.78 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.09-1.39 (9H, m)
1-77	(300MHz/CDCl ₃) 8.37 (1H, dd), 7.78-7.79 (2H, m), 7.61 (1H, dd), 2.65-2.78 (4H, m), 1.26-1.31 (6H, m)
1-78	(300MHz/CDCl ₃) 8.35 (1H, dd), 7.78-7.79 (2H, m), 7.62 (1H, dd), 2.73 (2H, q), 2.65 (2H, q), 1.74-1.81 (2H, m), 1.28 (3H, t), 1.08 (3H, t)
1-79	(300MHz/CDCl ₃) 8.35 (1H, dd), 7.78-7.79 (2H, m), 7.61 (1H, dd), 2.73 (2H, q), 2.54 (2H, d), 2.17-2.26 (1H, m), 1.26 (3H, t), 1.02 (6H, d)
1-80	(300MHz/CDCl ₃) 8.33 (1H, dd), 7.78-7.79 (2H, m), 7.61 (1H, dd), 2.75 (2H, q), 2.56 (2H, s), 1.23-1.38 (3H, m), 1.15 (9H, s)
1-81	(300MHz/CDCl ₃) 8.39 (1H, d), 7.78-7.79 (2H, m), 7.64 (1H, d), 2.75 (2H, q), 2.37 (3H, s), 1.27 (3H, s)
1-82	(300MHz/CDCl ₃) 8.25 (1H, dd), 7.69 (2H, s), 7.50 (1H, dd), 2.81 (1H, sep), 2.63 (2H, q), 1.22 (6H, d), 1.17 (3H, t)
1-83	(300MHz/CDCl ₃) 8.30 (1H, dd), 7.78-7.79 (2H, m), 7.60 (1H, dd), 2.71 (2H, q), 1.38 (9H, s), 1.27 (3H, t)
1-84	(300MHz/CDCl ₃) 8.49 (1H, d), 7.79-7.80 (2H, m), 7.66 (1H, d), 3.94 (3H, s), 2.79 (2H, q), 1.28 (3H, t)
1-85	(300MHz/CDCl ₃) 8.47 (1H, dd), 7.90-7.91 (2H, m), 7.65 (1H, dd), 4.34 (2H, q), 2.80 (2H, q), 1.43 (3H, t), 1.28 (3H, t)
1-86	(300MHz/CDCl ₃) 8.46 (1H, dd), 7.79 (2H, s), 7.63 (1H, dd), 4.95 (1H, sep), 2.80 (2H, q), 1.41 (6H, d), 1.25 (3H, t)
1-87	(300MHz/CDCl ₃) 8.44 (1H, dd), 7.79 (2H, s), 7.65 (1H, dd), 2.80 (2H, q), 1.53 (9H, s), 1.30 (3H, t)
1-88	(300MHz/CDCl ₃) 8.48 (1H, dd), 7.78-7.79 (2H, m), 7.63 (1H, dd), 4.06 (2H, d), 2.80 (2H, q), 2.04-2.15 (1H, m), 1.28 (3H, t), 1.04 (6H, d)
1-89	(300MHz/CDCl ₃) 8.36 (1H, dd), 7.78 (2H, s), 7.65 (1H, dd), 3.47-3.85 (8H, m), 2.78 (2H, q), 1.31 (3H, t)
1-90	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.80 (2H, s), 2.93-3.03 (1H, m), 2.75 (2H, q), 1.40 (6H, d), 1.27 (3H, t)

[0329]

[表31]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-91	(300MHz/CDCl ₃) 9.19 (1H, s), 7.48 (2H, s), 3.02 (1H, sep), 2.19 (6H, s), 1.19-2.10 (1H, m), 1.42 (6H, d), 0.90-1.15 (4H, m)
1-92	(300MHz/CDCl ₃) 9.28 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.44 (2H, q), 2.11-2.25 (7H, m), 1.50 (3H, t), 0.90-1.11 (4H, m)
1-93	(500MHz/CDCl ₃) 8.97 (1H, s), 7.46 (2H, s), 2.94 (1H, sep), 2.15 (6H, s), 1.38 (9H, s), 1.33 (6H, d)
1-94	(300MHz/CDCl ₃) 9.18 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.32 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.42 (3H, t), 1.38 (9H, s)
1-95	(300MHz/CDCl ₃) 8.23 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.86-2.96 (1H, m), 2.15 (6H, s), 1.36 (9H, s), 1.31 (6H, d)
1-96	(300MHz/CDCl ₃) 8.56 (1H, d), 7.71 (1H, d), 7.57 (1H, d), 6.72 (1H, d), 2.77 (2H, q), 2.38 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.28 (3H, t)
1-97	(300MHz/CDCl ₃) 8.53-8.54 (1H, m), 7.70-7.71 (1H, m), 7.57-7.58 (1H, m), 6.75 (1H, d), 2.68-2.80 (4H, m), 2.28 (3H, s), 1.24-1.31 (6H, m)
1-98	(300MHz/CDCl ₃) 9.21 (1H, s), 7.50 (2H, s), 2.94-3.04 (1H, m), 2.42 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.41 (6H, d)
1-99	(300MHz/CDCl ₃) 9.29 (1H, s), 7.50 (2H, s), 4.44 (2H, q), 2.48 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.51 (3H, t)
1-100	(500MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.94 (1H, sep), 2.36 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.35 (6H, d)
1-101	(500MHz/CDCl ₃) 8.57 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.38 (1H, d), 4.37 (2H, q), 2.42 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.46 (3H, t)
1-102	(500MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.46 (2H, s), 2.98 (1H, sep), 2.13 (6H, s), 1.31-1.45 (9H, m), 0.71-1.00 (4H, m)
1-103	(500MHz/CDCl ₃) 9.28 (1H, s), 7.46 (2H, s), 4.39 (2H, q), 2.13 (6H, s), 1.46 (3H, t), 1.44 (3H, s), 0.97-1.00 (2H, m), 0.75-0.78 (2H, m)
1-104	(500MHz/CDCl ₃) 8.52 (1H, s), 7.66 (1H, s), 7.48 (2H, s), 2.89 (1H, sep), 2.17 (6H, s), 1.30 (6H, d)
1-105	(500MHz/CDCl ₃) 8.66 (1H, s), 7.72 (1H, s), 7.49 (2H, s), 4.33 (2H, q), 2.18 (6H, s), 1.40 (3H, t)

[0330]

[表32]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-106	(300MHz/CDCl ₃) 8.53 (1H, d), 7.50 (2H, s), 6.42 (1H, d), 2.93-3.02 (1H, m), 2.20 (6H, s), 1.37 (6H, d)
1-107	(300MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, d), 7.07 (2H, s), 6.38 (1H, d), 2.95 (1H, sep), 2.74 (2H, q), 2.14 (6H, s), 1.37 (6H, d), 1.28 (3H, t)
1-108	(300MHz/CDCl ₃) 8.48 (1H, d), 7.07 (2H, s), 6.38 (1H, d), 2.65-2.80 (4H, m), 2.14 (6H, s), 1.79-1.88 (2H, m), 1.26 (3H, t), 1.05 (3H, t)
1-109	(300MHz/CDCl ₃) 8.46 (1H, d), 7.36 (2H, s), 6.65 (1H, t), 6.37 (1H, d), 2.91-3.01 (1H, m), 2.72 (2H, q), 2.17 (6H, s), 1.38 (6H, d), 1.26 (3H, t)
1-110	(300MHz/CDCl ₃) 8.36 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.43 (2H, s), 2.77-2.86 (1H, m), 2.62 (2H, q), 2.07 (6H, s), 1.24 (6H, d), 1.17 (3H, t)
1-111	(300MHz/CDCl ₃) 8.85 (1H, dd), 8.60 (1H, dd), 8.21 (1H, dd), 6.71 (1H, dd), 3.92 (3H, s), 2.81 (2H, q), 1.28 (3H, t)
1-112	(300MHz/CDCl ₃) 8.90 (1H, s), 8.46 (1H, s), 8.38 (1H, s), 2.83-2.97 (1H, m), 2.74 (2H, q), 1.31 (6H, d), 1.27 (3H, t)
1-113	(300MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 8.85 (1H, d), 8.23 (1H, d), 2.68-2.80 (4H, m), 1.24-1.31 (6H, m)
1-114	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 8.84-8.85 (1H, m), 8.21-8.22 (1H, m), 2.78 (2H, q), 1.92-1.96 (1H, m), 1.20-1.30 (7H, m)
1-115	(300MHz/CDCl ₃) 9.12 (1H, s), 8.78 (1H, brs), 8.15 (1H, brs), 2.85 (1H, sep), 2.67 (2H, q), 1.29 (6H, d), 1.20 (3H, t)
1-116	(300MHz/CDCl ₃) 9.13 (1H, s), 8.78 (1H, brs), 8.16 (1H, brs), 2.68 (2H, q), 2.49 (2H, d), 2.06-2.27 (1H, m), 1.20 (3H, t), 0.98 (6H, d)
1-117	(300MHz/CDCl ₃) 9.08 (1H, s), 8.78 (1H, brs), 8.15 (1H, brs), 2.67 (2H, q), 1.32 (9H, s), 1.20 (3H, t)
1-118	(300MHz/CDCl ₃) 9.09 (1H, s), 8.78 (1H, brs), 8.15 (1H, brs), 2.59-2.91 (3H, m), 0.71-1.85 (11H, m)
1-119	(300MHz/CDCl ₃) 8.74 (1H, d), 8.59 (1H, s), 8.11 (1H, d), 5.75-5.91 (1H, m), 5.22-5.39 (2H, m), 4.25-4.45 (2H, m), 2.74 (2H, q), 1.19 (3H, t)
1-120	(300MHz/CDCl ₃) 9.22 (1H, s), 8.78 (1H, brs), 8.16 (1H, brs), 4.21 (2H, q), 3.65-3.85 (2H, m), 1.70-1.85 (2H, m), 0.90-1.31 (6H, m)

[0331]

[表33]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-121	(300MHz/CDCl ₃) 8.84 (1H, s), 8.20 (1H, s), 8.20 (1H, s), 2.90 (1H, sep), 2.72 (2H, q), 2.19 (3H, s), 1.29 (6H, d), 1.25 (3H, t)
1-123	(500MHz/CDCl ₃) 8.60 (1H, s), 7.76 (1H, d), 7.48 (1H, dd), 7.36 (1H, d), 4.30 (2H, q), 2.77 (2H, q), 1.39 (3H, t), 1.25 (3H, t)
1-124	(300MHz/CDCl ₃) 8.43 (1H, m), 7.64 (2H, m), 7.42 (1H, d), 6.69 (1H, d), 2.90 (1H, sep), 2.71 (2H, q), 2.54 (2H, q), 1.29 (6H, d), 1.24 (3H, t), 1.20 (3H, t)
1-125	(300MHz/CDCl ₃) 8.59 (1H, dd), 7.47 (1H, d), 7.38 (1H, d), 7.29 (1H, s), 4.31 (2H, q), 3.90 (3H, s), 2.77 (2H, q), 1.40 (3H, t), 1.26 (3H, t)
1-126	(300MHz/CDCl ₃) 8.60 (1H, dd), 7.48 (2H, m), 7.32 (1H, m), 4.31 (2H, q), 2.78 (2H, q), 1.40 (3H, t), 1.27 (3H, t)
1-127	(300MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, dd), 7.64 (1H, s), 7.63 (1H, d), 7.44 (1H, d), 2.89 (1H, sep), 2.71 (2H, q), 2.22 (3H, s), 1.30 (6H, d), 1.26 (3H, t)
1-128	(300MHz/CDCl ₃) 8.42 (1H, dd), 7.95 (2H, m), 7.55 (1H, d), 6.70 (1H, d), 3.10 (3H, s), 2.90 (1H, sep), 2.73 (2H, q), 2.29 (3H, s), 1.29 (6H, d), 1.25 (3H, t)
1-129	(300MHz/CDCl ₃) 9.17 (1H, s), 7.63 (2H, m), 7.43 (1H, d), 2.96 (1H, sep), 2.38 (3H, s), 2.25 (3H, s), 1.38 (6H, d)
1-131	(500MHz/CDCl ₃) 8.33 (1H, d), 7.56 (1H, d), 7.34 (2H, s), 2.88 (1H, sep), 2.67 (2H, q), 2.07 (6H, s), 1.30 (6H, d), 1.22 (3H, t)
1-132	(500MHz/CDCl ₃) 8.48 (1H, d), 7.61 (1H, d), 7.34 (2H, s), 4.31 (2H, q), 2.75 (2H, q), 2.06 (6H, s), 1.39 (3H, t), 1.23 (3H, t)
1-133	(300MHz/CDCl ₃) 8.04 (1H, dd), 7.77 (2H, s), 7.71 (1H, dd), 5.63 (1H, q), 3.74 (3H, s), 2.71-2.87 (2H, m), 1.58-1.62 (3H, m), 1.28 (3H, t)
1-134	(300MHz/CDCl ₃) 8.25-8.26 (1H, m), 7.69 (1H, s), 7.55 (1H, s), 6.80 (1H, d), 5.46 (1H, q), 3.73 (3H, s), 2.76-2.85 (2H, m), 2.25 (3H, s), 1.58-1.61 (3H, m), 1.25 (3H, t)
1-135	(300MHz/CDCl ₃) 8.08 (1H, brs), 7.71 (1H, brs), 7.46 (2H, s), 5.60 (1H, q), 3.73 (3H, s), 2.71-2.87 (2H, m), 2.19 (6H, s), 1.60 (3H, d), 1.30 (3H, t)
1-136	(300MHz/CDCl ₃) 8.19 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.45 (1H, d), 5.59 (1H, q), 3.72 (3H, s), 2.68-2.87 (2H, m), 2.17 (6H, s), 1.66 (3H, d), 1.31-1.39 (3H, m)
1-137	(300MHz/CDCl ₃) 8.91 (1H, s), 7.52 (2H, s), 5.90 (1H, q), 3.75 (3H, s), 2.71-2.79 (2H, m), 2.21 (6H, s), 1.70 (3H, d), 1.28 (3H, t)

[表34]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-138	(300MHz/CDCl ₃) 8.19 (1H, d), 7.05 (2H, s), 6.46 (1H, d), 5.57 (1H, q), 3.72 (3H, s), 2.68-2.90 (2H, m), 2.09-2.12 (6H, m), 1.65 (3H, d), 1.25 (3H, t)
1-139	(300MHz/CDCl ₃) 8.19-8.20 (1H, m), 7.26-7.32 (3H, m), 6.75 (1H, d), 5.46 (1H, q), 3.71 (3H, s), 3.48 (2H, q), 2.65-2.86 (2H, m), 2.16 (3H, s), 1.56 (3H, d), 1.23 (3H, t)
1-140	(300MHz/CDCl ₃) 8.07 (1H, d), 7.71 (1H, d), 7.46 (2H, s), 5.85 (1H, q), 4.10 (2H, q), 2.68-2.91 (2H, m), 2.15-2.22 (6H, m), 1.60 (3H, d), 1.19-1.35 (6H, m)
1-141	(300MHz/CDCl ₃) 8.09 (1H, d), 7.71 (1H, d), 7.45 (2H, s), 5.89 (1H, q), 4.75 (1H, q), 2.68-2.92 (2H, m), 2.10-2.21 (6H, m), 1.65 (3H, d), 1.19-1.32 (9H, m)
1-142	(300MHz/CDCl ₃) 8.90 (1H, s), 8.86 (1H, dd), 8.22 (1H, dd), 5.82 (1H, s), 3.79 (3H, s), 2.69-2.95 (2H, m), 1.69 (3H, d), 1.28 (3H, t)
1-143	(300MHz/CDCl ₃) 8.23 (1H, dd), 7.75 (1H, dd), 7.49 (2H, s), 3.16 (3H, s), 2.97 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.28 (3H, t)
1-144	(300MHz/CDCl ₃) 8.19 (1H, d), 7.72 (1H, d), 7.49 (2H, s), 3.21 (2H, q), 2.97 (2H, q), 2.07 (6H, s), 1.55 (3H, t), 1.29 (3H, t)
1-145	(300MHz/CDCl ₃) 8.14-8.21 (1H, m), 7.65-7.71 (1H, m), 7.49 (2H, s), 3.10-3.20 (2H, m), 2.95 (2H, q), 2.19 (6H, s), 1.91-2.10 (2H, m), 2.28 (3H, t), 1.11 (3H, t)
1-146	(300MHz/CDCl ₃) 8.35 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.45 (1H, d), 3.28 (3H, s), 2.96 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.27 (3H, t)
1-147	(300MHz/CDCl ₃) 9.07 (1H, s), 7.48 (2H, s), 3.43 (3H, s), 3.00 (2H, q), 2.17 (6H, s), 1.28 (3H, t)
1-148	(300MHz/CDCl ₃) 7.69-7.78 (4H, m), 4.41 (2H, s), 3.78 (3H, s), 2.89 (2H, q), 1.28 (3H, t)
1-149	(300MHz/CDCl ₃) 9.40 (1H, s), 7.49 (2H, s), 4.35 (2H, q), 2.82 (2H, q), 2.18 (6H, s), 1.43 (3H, t), 1.27 (3H, t)
1-150	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.75 (1H, t), 2.95 (1H, sep), 2.73 (2H, q), 2.18 (6H, s), 1.34 (6H, d), 1.25 (3H, t)
1-151	(300MHz/CDCl ₃) 9.34 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.77 (1H, t), 4.33 (2H, q), 3.25 (1H, sep), 2.17 (6H, s), 1.42 (3H, t), 1.27 (6H, d)
1-152	(300MHz/CDCl ₃) 8.98 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.75 (2H, q), 3.13 (1H, sep), 2.95 (1H, sep), 2.16 (6H, s), 1.34 (6H, d), 1.24 (6H, d)

[0333]

[表35]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-153	(300MHz/CDCl ₃) 9.03 (1H, d), 7.47 (2H, s), 3.13 (1H, sep), 2.96 (1H, sep), 2.16 (6H, s), 1.36 (6H, d), 1.25 (6H, d)
1-155	(300MHz/CDCl ₃) 9.11 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.14 (1H, sep), 2.96 (1H, sep), 2.16 (6H, s), 1.38 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-157	(300MHz/CDCl ₃) 9.06 (1H, d), 7.06 (2H, s), 2.96 (1H, sep), 2.72 (2H, q), 2.12 (6H, s), 1.38 (6H, d), 1.25 (3H, t)
1-158	(300MHz/CDCl ₃) 9.20 (1H, s), 7.41 (2H, d), 4.39 (2H, q), 2.79 (2H, q), 1.46 (3H, t), 1.27 (3H, t)
1-159	(300MHz/CDCl ₃) 9.28 (1H, s), 7.21 (2H, s), 4.39 (2H, q), 2.79 (2H, q), 2.08 (6H, s), 1.47 (3H, t), 1.26 (3H, t)
1-161	(300MHz/CDCl ₃) 8.60 (1H, d), 7.67 (1H, d), 7.47 (2H, s), 4.35 (2H, q), 2.43 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.42 (3H, t)
1-162	(300MHz/CDCl ₃) 8.51 (1H, d), 7.65 (1H, d), 7.46 (2H, s), 2.89 (1H, sep), 2.36 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.33 (6H, d)
1-164	(300MHz/CDCl ₃) 8.80 (1H, s), 7.88 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.90 (1H, sep), 2.39 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.33 (6H, d)
1-165	(300MHz/CDCl ₃) 8.41 (1H, s), 7.76 (2H, s), 2.90 (1H, sep), 2.7 (2H, q), 2.28 (3H, s), 1.33 (6H, d), 1.24 (3H, t)
1-166	(500MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, s), 7.75 (2H, s), 4.36 (2H, q), 2.77 (2H, q), 2.06 (3H, s), 1.44 (3H, t), 1.25 (3H, t)
1-168	(300MHz/CDCl ₃) 8.43 (1H, s), 7.04 (2H, s), 2.90 (1H, sep), 2.69 (2H, q), 2.28 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.33 (6H, d), 1.23 (3H, t)
1-170	(300MHz/CDCl ₃) 8.73 (1H, d), 7.63 (2H, m), 7.44 (1H, d), 2.94 (1H, sep), 2.72 (2H, q), 2.25 (3H, s), 1.36 (6H, d), 1.25 (3H, t)
1-171	(300MHz/CDCl ₃) 8.35 (1H, s), 7.45 (2H, s), 2.89 (1H, sep), 2.68 (2H, q), 2.15 (6H, s), 1.33 (6H, d), 1.22 (3H, t), 0.99-0.78 (5H, m)

[0334]

[表36]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-172	(300MHz/CDCl ₃) 8.28 (1H, q), 7.45 (2H, s), 2.94 (1H, sep), 2.69 (2H, q), 2.16 (6H, s), 2.05 (3H, d), 1.36 (6H, d), 1.23 (3H, t)
1-173	(300MHz/CDCl ₃) 8.25 (1H, s), 7.46 (2H, s), 2.91 (1H, sep), 2.71 (2H, q), 2.19 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.29 (6H, d), 1.23 (3H, t)
1-174	(300MHz/CDCl ₃) 8.22 (1H, s), 7.46 (2H, s), 3.14 (1H, sep), 2.90 (1H, sep), 2.19 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.28 (6H, d), 1.24 (6H, d)
1-175	(300MHz/CDCl ₃) 8.53 (1H, s), 7.44 (2H, s), 2.95 (1H, sep), 2.11 (6H, s), 1.37 (6H, d), 0.93 (5H, m)
1-176	(300MHz/CDCl ₃) 8.42 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.60 (1H, d), 4.37 (2H, q), 2.79 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.47 (3H, t), 1.25 (3H, t)
1-177	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.44 (1H, d), 2.95 (1H, sep), 2.71 (2H, q), 2.16 (6H, s), 1.35 (6H, d), 1.23 (3H, t)
1-178	(300MHz/CDCl ₃) 8.32 (1H, d), 7.44 (2H, s), 5.90 (1H, d), 3.92 (3H, s), 2.97 (1H, sep), 2.68 (2H, q), 2.17 (6H, s), 1.33 (6H, d), 1.22 (3H, t)
1-179	(300MHz/CDCl ₃) 8.41 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.34 (1H, d), 2.92 (1H, sep), 2.70 (2H, q), 2.55 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.33 (6H, d), 1.23 (3H, t)
1-180	(300MHz/CDCl ₃) 8.27 (1H, d), 7.45 (2H, s), 5.98 (1H, d), 4.56 (2H, q), 2.89 (1H, sep), 2.68 (2H, q), 2.17 (6H, s), 1.32 (6H, d), 1.23 (3H, t)
1-181	(300MHz/CDCl ₃) 8.48 (1H, d), 7.47 (2H, s), 6.91 (1H, d), 2.92 (1H, sep), 2.90 (3H, s), 2.71 (2H, q), 2.17 (6H, s), 1.32 (6H, d), 1.24 (3H, t)
1-182	(500MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, d), 7.47 (2H, s), 6.26 (1H, d), 2.90 (1H, sep), 2.33 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.31 (6H, d)
1-183	(300MHz/CDCl ₃) 8.51 (1H, d), 7.43 (2H, s), 6.24 (1H, d), 4.33 (2H, q), 2.34 (3H, s), 2.12 (6H, s), 1.41 (3H, t), 0.96 (5H, m)
1-184	(300MHz/CDCl ₃) 8.41 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.70 (1H, t), 6.65 (1H, d), 2.89 (1H, sep), 2.72 (2H, q), 2.18 (6H, s), 1.29 (6H, d), 1.24 (3H, t)
1-186	(300MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 7.60 (2H, s), 2.44 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-187	(300MHz/CDCl ₃) 9.22 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.75 (2H, q), 2.40 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.32 (3H, t)

[0335]

[表37]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-188	(300MHz/CDCl ₃) 9.20 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.70 (2H, t), 2.39 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.81 (2H, sext), 1.07 (3H, t)
1-189	(300MHz/CDCl ₃) 9.20 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.71 (2H, t), 2.39 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.76 (2H, quin), 1.49 (2H, sext), 0.99 (3H, t)
1-190	(300MHz/CDCl ₃) 9.18 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.60 (2H, d), 2.39 (3H, s), 2.12-2.31 (1H, m), 2.17 (6H, s), 1.08 (6H, d)
1-191	(300MHz/CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.78 (1H, sext), 2.40 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.61-1.96 (2H, m), 1.37 (3H, d), 1.05 (3H, t)
1-192	(300MHz/CDCl ₃) 9.31 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.47 (2H, s), 3.59 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-193	(300MHz/CDCl ₃) 9.11 (1H, s), 7.47 (2H, s), 7.14-7.25 (1H, m), 2.39 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.94-1.99 (6H, m)
1-194	(300MHz/CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 7.46 (2H, s), 2.40 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.90-2.00 (1H, m), 1.16-1.29 (4H, m)
1-195	(300MHz/CDCl ₃) 9.18 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.45-3.54 (1H, m), 2.34-2.61 (7H, m), 1.96-2.19 (8H, m)
1-196	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.11 (1H, quin), 2.39 (3H, s), 1.94-2.19 (10H, m), 1.65-1.86 (4H, m)
1-197	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.66-2.77 (1H, m), 2.38 (3H, s), 2.08-2.19 (8H, m), 1.81-1.94 (2H, m), 1.22-1.78 (6H, m)
1-198	(300MHz/CDCl ₃) 8.40-8.42 (1H, m), 7.18-7.24 (3H, m), 6.61 (1H, d), 3.33 (2H, q), 2.65 (2H, q), 2.55 (2H, t), 2.12 (3H, s), 1.56-1.70 (2H, m), 1.13-1.23 (6H, m)
1-199	(300MHz/CDCl ₃) 8.47 (1H, q), 7.47 (3H, m), 2.88 (1H, sep), 2.70 (2H, q), 1.29 (6H, d), 1.25 (3H, t)
1-204	(300MHz/CDCl ₃) 8.79 (1H, dd), 8.15 (1H, dd), 7.91 (1H, dd), 6.75 (1H, dd), 3.64 (3H, s), 2.39 (3H, s)
1-205	(300MHz/CDCl ₃) 8.80 (1H, d), 8.19 (1H, d), 7.91 (1H, d), 6.75 (1H, d), 3.62 (3H, s), 2.76 (2H, q), 1.24 (3H, t)
1-206	(500MHz/CDCl ₃) 7.98 (1H, s), 7.90 (1H, d), 7.70 (1H, dd), 7.52 (1H, d), 6.75 (1H, d), 3.62 (3H, s), 2.79 (2H, q), 1.23 (3H, t)

[0336]

[表38]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-207	(300MHz/CDCl ₃) 7.79 (1H, d), 7.75 (2H, s), 7.68 (1H, d), 3.69 (3H, s), 2.78 (2H, q), 1.25 (3H, t)
1-208	(300MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, s), 7.42 (2H, s), 3.87 (2H, q), 6.56 (6H, s), 1.42 (3H, t), 1.38 (9H, s)
1-209	(300MHz/CDCl ₃) 8.82 (1H, dd), 8.17 (1H, dd), 7.96 (1H, dd), 6.74 (1H, dd), 4.76 (2H, brs), 3.46 (3H, s), 2.83 (2H, q), 1.29 (3H, t)
1-210	(300MHz/CDCl ₃) 9.10 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.45 (3H, s), 2.60 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-211	(300MHz/CDCl ₃) 8.97 (1H, s), 7.46 (2H, s), 4.91 (2H, s), 2.51 (3H, s), 2.16 (6H, s)
1-212	(300MHz/CDCl ₃) 9.28 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.01 (3H, s), 2.45 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-213	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.30 (2H, t), 2.45 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.85 (2H, sext), 1.07 (3H, t)
1-214	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.46 (2H, s), 4.34 (2H, t), 2.45 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.80 (2H, quin), 1.50 (2H, sext), 1.00 (3H, t)
1-215	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.47 (2H, s), 5.00 (1H, sep), 2.45 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.46 (6H, d)
1-216	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.47 (2H, s), 5.98-6.11 (1H, m), 5.39-5.53 (2H, m), 4.79-4.82 (2H, m), 2.45 (3H, s), 2.16 (6H, s)
1-217	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.47 (2H, s), 7.12 (2H, d), 2.45 (3H, s), 2.08-2.21 (7H, m), 1.05 (6H, d)
1-218	(300MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.02 (2H, s), 2.46 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.06 (9H, s)
1-219	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.31-7.50 (7H, m), 5.34 (2H, s), 2.43 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-220	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.47-4.50 (2H, m), 3.73-3.76 (2H, m), 3.46 (3H, s), 2.45 (3H, s), 2.16 (6H, s)
1-221	(300MHz/CDCl ₃) 9.32 (1H, s), 7.48 (2H, s), 5.87 (2H, s), 2.46 (3H, s), 2.16 (6H, s)

[0337]

[表39]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-222	(300MHz/CDCl ₃) 9.30 (1H, s), 7.48 (2H, s), 4.60 (2H, t), 3.87 (2H, t), 2.46 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-223	(300MHz/CDCl ₃) 9.32 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.48 (1H, q), 2.46 (3H, s), 2.17 (6H, s), 2.00 (3H, d)
1-224	(300MHz/CDCl ₃) 8.85 (1H, d), 8.54 (1H, s), 8.22 (1H, d), 2.90 (1H, sep), 2.73 (2H, q), 1.35 (6H, d), 1.26 (3H, t)
1-225	(300MHz/CDCl ₃) 8.87 (1H, d), 8.84 (1H, d), 8.22 (1H, d), 8.01 (1H, d), 3.12 (3H, s), 2.88 (1H, sep), 2.74 (2H, q), 1.31 (6H, d), 1.27 (3H, t)
1-227	(300MHz/CDCl ₃) 8.84 (1H, d), 8.37 (1H, s), 8.18 (1H, d), 5.67 (1H, s), 4.26 (2H, m), 3.97 (2H, m), 3.01 (1H, sep), 2.71 (2H, q), 2.24 (1H, m), 1.44 (1H, m), 1.31 (6H, d), 1.24 (3H, t)
1-228	(300MHz/CDCl ₃) 10.0 (1H, s), 8.85 (1H, d), 8.37 (1H, d), 8.22 (1H, d), 6.94 (1H, d), 2.90 (1H, sep), 2.75 (2H, q), 1.29 (6H, d), 1.28 (3H, t)
1-229	(300MHz/CDCl ₃) 8.84 (1H, d), 8.37 (1H, d), 8.19 (1H, d), 8.08 (1H, s), 6.75 (1H, d), 3.99 (3H, s), 2.89 (1H, sep), 2.72 (2H, q), 1.29 (6H, d), 1.26 (3H, t)
1-230	(300MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, d), 7.47 (2H, s), 6.37 (1H, d), 4.46 (2H, s), 3.34 (3H, s), 2.92 (1H, sep), 2.17 (6H, s), 1.35 (6H, d)
1-231	(300MHz/CDCl ₃) 8.43 (1H, d), 7.78 (1H, s), 7.53 (1H, s), 6.36 (2H, m), 5.80 (1H, d), 5.38 (1H, d), 2.95 (1H, sep), 2.71 (2H, q), 2.18 (3H, s), 1.36 (6H, d), 1.23 (3H, t)
1-232	(300MHz/CDCl ₃) 8.41 (1H, d), 8.16 (1H, d), 7.84 (1H, d), 6.69 (1H, d), 2.89 (1H, sep), 2.73 (2H, q), 1.28 (6H, d), 1.26 (3H, t)
1-234	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.96 (1H, sep), 2.39 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.40 (6H, d)
1-242	(300MHz/CDCl ₃) 9.23 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.43 (2H, q), 2.46 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.51 (3H, t)
1-243	(300MHz/CDCl ₃) 9.22 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.40 (2H, q), 3.25 (1H, sep), 2.16 (6H, s), 1.47 (3H, t), 1.28 (6H, d)
1-250	(300MHz/CDCl ₃) 8.47 (1H, s), 7.62 (1H, s), 7.45 (2H, s), 2.89 (1H, sep), 2.36 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.33 (6H, d)
1-265	(300MHz/CDCl ₃) 8.40 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.36 (1H, d), 3.13 (1H, sep), 2.94 (1H, sep), 2.15 (6H, s), 1.35 (6H, d), 1.24 (6H, d)

[0338]

[表40]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-272	(300MHz/CDCl ₃) 8.55 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.38 (1H, d), 4.35 (2H, d), 3.24 (1H, sep), 2.15 (6H, s), 1.44 (3H, t), 1.27 (6H, d)
1-279	(500MHz/CDCl ₃) 8.88 (1H, d), 8.42 (1H, d), 8.25 (1H, d), 6.68 (1H, d), 3.38 (1H, s), 2.89 (1H, sep), 2.72 (2H, q), 1.22-1.31 (9H, m)
1-280	(500MHz/CDCl ₃) 8.73 (1H, d), 8.43 (1H, d), 7.72 (1H, d), 6.68 (1H, d), 2.89 (1H, sep), 2.75 (2H, q), 1.76-1.83 (1H, m), 1.25-1.29 (9H, m), 0.70-1.00 (4H, m)
1-281	(500MHz/CDCl ₃) 9.01 (1H, d), 8.32-8.38 (2H, m), 6.67 (1H, d), 2.88 (1H, sep), 2.78 (2H, q), 2.52 (3H, s), 1.23-1.29 (9H, m)
1-283	(500MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.71 (2H, t), 2.95 (2H, t), 2.40 (3H, s), 2.23-2.29 (2H, m), 2.17 (6H, s)
1-285	(500MHz/CDCl ₃) 9.19 (1H, s), 7.46 (2H, s), 2.70-2.73 (2H, m), 2.39 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.58-1.90 (9H, m), 1.11-1.22 (2H, m)
1-286	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.48 (2H, s), 2.89-3.10 (4H, m), 2.44 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-288	(300MHz/CDCl ₃) 9.28 (1H, s), 7.25-7.51 (6H, m), 4.20 (2H, s), 2.38 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-289	(300MHz/CDCl ₃) 9.22 (1H, s), 7.47 (2H, s), 7.30-7.39 (2H, m), 6.95-7.08 (3H, m), 5.21 (1H, q), 2.09-2.22 (9H, m), 1.89 (3H, d)
1-290	(500MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 7.47 (2H, s), 5.20-5.26 (1H, m), 2.44 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.82-2.05 (6H, m), 1.67-1.74 (2H, m)
1-291	(300MHz/CDCl ₃) 9.38 (1H, s), 7.21-7.49 (6H, m), 2.53 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-301	(300MHz/CDCl ₃) 9.12 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.68 (1H, dd), 6.21-6.45 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.18 (6H, s)
1-302	(300MHz/CDCl ₃) 8.33 (1H, d), 7.43 (2H, s), 5.96 (1H, m), 5.34 (2H, m), 4.39 (2H, m), 2.15 (6H, s), 1.37 (9H, s)
1-303	(500MHz/CDCl ₃) 9.12 (1H, d), 7.47 (2H, s), 5.97-6.05 (1H, m), 5.40-5.50 (2H, m), 4.75-4.81 (2H, m), 3.23 (1H, sep), 2.15 (6H, s), 1.25 (6H, d)
1-304	(500MHz/CDCl ₃) 8.29 (1H, s), 7.45 (2H, s), 5.89-5.95 (1H, m), 5.40 (1H, d), 5.34 (1H, d), 4.61 (2H, d), 2.19 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.37 (9H, s)

[0339]

[表41]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-305	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 2.95 (1H, sep), 2.72 (2H, q), 2.01-2.02 (6H, m), 1.38 (6H, d), 1.24 (3H, t)
1-308	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.20-7.47 (7H, m), 3.05-3.11 (4H, m), 2.64 (3H, s), 2.16 (6H, s)
1-309	(500MHz/CDCl ₃) 9.35 (1H, s), 8.15 (1H, d), 7.93 (1H, d), 7.80-7.87 (1H, m), 7.64 (1H, t), 7.59 (1H, t), 7.52-7.55 (2H, m), 7.48 (2H, s), 2.58 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-310	(500MHz/CDCl ₃) 9.22 (1H, s), 7.46 (2H, s), 3.86 (3H, s), 3.36 (3H, s), 2.45 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-312	(500MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.91 (1H, d), 7.63-7.65 (2H, m), 7.44-7.51 (5H, m), 6.66 (1H, d), 2.44 (3H, s), 2.19 (6H, s)
1-313	(500MHz/CDCl ₃) 9.35 (1H, s), 8.15 (1H, d), 7.93 (1H, d), 7.80-7.87 (1H, m), 7.64 (1H, t), 7.59 (1H, t), 7.52-7.55 (2H, m), 7.48 (2H, s), 2.58 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-318	(300MHz/CDCl ₃) 9.29 (1H, s), 7.48 (2H, s), 2.47 (3H, s), 2.20 (6H, s), 2.05 (6H, s)
1-319	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.46 (2H, s), 3.19 (3H, s), 3.01 (3H, s), 2.44 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-320	(300MHz/CDCl ₃) 9.11 (1H, s), 7.46 (2H, s), 3.53 (2H, q), 3.35 (2H, q), 2.48 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.34 (3H, t), 1.19 (3H, t)
1-321	(300MHz/CDCl ₃) 9.21 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.54-3.87 (8H, m), 2.43 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-322	(300MHz/CDCl ₃) 9.13 (1H, s), 7.46 (2H, s), 3.36 (2H, t), 3.43 (2H, t), 2.45 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.96-2.09 (4H, m)
1-323	(300MHz/CDCl ₃) 9.28 (1H, s), 7.47 (2H, s), 7.42 (4H, s), 5.30 (2H, s), 2.43 (3H, s), 2.16 (6H, s)
1-324	(500MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.93-4.03 (2H, m), 3.80-3.85 (1H, m), 3.54-3.57 (1H, m), 2.74-2.86 (3H, m), 2.39 (3H, s), 1.67-1.74 (1H, m), 2.19-2.29 (1H, m), 2.17 (6H, s)
1-325	(500MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.47 (2H, s), 6.37 (1H, q), 2.16 (3H, s), 2.14 (3H, s), 1.97 (3H, d), 1.38 (9H, s)
1-326	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.47 (2H, s), 7.36 (2H, d), 7.23 (2H, d), 5.30 (2H, s), 2.42 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.16 (6H, s)

[0340]

[表42]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-327	(300MHz/CDCl ₃) 8.64 (1H, d), 7.46 (2H, d), 6.48 (1H, q), 6.39 (1H, d), 2.44 (3H, s), 2.17 (6H, s), 2.00 (3H, d)
1-329	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.48 (2H, s), 7.29 (5H, m), 4.54 (2H, t), 3.14 (2H, t), 2.40 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-330	(300MHz/CDCl ₃) 9.33 (1H, s), 7.48 (2H, s), 5.82 (1H, s), 4.17 (2H, t), 3.67 (2H, t), 2.49 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-338	(300MHz/CDCl ₃) 9.17 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.71 (2H, t), 2.39 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.81 (2H, sext), 1.08 (3H, t)
1-339	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.61 (2H, d), 2.40 (3H, s), 2.20-2.31 (1H, m), 2.17 (6H, s), 1.10 (6H, d)
1-340	(300MHz/CDCl ₃) 9.11 (1H, s), 7.47 (2H, s), 2.79 (1H, sext), 2.39 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.70-1.94 (2H, m), 1.38 (3H, d), 1.05 (3H, t)
1-341	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.03 (3H, s), 2.45 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-342	(300MHz/CDCl ₃) 9.23 (1H, s), 7.47 (2H, s), 6.05 (1H, ddt), 5.40-5.54 (2H, m), 4.80-4.83 (2H, m), 2.46 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-343	(300MHz/CDCl ₃) 9.13 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.15 (1H, sep), 2.70 (2H, t), 2.15 (6H, s), 1.81 (2H, sext), 1.26 (6H, d), 1.07 (3H, t)
1-344	(300MHz/CDCl ₃) 9.11 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.17 (1H, sep), 2.60 (2H, d), 2.19-2.28 (1H, m), 2.15 (6H, s), 1.26 (6H, d), 1.08 (6H, d)
1-345	(300MHz/CDCl ₃) 9.06 (1H, s), 7.47 (2H, s), 3.14 (1H, sep), 2.79 (1H, sext), 2.15 (6H, s), 1.59-1.98 (2H, m), 1.35 (3H, d), 1.26 (6H, d), 1.03 (3H, t)
1-346	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.01 (3H, s), 3.25 (1H, sep), 2.16 (6H, s), 1.28 (6H, d)
1-347	(300MHz/CDCl ₃) 9.22 (1H, s), 7.47 (2H, s), 6.12 (1H, ddt), 5.40-5.52 (2H, m), 4.78-4.81 (2H, m), 3.25 (1H, sep), 2.15 (6H, s), 1.30 (6H, d)
1-348	(300MHz/CDCl ₃) 8.48 (1H, d), 7.45 (2H, d), 6.37 (1H, d), 2.68 (2H, t), 2.37 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.78 (2H, sext), 1.05 (3H, t)
1-349	(300MHz/CDCl ₃) 8.48 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.37 (1H, d), 2.60 (2H, d), 2.37 (3H, s), 2.16-2.28 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.07 (6H, d)

[0341]

[表43]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-350	(300MHz/CDCl ₃) 8.41 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.36 (1H, d), 2.76 (1H, sext), 2.37 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.56-1.97 (2H, m), 1.35 (3H, d), 1.01 (3H, t)
1-351	(300MHz/CDCl ₃) 8.60 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.39 (1H, d), 4.00 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-352	(300MHz/CDCl ₃) 8.58 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.38 (1H, d), 6.12 (1H, ddt), 5.36-5.51 (2H, m), 4.78-4.81 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.16 (6H, s)
1-353	(300MHz/CDCl ₃) 8.42 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.36 (1H, d), 3.15 (1H, sep), 2.67 (2H, t), 2.15 (6H, s), 1.77 (2H, sext), 1.25 (6H, d), 1.04 (3H, t)
1-354	(300MHz/CDCl ₃) 8.40 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.36 (1H, d), 3.13 (1H, sep), 2.59 (2H, d), 2.15-2.25 (1H, m), 2.15 (6H, s), 1.35 (6H, d), 1.24 (6H, d)
1-355	(300MHz/CDCl ₃) 8.58 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.38 (1H, d), 3.15 (1H, sep), 2.77 (1H, sext), 2.19 (6H, s), 1.81-1.95 (1H, m), 1.54-1.68 (1H, m), 1.34 (3H, d), 1.25 (6H, d), 1.00 (3H, t)
1-356	(300MHz/CDCl ₃) 8.58 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.39 (1H, d), 3.97 (3H, s), 3.24 (1H, sep), 2.15 (6H, s), 1.28 (6H, d)
1-357	(300MHz/CDCl ₃) 8.56 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.38 (1H, d), 6.10 (1H, ddt), 5.36-5.50 (2H, m), 4.75-4.78 (2H, m), 3.26 (1H, sep), 2.15 (6H, s), 1.27 (6H, d)
1-358	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.75 (1H, t), 2.96 (1H, sep), 2.40 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.36 (6H, d)
1-359	(300MHz/CDCl ₃) 9.36 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.77 (1H, t), 4.38 (2H, q), 2.47 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.43 (3H, t)
1-360	(300MHz/CDCl ₃) 9.30 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.76 (1H, t), 2.70 (2H, t), 2.41 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.79 (2H, sext), 1.05 (3H, t)
1-361	(300MHz/CDCl ₃) 9.28 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.76 (1H, t), 2.61 (2H, d), 2.40 (3H, s), 2.14-2.27 (1H, m), 2.18 (6H, s), 1.07 (6H, d)
1-362	(300MHz/CDCl ₃) 9.21 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.75 (1H, t), 2.78 (1H, sext), 2.40 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.61-1.95 (2H, m), 1.33 (3H, d), 1.01 (3H, t)
1-363	(300MHz/CDCl ₃) 9.39 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.78 (1H, t), 3.98 (3H, s), 2.47 (3H, s), 2.18 (6H, s)
1-364	(300MHz/CDCl ₃) 9.37 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.76 (1H, t), 6.03 (1H, ddt), 5.39-5.51 (2H, m), 4.76-4.79 (2H, m), 2.47 (3H, s), 2.18 (6H, s)

[表44]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-365	(300MHz/CDCl ₃) 9.21 (1H, s), 7.47 (2H, s), 6.75 (1H, t), 3.14 (1H, sep), 2.95 (1H, sep), 2.16 (6H, s), 1.37 (6H, d), 1.27 (6H, d)
1-366	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.47 (2H, s), 6.76 (1H, t), 3.16 (1H, sep), 2.68 (2H, t), 2.16 (6H, s), 1.76 (2H, sext), 1.27 (6H, d), 1.03 (3H, t)
1-367	(300MHz/CDCl ₃) 9.23 (1H, s), 7.47 (2H, s), 6.76 (1H, t), 3.16 (1H, sep), 2.60 (2H, d), 2.10-2.22 (1H, m), 2.18 (6H, s), 1.27 (6H, d), 1.05 (6H, d)
1-368	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.47 (2H, s), 6.75 (1H, t), 3.14 (1H, sep), 2.77 (1H, sext), 2.17 (6H, s), 1.53-1.94 (2H, m), 1.32 (3H, d), 1.27 (6H, d), 0.99 (3H, t)
1-369	(300MHz/CDCl ₃) 9.37 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.78 (1H, t), 3.95 (3H, s), 3.27 (1H, sep), 2.17 (6H, s), 1.32 (6H, d)
1-370	(300MHz/CDCl ₃) 9.36 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.76 (1H, t), 5.98 (1H, ddt), 5.38-5.50 (2H, m), 4.73-4.76 (2H, m), 3.24 (1H, sep), 2.17 (6H, s), 1.32 (6H, d)
1-371	(500MHz/CDCl ₃) 8.46 (1H, d), 7.85 (1H, s), 7.71 (1H, q), 7.60 (1H, d), 6.68 (1H, d), 2.72 (2H, q), 2.62 (2H, t), 1.66-1.74 (2H, m), 1.24 (3H, t), 1.00 (3H, t)
1-372	(300MHz/CDCl ₃) 8.54-8.55 (1H, m), 7.46 (2H, s), 6.24 (1H, d), 4.34 (2H, q), 2.42 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.42 (3H, t)
1-373	(300MHz/CDCl ₃) 8.41-8.43 (1H, m), 7.45 (2H, s), 6.23 (1H, d), 2.64 (2H, q), 2.36 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.71-1.83 (2H, m), 1.04 (3H, t)
1-374	(300MHz/CDCl ₃) 8.40 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.23 (1H, d), 2.54 (2H, d), 2.37 (3H, s), 2.33 (3H, s), 2.14-2.25 (7H, m), 1.04 (6H, d)
1-375	(300MHz/CDCl ₃) 8.34 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.23 (1H, d), 2.71-2.78 (1H, m), 2.39 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.80-1.94 (1H, m), 1.55-1.69 (1H, m), 1.29 (3H, d), 1.26 (3H, t)
1-376	(300MHz/CDCl ₃) 8.57 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.25 (1H, d), 3.95 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-377	(300MHz/CDCl ₃) 8.55 (1H, s), 7.46 (2H, s), 6.25 (1H, d), 5.95-6.09 (1H, m), 5.35-5.50 (2H, m), 4.71-4.79 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.33 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-378	(300MHz/CDCl ₃) 8.33 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.22 (1H, d), 3.09-3.18 (1H, m), 2.87-2.97 (1H, m), 2.32 (3H, s), 2.11 (6H, s), 1.31 (6H, d), 1.23 (6H, d)
1-379	(300MHz/CDCl ₃) 8.51 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.23 (1H, d), 4.30 (2H, q), 3.19-3.29 (1H, m), 2.34 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.40 (3H, t), 1.25 (6H, d)

[0343]

[表45]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz／溶媒) δ 値ppm
1-380	(300MHz／CDCl ₃) 8.36 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.22 (1H, d), 3.10-3.20 (1H, m), 2.64 (2H, t), 2.33 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.67-1.81 (2H, m), 1.23 (6H, d), 0.88 (3H, t)
1-381	(300MHz／CDCl ₃) 8.33 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.22 (1H, d), 3.10-3.20 (1H, m), 2.53 (2H, d), 2.35 (3H, s), 2.10-2.25 (7H, m), 1.25 (6H, d), 1.05 (6H, d)
1-382	(300MHz／CDCl ₃) 8.28 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.22 (1H, d), 3.09-3.21 (1H, m), 2.69-2.78 (1H, m), 2.30 (3H, s), 2.15 (6H, s), 1.79-1.94 (1H, m), 1.53-1.68 (1H, m), 1.18-1.38 (9H, m), 0.98 (3H, t)
1-383	(300MHz／CDCl ₃) 8.55 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.24 (1H, d), 3.92 (3H, s), 3.19-3.29 (1H, m), 2.35 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.25 (6H, d)
1-384	(300MHz／CDCl ₃) 8.51 (1H, d), 7.45 (2H, s), 6.34 (1H, d), 5.91-6.10 (1H, m), 5.34-5.49 (2H, m), 4.69-4.77 (2H, m), 3.17-3.30 (1H, m), 2.33 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.25 (6H, d)
1-385	(300MHz／CDCl ₃) 8.59-8.61 (1H, m), 7.67 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.34 (2H, q), 2.42 (3H, s), 2.20 (6H, s), 1.42 (3H, t)
1-386	(300MHz／CDCl ₃) 8.49 (1H, d), 7.63 (1H, d), 7.46 (2H, s), 2.63 (2H, t), 2.37 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.71-1.83 (2H, m), 1.04 (3H, t)
1-387	(300MHz／CDCl ₃) 8.48 (1H, d), 7.63 (1H, d), 7.46 (2H, s), 2.52 (2H, d), 2.37 (3H, s), 2.14-2.28 (7H, m), 1.05 (6H, d)
1-388	(300MHz／CDCl ₃) 8.44 (1H, d), 7.62 (1H, d), 7.46 (2H, s), 2.68-2.79 (1H, m), 2.39 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.79-1.92 (1H, m), 1.55-1.69 (1H, m), 1.30 (3H, d), 1.02 (3H, t)
1-389	(300MHz／CDCl ₃) 8.61 (1H, d), 7.68 (1H, d), 7.47 (2H, s), 3.94 (3H, s), 2.43 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-390	(300MHz／CDCl ₃) 8.61 (1H, s), 7.66 (1H, s), 7.48 (2H, s), 5.93-6.04 (1H, m), 5.32-5.50 (2H, m), 4.72-4.83 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-391	(300MHz／CDCl ₃) 8.12 (1H, d), 7.65 (1H, d), 7.46 (2H, s), 2.84-2.95 (1H, m), 2.36 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.32 (6H, d)
1-392	(300MHz／CDCl ₃) 8.63-8.64 (1H, m), 7.70 (1H, s), 7.47 (2H, s), 4.34 (2H, q), 2.43 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.41 (3H, t)
1-393	(300MHz／CDCl ₃) 8.53 (1H, d), 7.66 (1H, d), 7.46 (2H, s), 2.63 (2H, t), 2.37 (3H, s), 2.16 (6H, s), 1.70-1.84 (2H, m), 1.04 (3H, t)
1-394	(300MHz／CDCl ₃) 8.52 (1H, d), 7.66 (1H, d), 7.46 (2H, s), 2.53 (2H, d), 2.37 (3H, s), 2.14-2.39 (7H, m), 1.04 (6H, d)

[0344]

[表46]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-395	(300MHz/CDCl ₃) 8.48 (1H, d), 7.64 (1H, d), 7.46 (2H, s), 2.65-2.77 (1H, m), 2.39 (3H, s), 2.19 (6H, s), 1.78-1.96 (1H, m), 1.55-1.69 (1H, m), 1.31 (3H, d), 1.01 (3H, t)
1-396	(300MHz/CDCl ₃) 8.66 (1H, d), 7.71 (1H, d), 7.47 (2H, s), 3.94 (3H, s), 2.43 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-397	(300MHz/CDCl ₃) 8.64 (1H, d), 7.68 (1H, d), 7.49 (2H, s), 5.92-6.06 (1H, m), 5.37-5.51 (2H, m), 4.74-4.78 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.21 (6H, s)
1-398	(300MHz/CDCl ₃) 8.41 (1H, d), 7.32-7.38 (2H, m), 7.24-7.28 (1H, m), 6.34 (1H, d), 2.93 (1H, sep), 2.69 (2H, q), 2.52 (3H, s), 1.34 (6H, d), 1.23 (3H, t)
1-399	(300MHz/CDCl ₃) 8.40 (1H, d), 7.58-7.97 (3H, m), 6.36 (1H, d), 2.94 (1H, sep), 2.80 (3H, s), 2.70 (2H, q), 1.35 (6H, d), 1.25 (3H, t)
1-400	(300MHz/CDCl ₃) 8.39 (1H, d), 8.16 (1H, d), 8.01 (1H, dd), 7.68 (1H, d), 6.37 (1H, d), 3.12 (3H, s), 2.94 (1H, sep), 2.70 (2H, q), 1.35 (6H, d), 1.24 (3H, t)
1-401	(300MHz/CDCl ₃) 8.44 (1H, d), 7.94 (2H, dd), 6.37 (1H, d), 2.95 (1H, sep), 2.81 (3H, s), 2.38 (3H, s), 1.36 (6H, d)
1-402	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, d), 7.28 (2H, s), 6.34 (1H, d), 3.10 (1H, sep), 2.92 (1H, sep), 2.52 (3H, s), 1.33 (6H, d), 1.24 (6H, d)
1-403	(300MHz/CDCl ₃) 8.40 (1H, d), 7.76 (2H, dd), 7.61 (1H, d), 3.11 (1H, sep), 2.88 (1H, sep), 2.83 (3H, s), 1.31 (6H, d), 1.25 (6H, d)
1-404	(300MHz/CDCl ₃) 8.38 (1H, d), 7.95 (2H, dd), 6.36 (1H, d), 3.13 (1H, sep), 2.94 (1H, sep), 2.83 (3H, s), 1.34 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-406	(300MHz/CDCl ₃) 8.40 (1H, d), 8.25 (2H, s), 7.62 (1H, d), 3.05-3.19 (4H, m), 2.89 (1H, sep), 1.31 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-407	(300MHz/CDCl ₃) 8.37 (1H, d), 7.74 (2H, dd), 6.36 (1H, d), 3.12 (1H, sep), 2.94 (1H, sep), 2.83 (3H, s), 1.34 (6H, d), 1.25 (6H, d)
1-408	(300MHz/CDCl ₃) 8.37-8.46 (1H, m), 7.28 (2H, s), 6.68 (1H, d), 3.11 (1H, sep), 2.88 (1H, sep), 2.52 (3H, s), 1.28 (6H, d), 1.25 (6H, d)
1-409	(300MHz/CDCl ₃) 8.37-8.43 (1H, m), 7.75 (2H, dd), 6.69 (1H, d), 3.14 (1H, sep), 2.89 (1H, sep), 2.83 (3H, s), 1.28 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-410	(300MHz/CDCl ₃) 8.37-8.42 (1H, m), 8.06 (2H, s), 6.69 (1H, d), 3.15 (3H, s), 3.14 (1H, sep), 2.90 (1H, sep), 1.28 (6H, d), 1.26 (6H, d)

[表47]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz／溶媒) δ 値ppm
1-411	(300MHz／CDCl ₃) 8.39-8.46 (1H, m), 7.48 (2H, s), 6.68 (1H, d), 3.12 (1H, sep), 2.88 (1H, sep), 2.52 (3H, s), 1.28 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-412	(300MHz／CDCl ₃) 8.39-8.44 (1H, m), 7.95 (2H, dd), 6.69 (1H, d), 3.14 (1H, sep), 2.90 (1H, sep), 2.83 (3H, s), 1.28 (6H, d), 1.27 (6H, d)
1-413	(300MHz／CDCl ₃) 8.37-8.43 (1H, m), 8.26 (2H, s), 6.69 (1H, d), 3.10-3.19 (4H, m), 2.90 (1H, m), 1.28 (6H, d), 1.27 (6H, d)
1-414	(500MHz／CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.46 (2H, s), 5.93-6.02 (1H, m), 5.45 (1H, dd), 5.39 (1H, d), 4.72 (2H, d), 2.15 (6H, s), 1.38 (9H, s)
1-415	(300MHz／CDCl ₃) 8.69 (1H, d), 7.69 (1H, d), 7.47 (2H, s), 5.85 (2H, s), 2.43 (3H, s), 2.17 (6H, d)
1-416	(300MHz／CDCl ₃) 8.57 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.92 (1H, q), 6.24 (1H, d), 3.16-3.29 (1H, m), 2.35 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.94 (3H, d), 1.26 (6H, d)
1-417	(300MHz／CDCl ₃) 8.60 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.46 (1H, m), 6.25 (1H, d), 2.41 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.95 (3H, d)
1-418	(300MHz／CDCl ₃) 9.43 (1H, s), 7.49 (2H, s), 6.79 (1H, t), 6.41 (1H, q), 3.23 (1H, sep), 2.17 (6H, d), 1.97 (3H, d), 1.30 (6H, d)
1-419	(300MHz／CDCl ₃) 9.43 (1H, s), 7.49 (2H, s), 6.79 (1H, t), 6.45 (1H, q), 2.48 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.98 (3H, d)
1-420	(300MHz／CDCl ₃) 9.29 (1H, s), 7.49 (2H, s), 6.45 (1H, q), 3.18-3.29 (1H, m), 2.16 (6H, s), 2.01 (3H, d), 1.28 (6H, d)
1-421	(300MHz／CDCl ₃) 8.67 (1H, d), 7.68 (1H, d), 7.47 (2H, s), 6.47 (1H, q), 2.44 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.94 (3H, d)
1-422	(300MHz／CDCl ₃) 9.29 (1H, s), 7.48 (2H, s), 6.48 (1H, q), 2.47 (3H, s), 2.17 (6H, s), 2.01 (3H, d)
1-423	(300MHz／CDCl ₃) 8.71 (1H, d), 7.71 (1H, d), 7.47 (2H, s), 6.47 (1H, q), 2.44 (3H, s), 2.17 (6H, s), 1.94 (3H, d)
1-424	(300MHz／CDCl ₃) 8.73 (1H, d), 7.17 (1H, d), 7.47 (2H, s), 5.85 (2H, s), 2.44 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-425	(300MHz／CDCl ₃) 9.30 (1H, s), 7.49 (2H, s), 5.89 (2H, s), 2.47 (3H, s), 2.17 (6H, s)

[0346]

[表48]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-426	(300MHz/CDCl ₃) 9.30 (1H, s), 7.49 (2H, s), 5.87 (2H, s), 3.18-3.28 (1H, m), 2.16 (6H, s), 1.26 (6H, d)
1-427	(300MHz/CDCl ₃) 9.45 (1H, s), 7.49 (2H, s), 6.79 (1H, t), 5.86 (2H, s), 2.48 (3H, s), 2.18 (6H, s)
1-428	(300MHz/CDCl ₃) 9.45 (1H, s), 7.49 (2H, s), 6.79 (1H, t), 5.83 (2H, s), 3.23 (1H, sep), 2.17 (6H, s), 1.30 (6H, d)
1-429	(300MHz/CDCl ₃) 8.65 (1H, d), 7.47 (2H, s), 6.40 (1H, d), 5.87 (2H, s), 2.44 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-430	(300MHz/CDCl ₃) 8.63 (1H, d), 7.47 (2H, s), 6.39 (1H, d), 5.84 (2H, s), 3.21 (1H, sep), 2.15 (6H, s), 1.28 (6H, d)
1-431	(300MHz/CDCl ₃) 8.62 (1H, d), 7.46 (2H, s), 6.26 (1H, d), 5.58 (2H, s), 2.44 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.17 (6H, s)
1-432	(300MHz/CDCl ₃) 8.51 (1H, d), 7.47 (2H, s), 6.27 (1H, d), 5.81 (2H, s), 3.11-3.28 (1H, m), 2.32 (3H, s), 2.18 (6H, s), 1.27 (6H, d)
1-433	(300MHz/CDCl ₃) 9.19 (1H, s), 7.36 (2H, s), 2.95 (1H, sep), 2.37 (3H, s), 2.08 (6H, s), 1.38 (6H, d)
1-434	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.36 (2H, s), 4.41 (2H, q), 2.44 (3H, s), 2.08 (6H, s), 1.47 (3H, t)
1-435	(300MHz/CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 7.36 (2H, s), 3.11 (1H, sep), 2.95 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.37 (6H, d), 1.24 (6H, d)
1-436	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.36 (2H, s), 4.38 (2H, q), 3.23 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.46 (3H, t), 1.26 (6H, d)
1-437	(300MHz/CDCl ₃) 8.97 (1H, s), 7.35 (2H, s), 2.91 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.36 (9H, s), 1.33 (6H, d)
1-438	(300MHz/CDCl ₃) 9.18 (1H, s), 7.36 (2H, s), 4.32 (2H, q), 2.07 (6H, s), 1.37 (9H, s), 1.43 (3H, t)
1-439	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.34 (2H, s), 2.97 (1H, sep), 1.96-2.08 (7H, m), 1.39 (6H, d), 0.90-1.03 (4H, m)
1-440	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.34 (2H, s), 4.41 (2H, q), 2.08-2.20 (1H, m), 2.03 (6H, s), 1.47 (3H, t), 0.91-1.07 (4H, m)

[0347]

[表49]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-441	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.35 (2H, s), 2.97 (1H, sep), 2.05 (6H, s), 1.43 (3H, s), 1.39 (6H, d), 0.86-0.99 (2H, m), 0.67-0.76 (2H, m)
1-442	(300MHz/CDCl ₃) 9.29 (1H, s), 7.35 (2H, s), 4.39 (2H, q), 2.05 (6H, s), 1.46 (3H, t), 1.44 (3H, s), 0.94-1.02 (2H, m), 0.71-0.80 (2H, m)
1-443	(300MHz/CDCl ₃) 9.17 (1H, s), 7.36 (2H, s), 2.95 (1H, sep), 2.66 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.69 (2H, tq), 1.37 (6H, d), 0.97 (3H, t)
1-444	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.36 (2H, s), 4.39 (2H, q), 2.74 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.72 (2H, tq), 1.46 (3H, t), 0.98 (3H, t)
1-445	(300MHz/CDCl ₃) 9.17 (1H, s), 7.36 (2H, s), 2.95 (1H, sep), 2.68 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.63 (2H, tt), 1.30-1.45 (8H, m), 0.93 (3H, t)
1-446	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.36 (2H, s), 4.39 (2H, q), 2.75 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.66 (2H, tt), 1.46 (3H, t), 1.38 (2H, tq), 0.93 (3H, t)
1-447	(300MHz/CDCl ₃) 9.17 (1H, s), 7.36 (2H, s), 2.94 (1H, sep), 2.67 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.57-1.72 (2H, m), 1.23-1.41 (10H, m), 0.83-0.94 (3H, m)
1-448	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.36 (2H, s), 4.39 (2H, q), 2.74 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.59-1.74 (2H, m), 1.46 (3H, t), 1.23-1.40 (4H, m), 0.82-0.93 (3H, m)
1-449	(300MHz/CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 7.35 (2H, s), 3.14-3.28 (1H, m), 2.94 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.87-2.01 (2H, m), 1.45-1.86 (6H, m), 1.36 (6H, d)
1-450	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.35 (2H, s), 4.38 (2H, q), 3.22-3.39 (1H, m), 1.91-2.11 (8H, m), 1.59-1.88 (6H, m), 1.45 (3H, t)
1-451	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.35 (2H, s), 2.95 (1H, sep), 2.65-2.80 (1H, m), 2.06 (6H, s), 1.65-1.94 (5H, m), 1.14-1.50 (11H, m)
1-452	(300MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 7.35 (2H, s), 4.38 (2H, q), 2.75-2.94 (1H, m), 2.06 (6H, s), 1.64-1.96 (5H, m), 1.14-1.51 (8H, m)
1-453	(300MHz/CDCl ₃) 9.15 (1H, s), 7.36 (2H, s), 2.96 (1H, sep), 2.38 (3H, s), 2.08 (6H, s), 1.39 (6H, d)
1-454	(300MHz/CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 7.36 (2H, s), 4.41 (2H, q), 2.44 (3H, s), 2.08 (6H, s), 1.48 (3H, t)
1-455	(300MHz/CDCl ₃) 9.11 (1H, s), 7.36 (2H, s), 3.11 (1H, sep), 2.95 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.37 (6H, d), 1.24 (6H, d)

[表50]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-456	(300MHz/CDCl ₃) 9.22 (1H, s), 7.36 (2H, s), 4.38 (2H, q), 3.24 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.47 (3H, t), 1.26 (6H, d)
1-457	(300MHz/CDCl ₃) 9.30 (1H, s), 7.37 (2H, s), 6.45 (1H, q), 2.80 (2H, q), 2.07 (6H, s), 2.01 (3H, d), 1.26 (3H, t)
1-458	(300MHz/CDCl ₃) 8.94 (1H, s), 7.35 (2H, s), 2.92 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.36 (9H, s), 1.34 (6H, d)
1-459	(300MHz/CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 7.35 (2H, s), 4.31 (2H, q), 2.06 (6H, s), 1.43 (3H, t), 1.37 (9H, s)
1-460	(300MHz/CDCl ₃) 9.13 (1H, s), 7.34 (2H, s), 2.98 (1H, sep), 1.95-2.06 (7H, m), 1.39 (6H, d), 0.89-1.02 (4H, m)
1-461	(300MHz/CDCl ₃) 9.22 (1H, s), 7.34 (2H, s), 4.41 (2H, q), 2.09-2.20 (1H, m), 2.03 (6H, s), 1.48 (3H, t), 0.92-1.07 (4H, m)
1-462	(300MHz/CDCl ₃) 9.13 (1H, s), 7.35 (2H, s), 2.98 (1H, sep), 2.04 (6H, s), 1.43 (3H, s), 1.39 (6H, d), 0.88-0.99 (2H, m), 0.68-0.75 (2H, m)
1-463	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.35 (2H, s), 4.39 (2H, q), 2.05 (6H, s), 1.47 (3H, t), 1.44 (3H, s), 0.94-1.03 (2H, m), 0.72-0.79 (2H, m)
1-464	(300MHz/CDCl ₃) 9.21 (1H, s), 7.36 (2H, s), 6.75 (1H, t), 3.10 (1H, sep), 2.93 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.33 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-465	(300MHz/CDCl ₃) 9.34 (1H, s), 7.36 (2H, s), 6.76 (1H, t), 4.33 (2H, q), 3.24 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.41 (3H, t), 1.26 (6H, d)
1-466	(300MHz/CDCl ₃) 9.35 (1H, s), 7.36 (2H, s), 6.75 (1H, t), 6.00 (1H, ddt), 5.37-5.49 (2H, m), 4.72-4.74 (2H, m), 3.24 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.28 (6H, d)
1-467	(300MHz/CDCl ₃) 9.44 (1H, s), 7.38 (2H, s), 6.78 (1H, t), 6.41 (1H, q), 2.81 (2H, q), 2.09 (6H, s), 1.96 (3H, d), 1.27 (3H, t)
1-468	(300MHz/CDCl ₃) 8.64 (1H, d), 7.35 (2H, s), 6.46 (1H, q), 6.38 (1H, d), 2.43 (3H, s), 2.08 (6H, s), 1.99 (3H, d)
1-469	(300MHz/CDCl ₃) 8.54 (1H, d), 7.34 (2H, s), 6.37 (1H, d), 6.33 (1H, q), 2.06 (6H, d), 1.96 (3H, d), 1.37 (9H, s)
1-470	(300MHz/CDCl ₃) 8.57 (1H, d), 7.34 (2H, s), 6.37 (1H, d), 4.35 (2H, q), 2.05 (6H, s), 1.44 (3H, t), 1.43 (3H, s), 0.94-1.03 (2H, m), 0.69-0.78 (2H, m)

[0349]

[表51]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-471	(300MHz/CDCl ₃) 8.67 (1H, d), 7.34 (2H, s), 6.46 (1H, q), 6.38 (1H, d), 2.05 (6H, d), 1.99 (3H, d), 1.43 (3H, s), 0.87-1.09 (2H, m), 0.66-0.82 (2H, m)
1-474	(300MHz/CDCl ₃) 8.33 (1H, d), 7.34 (2H, s), 6.43 (1H, d), 3.11 (1H, sep), 2.93 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.34 (6H, d), 1.23 (6H, d)
1-478	(300MHz/CDCl ₃) 8.59 (1H, d), 7.35 (2H, s), 6.47 (1H, d), 6.43 (1H, q), 2.78 (2H, q), 2.07 (6H, d), 2.01 (3H, d), 1.25 (3H, t)
1-479	(300MHz/CDCl ₃) 8.64 (1H, d), 7.36 (2H, s), 6.73 (1H, t), 6.66 (1H, d), 6.36 (1H, q), 2.78 (2H, q), 2.09 (6H, d), 1.92 (3H, d), 1.25 (3H, t)
1-480	(500MHz/CDCl ₃) 8.30 (1H, d), 7.52 (1H, d), 7.34 (2H, s), 3.09 (1H, sep), 2.87 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.29 (6H, d), 1.22 (6H, d)
1-481	(500MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, d), 7.60 (1H, d), 7.34 (2H, s), 4.29 (2H, q), 3.20 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.38 (3H, t), 1.24 (6H, d)
1-482	(300MHz/CDCl ₃) 8.66 (1H, d), 7.66 (1H, d), 7.36 (2H, s), 6.44 (1H, q), 2.76 (2H, q), 2.08 (6H, d), 1.94 (3H, d), 1.24 (3H, t)
1-483	(300MHz/CDCl ₃) 8.45 (1H, d), 7.63 (1H, d), 7.34 (2H, s), 3.09 (1H, sep), 2.87 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.30 (6H, d), 1.23 (6H, d)
1-485	(300MHz/CDCl ₃) 8.47 (1H, d), 7.64 (1H, d), 7.32 (2H, s), 2.90 (1H, sep), 2.03 (6H, s), 1.93-2.01 (1H, m), 1.32 (6H, d), 0.87-0.98 (4H, m)
1-487	(300MHz/CDCl ₃) 8.70 (1H, d), 7.69 (1H, d), 7.35 (2H, s), 6.44 (1H, q), 2.76 (2H, q), 2.08 (6H, d), 1.93 (3H, d), 1.24 (3H, t)
1-488	(300MHz/CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 7.19 (2H, s), 3.11 (1H, sep), 2.95 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.38 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-489	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.20 (2H, s), 4.39 (2H, q), 3.23 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.45 (3H, t), 1.27 (6H, d)
1-490	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.20 (2H, s), 6.01 (1H, ddt), 5.39-5.51 (2H, m), 4.76-4.79 (2H, m), 3.23 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.27 (6H, d)
1-491	(500MHz/CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 6.89 (2H, s), 3.11 (1H, sep), 2.94 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.36 (6H, d), 1.25 (6H, d)
1-492	(500MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 6.90 (2H, d), 4.37 (2H, q), 3.23 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.45 (3H, t), 1.26 (6H, d)

[0350]

[表52]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz／溶媒) δ 値ppm
1-493	(300MHz／CDCl ₃) 9.21 (1H, s), 7.36 (2H, s), 3.15 (1H, sep), 2.42 (3H, s), 2.06 (6H, s), 1.25 (6H, d)
1-495	(300MHz／CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.35 (2H, s), 3.13 (1H, sep), 2.69 (2H, t), 2.06 (6H, s), 1.70-1.80 (2H, m), 1.21-1.48 (12H, m), 0.91 (3H, t)
1-496	(300MHz／CDCl ₃) 9.10 (1H, s), 7.35 (2H, s), 3.18 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.89-2.00 (1H, m), 1.12-1.36 (10H, m)
1-498	(300MHz／CDCl ₃) 9.17 (1H, s), 7.36 (2H, s), 3.86 (3H, s), 3.35 (3H, s), 3.23 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.27 (6H, d)
1-499	(300MHz／CDCl ₃) 9.21 (1H, s), 7.21-7.38 (7H, m), 2.99-3.15 (4H, m), 2.87 (1H, sep), 2.05 (6H, s), 1.13 (6H, d)
1-500	(300MHz／CDCl ₃) 9.22 (1H, m), 7.18-7.38 (7H, m), 3.02-3.18 (4H, m), 2.02 (6H, s), 1.63-1.78 (1H, m), 0.77-0.92 (4H, m)
1-504	(300MHz／CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.36 (2H, s), 5.94-6.12 (1H, m), 5.33-5.56 (2H, m), 4.72-4.86 (2H, m), 3.23 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.26 (6H, d)
1-506	(300MHz／CDCl ₃) 9.09 (1H, s), 7.35 (2H, s), 3.12 (1H, sep), 2.68-2.84 (1H, m), 2.06 (6H, s), 1.53-1.97 (2H, m), 1.35 (3H, d), 1.24 (6H, d), 1.02 (3H, t)
1-507	(300MHz／CDCl ₃) 9.11 (1H, s), 7.33 (2H, s), 2.71-2.86 (1H, m), 1.98-2.08 (7H, m), 1.59-1.98 (2H, m), 1.37 (3H, d), 1.03 (3H, t), 0.91-1.00 (4H, m)
1-508	(300MHz／CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 7.35 (2H, s), 3.13 (1H, sep), 2.59 (2H, d), 2.12-2.29 (1H, m), 2.06 (6H, s), 1.24 (6H, d), 1.06 (6H, d)
1-512	(300MHz／CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.35 (2H, s), 3.13 (1H, sep), 2.70 (2H, t), 2.06 (6H, s), 1.66-1.80 (2H, m), 1.38-1.53 (2H, m), 1.24 (6H, d), 0.99 (3H, t)
1-514	(300MHz／CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.35 (2H, s), 3.13 (1H, sep), 2.69 (2H, t), 2.06 (6H, s), 1.68-1.82 (2H, m), 1.33-1.49 (4H, m), 1.24 (6H, d), 0.90-0.99 (3H, m)
1-532	(300MHz／CDCl ₃) 8.34 (1H, d), 7.33 (2H, s), 6.34 (1H, d), 3.11 (1H, sep), 2.69-2.80 (1H, m), 2.06 (6H, s), 1.55-1.93 (2H, m), 1.31 (3H, d), 1.23 (6H, d), 0.99 (3H, t)
1-557	(300MHz／CDCl ₃) 8.37 (1H, d), 7.34 (2H, s), 6.43 (1H, d), 2.93 (1H, sep), 2.64 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.68 (2H, tq), 1.34 (6H, d), 0.96 (3H, t)
1-558	(300MHz／CDCl ₃) 8.51 (1H, d), 7.34 (2H, s), 6.45 (1H, d), 4.35 (2H, q), 2.72 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.71 (2H, tq), 1.45 (3H, t), 0.97 (3H, t)

[表53]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz／溶媒) δ 値ppm
1-559	(300MHz／CDCl ₃) 8.37 (1H, d), 7.34 (2H, s), 6.43 (1H, d), 2.93 (1H, sep), 2.66 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.62 (2H, tt), 1.30-1.42 (8H, m), 0.92 (3H, t)
1-566	(300MHz／CDCl ₃) 8.63 (1H, s), 7.67 (1H, s), 7.35 (2H, s), 4.31 (2H, q), 2.73 (2H, t), 2.07 (6H, s), 1.65 (2H, tt), 1.30-1.45 (5H, m), 0.92 (3H, t)
1-569	(300MHz／CDCl ₃) 9.14 (1H, s), 7.56 (2H, s), 3.11 (1H, sep), 2.94 (1H, sep), 2.04 (6H, s), 1.37 (6H, d), 1.25 (6H, d)
1-570	(300MHz／CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.57 (2H, s), 6.02 (1H, ddt), 5.38-5.51 (2H, m), 4.76-4.79 (2H, m), 3.22 (1H, sep), 2.04 (6H, s), 1.27 (6H, d)
1-571	(300MHz／CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.57 (2H, s), 4.39 (2H, q), 3.23 (1H, sep), 2.04 (6H, s), 1.45 (3H, t), 1.27 (6H, d)
1-589	(300MHz／CDCl ₃) 8.56-8.62 (1H, m), 7.35 (2H, s), 6.70 (1H, d), 5.90-6.03 (1H, m), 5.34-5.46 (2H, m), 4.69 (2H, d), 3.23 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.26 (6H, d)
1-595	(300MHz／CDCl ₃) 8.88 (1H, s), 7.88 (1H, s), 7.36 (2H, s), 5.88-6.02 (1H, m), 5.35-5.48 (2H, m), 4.67-4.76 (2H, m), 3.22 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.26 (6H, d)
1-596	(300MHz／CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.36 (2H, s), 6.74 (1H, t), 2.94 (1H, sep), 2.39 (3H, s), 2.09 (6H, s), 1.35 (6H, d)
1-597	(300MHz／CDCl ₃) 9.37 (1H, s), 7.37 (2H, s), 6.75 (1H, t), 6.02 (1H, ddt), 5.38-5.51 (2H, m), 4.75-4.78 (2H, m), 2.46 (3H, s), 2.09 (6H, s)
1-598	(300MHz／CDCl ₃) 9.36 (1H, s), 7.37 (2H, s), 6.76 (1H, t), 4.37 (2H, q), 2.45 (3H, s), 2.09 (6H, s), 1.43 (3H, t)
1-599	(300MHz／CDCl ₃) 9.24 (1H, s), 7.36 (2H, s), 6.74 (1H, t), 2.94 (1H, sep), 2.74 (2H, q), 2.08 (6H, s), 1.34 (6H, d), 1.27 (3H, t)
1-600	(300MHz／CDCl ₃) 9.37 (1H, s), 7.37 (2H, s), 6.75 (1H, t), 6.01 (1H, ddt), 5.38-5.50 (2H, m), 4.73-4.76 (2H, m), 2.82 (2H, q), 2.08 (6H, s), 1.26 (3H, t)
1-601	(300MHz／CDCl ₃) 9.36 (1H, s), 7.37 (2H, s), 6.76 (1H, t), 4.35 (2H, q), 2.82 (2H, q), 2.09 (6H, s), 1.42 (3H, t), 1.26 (3H, t)
1-602	(300MHz／CDCl ₃) 9.23 (1H, s), 7.34 (2H, s), 6.75 (1H, t), 2.96 (1H, sep), 2.04 (6H, s), 1.97-2.01 (1H, m), 1.36 (6H, d), 0.95-1.00 (4H, m)
1-603	(300MHz／CDCl ₃) 9.35 (1H, s), 7.34 (2H, s), 6.76 (1H, t), 6.01 (1H, ddt), 5.38-5.50 (2H, m), 4.75-4.78 (2H, m), 2.11-2.19 (1H, m), 2.04 (6H, s), 0.97-1.04 (4H, m)

[表54]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-604	(300MHz/CDC1 ₃) 9.33 (1H, s), 7.34 (2H, s), 6.76 (1H, t), 4.37 (2H, q), 2.12-2.19 (1H, m), 2.04 (6H, s), 1.42 (3H, t), 0.97-1.04 (4H, m)
1-605	(300MHz/CDC1 ₃) 9.02 (1H, s), 7.35 (2H, s), 6.75 (1H, t), 2.89 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.37 (9H, s), 1.29 (6H, d)
1-606	(300MHz/CDC1 ₃) 9.26 (1H, s), 7.36 (2H, s), 6.76 (1H, t), 5.92 (1H, ddt), 5.35-5.45 (2H, m), 4.64-4.67 (2H, m), 2.07 (6H, s), 1.38 (9H, s)
1-607	(300MHz/CDC1 ₃) 9.25 (1H, s), 7.36 (2H, s), 6.77 (1H, t), 4.26 (2H, q), 2.07 (6H, s), 1.38 (9H, s), 1.36 (3H, t)
1-608	(300MHz/CDC1 ₃) 8.39 (1H, d), 7.18 (2H, s), 6.35 (1H, d), 3.11 (1H, sep), 2.93 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.35 (6H, d), 1.24 (6H, d)
1-609	(300MHz/CDC1 ₃) 8.42 (1H, d), 7.18 (2H, s), 6.68 (1H, d), 3.12 (1H, sep), 2.89 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.31 (6H, d), 1.25 (6H, d)
1-610	(300MHz/CDC1 ₃) 9.26 (1H, s), 7.20 (2H, s), 3.13 (1H, sep), 2.92 (1H, sep), 2.08 (6H, s), 1.33 (6H, d), 1.27 (6H, d)
1-611	(300MHz/CDC1 ₃) 9.21 (1H, d), 7.20 (2H, s), 6.75 (1H, t), 3.12 (1H, sep), 2.93 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.30 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-612	(300MHz/CDC1 ₃) 9.11 (1H, s), 7.19 (2H, s), 3.12 (1H, sep), 2.95 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.38 (6H, d), 1.26 (6H, d)
1-613	(300MHz/CDC1 ₃) 8.55 (1H, d), 7.18 (2H, s), 6.37 (1H, d), 4.35 (2H, q), 3.22 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.43 (3H, t), 1.26 (6H, d)
1-614	(300MHz/CDC1 ₃) 8.58 (1H, d), 7.19 (2H, s), 6.69 (1H, d), 4.29 (2H, q), 3.24 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.38 (3H, t), 1.27 (6H, d)
1-615	(300MHz/CDC1 ₃) 9.38 (1H, s), 7.21 (2H, s), 4.34 (2H, q), 3.24 (1H, sep), 2.08 (6H, s), 1.41 (3H, t), 1.28 (6H, d)
1-616	(300MHz/CDC1 ₃) 9.34 (1H, s), 7.20 (2H, s), 6.76 (1H, t), 4.33 (2H, q), 3.24 (1H, sep), 2.08 (6H, s), 1.41 (3H, t), 1.28 (6H, d)
1-617	(300MHz/CDC1 ₃) 9.22 (1H, s), 7.20 (2H, s), 4.39 (2H, q), 3.24 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.46 (3H, t), 1.27 (6H, d)
1-618	(300MHz/CDC1 ₃) 8.55 (1H, d), 7.18 (2H, s), 6.37 (1H, d), 6.04 (1H, ddt), 5.49-5.53 (2H, m), 4.74-4.77 (2H, m), 3.22 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.25 (6H, d)

[0353]

[表55]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
1-619	(300MHz/CDCl ₃) 8.60 (1H, d), 7.19 (2H, s), 6.69 (1H, d), 5.98 (1H, ddt), 5.33-5.46 (2H, m), 4.67-4.70 (2H, m), 3.23 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.29 (6H, d)
1-620	(300MHz/CDCl ₃) 9.39 (1H, s), 7.21 (2H, s), 5.99 (1H, ddt), 5.37-5.48 (2H, m), 4.72-4.75 (2H, m), 3.24 (1H, sep), 2.08 (6H, s), 1.28 (6H, d)
1-621	(300MHz/CDCl ₃) 8.35 (1H, s), 7.20 (2H, s), 6.75 (1H, t), 5.98 (1H, ddt), 5.37-5.49 (2H, m), 4.72-4.75 (2H, m), 3.24 (1H, sep), 2.07 (6H, s), 1.28 (6H, d)
1-622	(300MHz/CDCl ₃) 9.22 (1H, s), 7.20 (2H, s), 6.05 (1H, ddt), 5.39-5.52 (2H, m), 4.77-4.79 (2H, m), 3.23 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.27 (6H, d)
1-623	(300MHz/CDCl ₃) 9.27 (1H, s), 7.20 (2H, s), 4.42 (2H, q), 2.44 (3H, s), 2.08 (6H, s), 1.47 (3H, t)
1-624	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.17 (2H, s), 4.41 (2H, q), 2.03 (6H, s), 2.10-2.15 (1H, m), 1.46 (3H, t), 0.95-1.04 (4H, m)
1-625	(300MHz/CDCl ₃) 9.17 (1H, s), 7.19 (2H, s), 4.32 (2H, q), 2.06 (6H, s), 1.43 (3H, t), 1.37 (9H, s)
1-626	(300MHz/CDCl ₃) 9.26 (1H, s), 7.20 (2H, s), 6.06 (1H, ddt), 5.40-5.52 (2H, m), 4.79-4.82 (2H, m), 2.04 (3H, s), 1.58 (6H, s)
1-627	(300MHz/CDCl ₃) 9.25 (1H, s), 7.18 (2H, s), 6.05 (1H, ddt), 5.39-5.52 (2H, m), 4.79-4.82 (2H, m), 2.10-2.20 (1H, m), 2.03 (6H, s), 0.95-1.06 (4H, m)
1-628	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.19 (2H, s), 5.99 (1H, ddt), 5.37-5.47 (2H, m), 4.70-4.73 (2H, m), 2.06 (6H, s), 1.37 (9H, s)
1-629	(300MHz/CDCl ₃) 9.19 (1H, s), 7.19 (2H, s), 2.93 (1H, sep), 2.37 (3H, s), 2.08 (6H, s), 1.39 (6H, d)
1-630	(300MHz/CDCl ₃) 9.16 (1H, s), 7.17 (2H, s), 2.97 (1H, sep), 1.95-2.08 (7H, m), 1.38 (6H, d), 0.93-1.00 (4H, m)
1-631	(300MHz/CDCl ₃) 8.97 (1H, s), 7.19 (2H, s), 2.91 (1H, sep), 2.06 (6H, s), 1.36 (9H, s), 1.34 (6H, d)

[0354] [表56]

第3表 (続き)

No.	¹ H-NMR (300MHz又は500MHz/溶媒) δ 値ppm
2-1	(500MHz/CDCl ₃) 7.90 (2H, s), 7.44 (2H, s), 2.76 (1H, sep), 2.68 (2H, q), 2.21 (6H, s), 1.22-1.25 (9H, m)
2-3	(500MHz/CDCl ₃) 7.44 (2H, s), 2.80 (1H, sep), 2.60-2.63 (2H, m), 2.18 (6H, s), 1.65-1.72 (2H, m), 1.29 (6H, d), 0.96 (3H, t)

[0355] [表57]

第4表

No.	融点 (°C)
1-472	196.1
1-473	217.1
1-475	154.3
1-476	103.2
1-477	129.9
1-484	116.1
1-486	135.3
1-505	158.6
1-509	158.7
1-510	135.8
1-511	175.8
1-513	149.9
1-515	156.4
1-516	130.2
1-517	131.7

[0356] [表58]

第4表 (続き)

No.	融点 (°C)
1-518	126.6
1-519	169.1
1-520	135.8
1-521	137.5
1-523	104.5
1-524	124.4
1-526	168.1
1-527	146.2
1-529	86.5
1-531	174.2
1-533	142.9
1-534	130.8
1-535	145.8
1-536	134.5

[0357] [表59]

第4表 (続き)

No.	融点 (°C)
1-537	132.5
1-538	108.3
1-539	106.2
1-541	121.4
1-543	107.5
1-544	136.9
1-545	154.6
1-546	113.7
1-547	203.7
1-548	118.8
1-549	166
1-550	112.3
1-551	132.5
1-552	121.9
1-553	150.8

[0358] [表60]

第4表 (続き)

No.	融点 (°C)
1-554	92.3
1-555	143.2
1-561	93.5
1-563	101.9
1-564	133.7
1-572	171.5
1-573	168.2
1-575	140.5
1-580	140.6
1-581	123.4
1-582	157.5
1-584	160.5
1-585	199.4
1-586	181.5
1-587	136.6

[0359] [表61]

第4表 (続き)

No.	融点 (°C)
1-588	111.7
1-590	146.8
1-591	147.1
1-592	128.2
1-593	113.4
1-594	129

[0360] 試験例1 トビイロウンカに対する効果試験

供試化合物の濃度が200ppm又は50ppmとなるよう調製した薬液に、イネ幼苗を浸漬処理した。薬液が風乾した後に、湿った脱脂綿で根部を包んで試験管に入れた。この中にトビイロウンカ2～3齢幼虫を約10頭放虫し、管口をガーゼでふたをして25℃の照明付恒温室内に静置した。処理5日後にトビイロウンカの生死を判定し、下記の計算式により死虫率(%)を求めた。

[計算式]

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

その結果、前記化合物No. 1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、1-53、1-54、1-55、1-56、1-57、1-58、1-59、1-60、1-61、1-62、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-72、1-73、1-74

、 1-75、 1-76、 1-77、 1-78、 1-79、 1-80、 1-82、 1-83、 1-84、 1-85、 1-86、 1-87、 1-88、 1-89、 1-90、 1-91、 1-92、 1-93、 1-94、 1-95、 1-96、 1-97、 1-98、 1-99、 1-100、 1-101、 1-102、 1-103、 1-107、 1-108、 1-110、 1-111、 1-112、 1-113、 1-114、 1-115、 1-116、 1-117、 1-118、 1-119、 1-120、 1-121、 1-123、 1-124、 1-125、 1-126、 1-127、 1-128、 1-131、 1-132、 1-133、 1-134、 1-135、 1-136、 1-137、 1-138、 1-140、 1-141、 1-142、 1-143、 1-144、 1-145、 1-146、 1-147、 1-148、 1-149、 1-150、 1-151、 1-152、 1-153、 1-157、 1-158、 1-159、 1-161、 1-164、 1-165、 1-166、 1-172、 1-173、 1-174、 1-175、 1-178、 1-180、 1-183、 1-184、 1-186、 1-187、 1-188、 1-189、 1-190、 1-191、 1-192、 1-193、 1-194、 1-195、 1-196、 1-197、 1-199、 1-204、 1-205、 1-206、 1-207、 1-209、 1-210、 1-212、 1-213、 1-214、 1-215、 1-216、 1-217、 1-218、 1-219、 1-220、 1-221、 1-222、 1-223、 1-224、 1-227、 1-228、 1-230、 1-231、 1-232、 1-234、 1-242、 1-243、 1-250、 1-265、 1-272、 1-280、 1-283、 1-285、 1-286、 1-288、 1-290、 1-291、 1-301、 1-303、 1-304、 1-305、 1-308、 1-309、 1-310、 1-312、 1-313、 1-318、 1-321、 1-323、 1-325、 1-326、 1-327、 1-329、 1-330、 1-338、 1-339、 1-340、 1-341、 1-342、 1-343、 1-344、 1-345、 1-346、 1-347、 1-3

48、1-349、1-350、1-351、1-352、1-353、1-354、1-355、1-356、1-357、1-358、1-359、1-360、1-361、1-362、1-363、1-364、1-365、1-366、1-367、1-368、1-369、1-370、1-371、1-373、1-374、1-375、1-376、1-377、1-378、1-379、1-380、1-382、1-383、1-384、1-385、1-386、1-387、1-388、1-389、1-390、1-391、1-392、1-393、1-394、1-395、1-396、1-397、1-398、1-399、1-400、1-401、1-402、1-404、1-407、1-409、1-412、1-414、1-415、1-416、1-418、1-419、1-420、1-421、1-422、1-423、1-424、1-425、1-426、1-427、1-428、1-429、1-430、1-431、1-433、1-435、1-436、1-437、1-438、1-439、1-440、1-441、1-442、1-443、1-444、1-445、1-446、1-450、1-451、1-452、1-455、1-456、1-457、1-458、1-459、1-460、1-461、1-462、1-463、1-464、1-465、1-466、1-467、1-469、1-470、1-471、1-474、1-475、1-476、1-477、1-478、1-479、1-480、1-481、1-482、1-483、1-485、1-487、1-488、1-489、1-490、1-491、1-492、1-496、1-498、1-500、1-504、1-505、1-506、1-507、1-508、1-510、1-511、1-512、1-513、1-514、1-515、1-516、1-517、1-518、1-521、1-523、1-524、1-526、1-527、1-529、1-531、1-532、1-533、1-534、1-535、1-536、1-537、1-538、1-539、1-541、1-543、1-544、1-545、1

－546、1－548、1－550、1－551、1－552、1－553、1－554、1－555、1－557、1－558、1－563、1－564、1－569、1－570、1－571、1－572、1－573、1－580、1－581、1－584、1－586、1－587、1－588、1－589、1－590、1－591、1－592、1－596、1－597、1－598、1－599、1－600、1－601、1－602、1－604、1－605、1－608、1－609、1－610、1－611、1－612、1－613、1－614、1－615、1－616、1－617、1－618、1－619、1－620、1－621、1－622、1－623、1－624、1－625、1－628、1－629、1－630、1－631、2－1及び2－3が200ppmの濃度で80%以上の死虫率を示した。また、前記化合物No. 1－104、1－105、1－106、1－129、1－155、1－162、1－168、1－170、1－171、1－176、1－177、1－179、1－181、1－182、1－208、1－289、1－302、1－319、1－320、1－322、1－324、1－381、1－432、1－453、1－493、1－495、1－499、1－509、1－520、1－603、1－626及び1－627が50ppmの濃度で80%以上の死虫率を示した。

[0361] 試験例2 モモアカアブラムシに対する効果試験

試験管に水挿ししたダイコン葉上にモモアカアブラムシ成虫を5頭放虫した。1日後に成虫を取り除いた後、ダイコン葉上に寄生している幼虫数を供試虫数として数え、供試化合物の濃度が200ppm又は50ppmとなるように調製した薬液に浸漬処理した。薬液が風乾した後に、25℃の照明付恒温室内に静置した。処理5日後にモモアカアブラムシの生死を判定し、下記の計算式により死虫率(%)を求めた。尚、離脱虫及び異常虫は死亡虫とみなした。

[計算式]

$$\text{死虫率}(\%) = (\text{死亡虫数} / \text{供試虫数}) \times 100$$

その結果、前記化合物No. 1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-42、1-43、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、1-53、1-54、1-55、1-56、1-57、1-58、1-59、1-60、1-61、1-62、1-63、1-64、1-65、1-66、1-67、1-68、1-69、1-70、1-71、1-72、1-73、1-74、1-75、1-76、1-77、1-78、1-79、1-80、1-81、1-82、1-83、1-84、1-85、1-86、1-87、1-88、1-89、1-90、1-91、1-92、1-93、1-94、1-95、1-96、1-97、1-98、1-99、1-100、1-101、1-102、1-103、1-107、1-108、1-110、1-111、1-112、1-113、1-114、1-117、1-121、1-123、1-124、1-125、1-126、1-127、1-128、1-131、1-132、1-133、1-134、1-135、1-136、1-137、1-138、1-139、1-140、1-141、1-143、1-144、1-145、1-146、1-147、1-148、1-149、1-150、1-151、1-152、1-153、1-157、1-158、1-159、1-161、1-164、1-165、1-166、1-172、1-173、1-174、1-175、1-178、1-180、1-183、1-184、1-186、1-187、1-188、1-189、1-190、1-191、1-192、1-193、1-194、1-195、1-196、1-197、1-198、1-199、1-207、1-209、1-210、1-212、1-213、1-

214、1-215、1-216、1-217、1-218、1-219、
1-220、1-221、1-222、1-223、1-225、1-22
7、1-229、1-230、1-231、1-234、1-242、1-
243、1-250、1-265、1-272、1-279、1-280、
1-281、1-283、1-285、1-286、1-288、1-29
0、1-291、1-301、1-303、1-305、1-308、1-
309、1-310、1-312、1-313、1-318、1-321、
1-323、1-325、1-326、1-327、1-329、1-33
0、1-338、1-339、1-340、1-341、1-342、1-
343、1-344、1-345、1-346、1-347、1-348、
1-349、1-350、1-351、1-352、1-353、1-35
4、1-355、1-356、1-357、1-358、1-359、1-
360、1-361、1-362、1-363、1-364、1-365、
1-366、1-367、1-368、1-369、1-370、1-37
1、1-372、1-373、1-374、1-375、1-376、1-
377、1-378、1-380、1-382、1-383、1-385、
1-386、1-387、1-388、1-389、1-390、1-39
1、1-392、1-393、1-394、1-395、1-396、1-
397、1-399、1-402、1-403、1-404、1-406、
1-407、1-408、1-409、1-410、1-411、1-41
2、1-413、1-414、1-415、1-416、1-417、1-
418、1-419、1-420、1-421、1-422、1-423、
1-424、1-425、1-426、1-427、1-428、1-42
9、1-430、1-431、1-433、1-434、1-435、1-
436、1-437、1-438、1-439、1-440、1-441、
1-442、1-443、1-444、1-447、1-448、1-45
2、1-453、1-454、1-455、1-456、1-457、1-
458、1-459、1-460、1-461、1-462、1-463、

1-464、1-465、1-466、1-467、1-468、1-469、1-470、1-471、1-472、1-473、1-474、1-475、1-476、1-477、1-478、1-479、1-480、1-481、1-482、1-483、1-484、1-485、1-486、1-487、1-488、1-489、1-490、1-491、1-496、1-498、1-500、1-504、1-505、1-506、1-507、1-508、1-510、1-511、1-512、1-513、1-514、1-515、1-516、1-517、1-518、1-519、1-521、1-523、1-524、1-526、1-527、1-529、1-532、1-533、1-534、1-535、1-536、1-537、1-538、1-539、1-541、1-543、1-544、1-545、1-546、1-547、1-549、1-550、1-552、1-553、1-554、1-555、1-557、1-558、1-559、1-561、1-563、1-564、1-566、1-569、1-570、1-571、1-572、1-573、1-575、1-580、1-581、1-582、1-584、1-585、1-586、1-587、1-588、1-589、1-592、1-593、1-594、1-595、1-596、1-597、1-598、1-599、1-600、1-601、1-602、1-605、1-607、1-608、1-610、1-611、1-612、1-614、1-615、1-616、1-617、1-620、1-621、1-622、1-623、1-624、1-628、1-629、1-630及び1-631が200 ppmの濃度で80%以上の死虫率を示した。また、前記化合物No. 1-105、1-106、1-109、1-129、1-155、1-162、1-168、1-170、1-176、1-177、1-179、1-182、1-208、1-211、1-289、1-302、1-319、1-322、1-324、1-381、1-432、1-493、1-495、1-499、1-509、1-520、1-603、1-606、1-62

6及び1-627が50ppmの濃度で80%以上の死虫率を示した。

[0362] 試験例3 ナミハダニに対する効果試験

供試化合物の濃度が800ppm、200ppm又は50ppmとなるように調製した薬液に、予めナミハダニ成虫を約20頭放虫しておいたインゲン葉を浸漬処理した。薬液が風乾した後に、25℃の照明付恒温室内に静置した。処理3日後にナミハダニ成虫の生死を判定し、下記の計算式により殺成虫率(%)を求めた。尚、離脱した成虫及び異常虫は死亡虫とみなした。

[計算式]

$$\text{殺成虫率}(\%) = (\text{死亡虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

その結果、前記化合物No. 1-1、1-2、1-3、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-11、1-13、1-15、1-16、1-19、1-20、1-21、1-22、1-24、1-27、1-28、1-29、1-32、1-34、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-40、1-41、1-43、1-46、1-47、1-48、1-49、1-50、1-51、1-52、1-53、1-54、1-55、1-56、1-57、1-59、1-60、1-62、1-63、1-64、1-66、1-67、1-68、1-69、1-71、1-72、1-77、1-79、1-80、1-82、1-85、1-86、1-91、1-92、1-95、1-96、1-97、1-102、1-103、1-107、1-108、1-124、1-126、1-131、1-132、1-133、1-134、1-135、1-136、1-137、1-138、1-140、1-141、1-144、1-146、1-151、1-153、1-157、1-172、1-174、1-178、1-189、1-199、1-231、1-243、1-265、1-283、1-301、1-303、1-329、1-343、1-344、1-345、1-346、1-347、1-350、1-353、1-354、1-355、1-356、1-357、1-368、1-369、1-371、1-378、1-379、1-380、1-382、1-388、1-414、1-

415、1-416、1-418、1-421、1-424、1-430、
 1-435、1-437、1-449、1-455、1-456、1-458、
 1-460、1-470、1-474、1-475、1-476、1-
 477、1-478、1-480、1-481、1-483、1-485、
 1-490、1-500、1-507、1-529、1-532、1-535、
 1-538、1-543、1-555、1-563、1-564及び1-
 605が200ppmの濃度で80%以上の殺成虫率を示した。また、前記化合物No. 1-155、1-176、1-177、1-179、1-182、1-302及び1-381が50ppmの濃度で80%以上の殺成虫率を示した。

[0363] 次に、本発明化合物と、本発明所定のジアリールピリダジノン構造を備えない比較用化合物との効果を比較した比較試験を記載する。

[0364] 比較試験例1

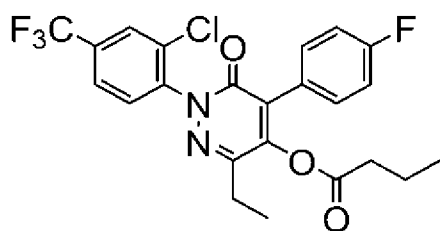
供試化合物の濃度が200ppm又は50ppmとなるよう調製した薬液に、イネ幼苗を浸漬処理した。薬液が風乾した後に、湿った脱脂綿で根部を包んで試験管に入れた。この中にトビイロウンカ2～3齢幼虫を約10頭放虫し、管口をガーゼでふたをして25℃の照明付恒温室内に静置した。処理5日後にトビイロウンカの生死を判定し、下記の計算式により死虫率(%)を求めた。

[計算式]

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

供試化合物は、本発明化合物として化合物No. 1-371を用い、比較用化合物として下記比較用化合物(A)を用いた。

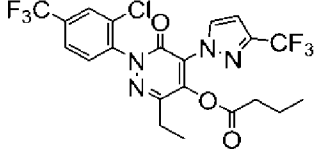
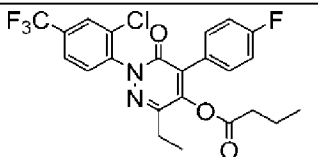
[0365] [化37]



[0366] 比較結果を下記第5表に示す。

[0367] [表62]

第5表

供試化合物	化学構造式	死虫率 (%)	
		有効成分濃度	
		200ppm	50ppm
化合物No. 1-371		100	100
比較用化合物 (A)		0	0

[0368] 次に製剤例を記載する。

[0369] 製剤例1

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

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

[0370] 製剤例2

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

以上のものを均一に混合して粉剤とする。

[0371] 製剤例3

- (1) 本発明化合物 20重量部

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

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

[0372] 製剤例4

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

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

[0373] 製剤例5

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

以上のものを均一に混合、粉碎した原液に更に

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

を加え均一に混合、造粒、乾燥して顆粒水和剤とする。

[0374] 製剤例6

- (1) 本発明化合物 5重量部
 - (2) ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル 1重量部
 - (3) ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸エステル 0.1重量部
 - (4) 粒状炭酸カルシウム 93.9重量部
- (1)～(3)を予め均一に混合し、適量のアセトンで希釈した後、(4)

に吹付け、アセトンを除去して粒剤とする。

[0375] 製剤例 7

- (1) 本発明化合物 2.5 重量部
- (2) N,N-ジメチルアセトアミド 2.5 重量部
- (3) 大豆油 95.0 重量部

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

[0376] 製剤例 8

- (1) 本発明化合物 10 重量部
- (2) ジエチレングリコールモノエチルエーテル 80 重量部
- (3) ポリオキシエチレンアルキルエーテル 10 重量部

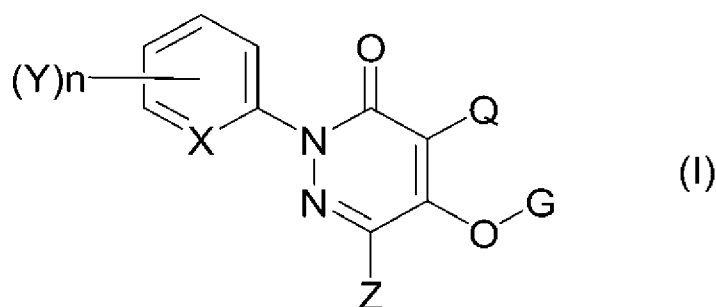
以上の成分を均一に混合し、液剤とする。

[0377] なお、2023年9月27日に出願された日本特許出願2023-166313号の明細書、特許請求の範囲および要約書の全内容をここに引用し、本発明の明細書の開示として、取り入れるものである。

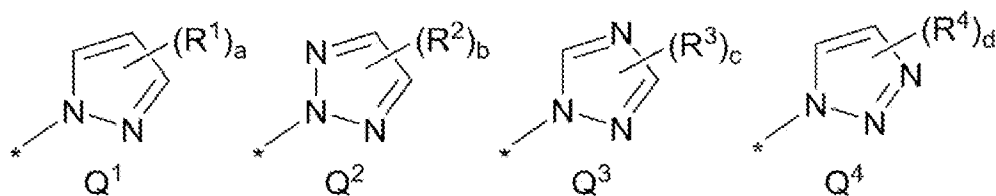
請求の範囲

[請求項1] 式 (I) :

[化1]

(式中、QはQ¹、Q²、Q³又はQ⁴ :

[化2]



(各式中、*は結合位置を示す) であり ;

XはCH、C(R^A)又はNであり ;

Y及びR^Aは各々ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、シアノ又は—C(=O)R^Bであり ;

Zはアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、シクロアルキルアルキル又はハロアルキルであり ;

R¹、R²、R³及びR⁴は各々ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、シクロアルキルオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、シアノ、ニトロ、アルデヒド、—CH(=NOR^C)、1,3-ジオキサン-2-イル又は1,3-ジオキソラン-2-イルであり ;

R^B は水素原子又はアルキルであり；

R^C はアルキルであり；

n は0～4の整数であり；

a は0～3の整数であり；

b 、 c 及び d は各々0、1又は2であり；

G は R^D で置換されてもよいアルキル、 $-C(=O)E$ 又はアルキルスルホニルであり；

R^D はアルコキシ、シアノ、アルコキシカルボニル又はアルコキシカルボニルオキシであり；

E はアルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ジアルキルアミノ、 N -アルコキシ- N -アルキルアミノ、 V^A で置換されてもよいフェニル、 V^A で置換されてもよいピリジル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルアルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシアルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルアルケニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ、 V^A で置換されてもよいナフチルオキシ、シクロアルキルアルコキシ、ヘテロシクロアルキルアルコキシ、 V^B で置換されてもよいフェニルアルコキシ、アルキルチオ又は2-イミダゾリジノンであり；

V^A はハロゲンであり；

V^B はハロゲン又はアルキルである）で表されるピリダジノン系化合物又はその塩。

[請求項2]

Y 及び R^A は各々ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルスルホニル、シアノ又は $-C(=O)R^B$ である請求項1に記載

のピリダジノン系化合物又はその塩。

[請求項3]

Y 及び R^Aは各々ハロゲン、(C₁–C₄) アルキル、(C₂–C₄) アルケニル、(C₂–C₄) アルキニル、(C₃–C₆) シクロアルキル、(C₁–C₄) ハロアルキル、(C₁–C₄) アルコキシ、(C₁–C₄) ハロアルコキシ、(C₁–C₄) アルキルチオ、(C₁–C₄) アルキルスルフィニル、(C₁–C₄) アルキルスルホニル、シアノ又は –C(=O)R^Bであり；

Zは(C₁–C₅) アルキル、(C₃–C₆) シクロアルキル、(C₁–C₄) アルコキシ(C₁–C₄) アルキル、(C₃–C₆) シクロアルキル(C₁–C₄) アルキル又は(C₁–C₄) ハロアルキルであり；

R¹、R²、R³及びR⁴は各々ハロゲン、(C₁–C₄) アルキル、(C₃–C₆) シクロアルキル、(C₁–C₄) ハロアルキル、(C₁–C₄) アルコキシ、(C₃–C₆) シクロアルキルオキシ、(C₁–C₄) ハロアルコキシ、(C₁–C₄) アルキルチオ、(C₁–C₄) アルキルスルフィニル、(C₁–C₄) アルキルスルホニル、(C₁–C₄) ハロアルキルチオ、(C₁–C₄) ハロアルキルスルフィニル、(C₁–C₄) ハロアルキルスルホニル、シアノ、ニトロ、アルデヒド、–CH(=NOR^C)、1, 3–ジオキサソ–2–イル又は1, 3–ジオキサラン–2–イルであり；

R^Bは水素原子又は(C₁–C₄) アルキルであり；

R^Cは(C₁–C₄) アルキルであり；

GはR^Dで置換されてもよい(C₁–C₄) アルキル、–C(=O)E 又は(C₁–C₄) アルキルスルホニルであり；

R^Dは(C₁–C₄) アルコキシ、シアノ、(C₁–C₄) アルコキシカルボニル又は(C₁–C₄) アルコキシカルボニルオキシであり；

Eは(C₁–C₈) アルキル、(C₂–C₈) アルケニル、(C₃–C₆) シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、(C₁–C₈) ハロアルキル、(C₂–C₈) ハロアルケニル、(C₁–C₄) ジアルキルアミ

ノ、 $N-(C_1-C_4)$ アルコキシ- $N-(C_1-C_4)$ アルキルアミノ、 V^A で置換されてもよいフェニル、 V^A で置換されてもよいピリジル、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、ヘテロシクロアルキル (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルチオ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_1-C_4) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ (C_1-C_3) アルキル、 V^A で置換されてもよいフェニル (C_2-C_4) アルケニル、 (C_1-C_7) アルコキシ、 (C_2-C_7) アルケニルオキシ、 (C_2-C_7) アルキニルオキシ、 (C_3-C_6) シクロアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、 (C_1-C_7) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_3) アルコキシ、 V^A で置換されてもよいフェニルオキシ、 V^A で置換されてもよいナフチルオキシ、 (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_3) アルコキシ、ヘテロシクロアルキル (C_1-C_3) アルコキシ、 V^B で置換されてもよいフェニル (C_1-C_3) アルコキシ、 (C_1-C_7) アルキルチオ又は2-イミダゾリジノンであり、当該Eにおけるヘテロシクロアルキル及びヘテロシクロアルキル部分は各々炭素原子以外に酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1種以上の原子を1つ以上含む3員～6員の基であり；
 V^B はハロゲン又は (C_1-C_4) アルキルである請求項1に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

[請求項4] Y 及び R^A は各々ハロゲン、 (C_1-C_4) アルキル、 (C_2-C_4) アルケニル、 (C_2-C_4) アルキニル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_4) ハロアルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) アルキルスルホニル、シアノ又は $-C(=O)R^B$ である請求項1に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

[請求項5] Z は (C_1-C_5) アルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 $(C_1$

—C₄) アルコキシ (C₁—C₄) アルキル又は (C₁—C₄) ハロアルキルであり；

R¹、R²、R³及びR⁴は各々ハロゲン、(C₁—C₄) アルキル、(C₃—C₆) シクロアルキル、(C₁—C₄) ハロアルキル、(C₁—C₄) アルコキシ、(C₁—C₄) ハロアルコキシ、(C₁—C₄) アルキルチオ、(C₁—C₄) アルキルスルフィニル、(C₁—C₄) アルキルスルホニル、シアノ、ニトロ、アルデヒド、—CH(=NOR^c) 又は 1, 3-ジオキソラン-2-イルであり；

Eは (C₁—C₈) アルキル、(C₂—C₈) アルケニル、(C₃—C₆) シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、(C₁—C₈) ハロアルキル、(C₁—C₄) ジアルキルアミノ、N—(C₁—C₄) アルコキシ—N—(C₁—C₄) アルキルアミノ、V^Aで置換されてもよいフェニル、V^Aで置換されてもよいピリジル、(C₃—C₆) シクロアルキル (C₁—C₄) アルキル、ヘテロシクロアルキル (C₁—C₄) アルキル、(C₁—C₄) アルコキシ (C₁—C₃) アルキル、(C₁—C₄) アルキルチオ (C₁—C₃) アルキル、V^Aで置換されてもよいフェニル (C₁—C₄) アルキル、V^Aで置換されてもよいフェニルオキシ (C₁—C₃) アルキル、V^Aで置換されてもよいフェニル (C₂—C₄) アルケニル、(C₁—C₇) アルコキシ、(C₂—C₇) アルケニルオキシ、(C₂—C₇) アルキニルオキシ、(C₃—C₆) シクロアルキルオキシ、(C₁—C₇) ハロアルコキシ、(C₁—C₄) アルコキシ (C₁—C₃) アルコキシ、V^Aで置換されてもよいフェニルオキシ、V^Aで置換されてもよいナフチルオキシ、V^Bで置換されてもよいフェニル (C₁—C₃) アルコキシ、(C₁—C₇) アルキルチオ又は 2-イミダゾリジノンであり、当該Eにおけるヘテロシクロアルキル及びヘテロシクロアルキル部分は各々炭素原子以外に酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる1種以上の原子を1つ以上含む3員～6員の基である請求項3に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。

- [請求項6] QはQ¹又はQ³である請求項1に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。
- [請求項7] XはC^H又はC(R^A)である請求項1に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。
- [請求項8] XはNである請求項1に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。
- [請求項9] XがC^Hの場合はnが1～3の整数であり、XがC(R^A)又はNの場合はnが1又は2である請求項1に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。
- [請求項10] a、b、c及びdが各々1又は2である請求項1に記載のピリダジノン系化合物又はその塩。
- [請求項11] 請求項1から10までのいずれか一項に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。
- [請求項12] 請求項1から10までのいずれか一項に記載の化合物又はその塩を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺土壌害虫剤。
- [請求項13] 請求項1から10までのいずれか一項に記載の化合物又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2024/031121

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D 401/14(2006.01)i; **A01N 43/58**(2006.01)i; **A01N 43/653**(2006.01)i; **A01N 47/02**(2006.01)i; **A01N 47/06**(2006.01)i; **A01N 47/24**(2006.01)i; **A01N 53/04**(2006.01)i; **A01P 5/00**(2006.01)i; **A01P 7/02**(2006.01)i; **A01P 7/04**(2006.01)i; **C07D 401/04**(2006.01)i; **C07D 403/04**(2006.01)i; **C07D 405/14**(2006.01)i

FI: C07D401/14 CSP; C07D401/04; C07D405/14; A01P7/04; A01P7/02; A01P5/00; A01N43/653 H; A01N53/04 200; A01N47/06 D; A01N43/58 D; A01N47/02; A01N47/24 G; C07D403/04

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D401/14; A01N43/58; A01N43/653; A01N47/02; A01N47/06; A01N47/24; A01N53/04; A01P5/00; A01P7/02; A01P7/04; C07D401/04; C07D403/04; C07D405/14

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

Published examined utility model applications of Japan 1922-1996
Published unexamined utility model applications of Japan 1971-2024
Registered utility model specifications of Japan 1996-2024
Published registered utility model applications of Japan 1994-2024

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

Caplus/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 11-152273 A (OTSUKA CHEMICAL CO., LTD.) 08 June 1999 (1999-06-08) claims, examples, particularly, compounds 31, 33	1-13
A	JP 63-185966 A (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) 01 August 1988 (1988-08-01) claims, examples	1-13
A	JP 2012-56903 A (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) 22 March 2012 (2012-03-22) claims, examples	1-13
A	JP 2012-512211 A (BAYER CROPSCIENCE AG) 31 May 2012 (2012-05-31) claims, examples	1-13

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
“D” document cited by the applicant in the international application
“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date
“L” document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

“T” later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

“X” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

“Y” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

“&” document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

05 November 2024

Date of mailing of the international search report

19 November 2024

Name and mailing address of the ISA/JP

**Japan Patent Office (ISA/JP)
3-4-3 Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915
Japan**

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2024/031121

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 2023/189602 A1 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) 05 October 2023 (2023-10-05) compounds of formulae (XXXIV), (XXXVII), (XXXVIII), paragraphs [0291], [0294], [0295]	1-10
P, A	claims, examples	11-13

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/JP2024/031121

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)			Publication date (day/month/year)
JP	11-152273	A	08 June 1999	(Family: none)			
JP	63-185966	A	01 August 1988	(Family: none)			
JP	2012-56903	A	22 March 2012	(Family: none)			
JP	2012-512211	A	31 May 2012	US	2010/0173775	A1	
				claims, examples			
				JP	2012-512209	A	
				US	2010/0184602	A1	
				US	2011/0003692	A1	
				WO	2010/069525	A1	
				WO	2010/069526	A1	
				WO	2010/078912	A1	
				EP	2204366	A1	
				EP	2379508	A1	
				EP	2379509	A1	
				AR	74773	A	
				AR	74774	A	
				AR	75673	A	
				CA	2747638	A	
				CA	2747639	A	
				AU	2009336854	A	
				AU	2009328607	A	
				CN	102325756	A	
				CN	102325757	A	
				BR	PI0922428	A	
				CN	105732513	A	
				CN	106928148	A	
				BR	PI0923035	A	
WO	2023/189602	A1	05 October 2023	TW	202402749	A	
				AR	128925	A	

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

C07D 401/14(2006.01)i; A01N 43/58(2006.01)i; A01N 43/653(2006.01)i; A01N 47/02(2006.01)i;
A01N 47/06(2006.01)i; A01N 47/24(2006.01)i; A01N 53/04(2006.01)i; A01P 5/00(2006.01)i;
A01P 7/02(2006.01)i; A01P 7/04(2006.01)i; C07D 401/04(2006.01)i; C07D 403/04(2006.01)i;
C07D 405/14(2006.01)i
FI: C07D401/14 CSP; C07D401/04; C07D405/14; A01P7/04; A01P7/02; A01P5/00; A01N43/653 H; A01N53/04
200; A01N47/06 D; A01N43/58 D; A01N47/02; A01N47/24 G; C07D403/04

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

C07D401/14; A01N43/58; A01N43/653; A01N47/02; A01N47/06; A01N47/24; A01N53/04; A01P5/00; A01P7/02;
A01P7/04; C07D401/04; C07D403/04; C07D405/14

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報1922-1996年
日本国公開実用新案公報1971-2024年
日本国実用新案登録公報1996-2024年
日本国登録実用新案公報1994-2024年

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

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	JP 11-152273 A（大塚化学株式会社）08.06.1999（1999-06-08） 特許請求の範囲、実施例、特に、化合物31, 33	1-13
A	JP 63-185966 A（日産化学工業株式会社）01.08.1988（1988-08-01） 特許請求の範囲、実施例	1-13
A	JP 2012-56903 A（住友化学株式会社）22.03.2012（2012-03-22） 特許請求の範囲、実施例	1-13
A	JP 2012-512211 A（バイエル・クロップサイエンス・アーゲー）31.05.2012（2012-05-31） 特許請求の範囲、実施例	1-13

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

* 引用文献のカテゴリー
“A” 特に関連のある文献ではなく、一般的技术水準を示すもの
“D” 国際出願で出願人が先行技術文献として記載した文献
“E” 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
“L” 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
“O” 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
“P” 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献

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

国際調査を完了した日
05.11.2024

国際調査報告の発送日
19.11.2024

名称及びあて先
日本国特許庁(ISA/JP)
〒100-8915
日本国
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

権限のある職員（特許庁審査官）

早乙女 智美 4P 3759

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

様式 PCT/ISA/210（第2ページ）（2022年7月）

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
P, X	WO 2023/189602 A1 (石原産業株式会社) 05.10.2023 (2023 - 10 - 05) 式 (XXXIV) の化合物、式 (XXXVII) の化合物、式 (XXXVIII) の化合物、段落 [0291], [0294], [0295]	1-10
P, A	特許請求の範囲、実施例	11-13

国際調査報告
パテントファミリーに関する情報

国際出願番号
PCT/JP2024/031121

引用文献			公表日	パテントファミリー文献	公表日
JP	11-152273	A	08.06.1999	(ファミリーなし)	
JP	63-185966	A	01.08.1988	(ファミリーなし)	
JP	2012-56903	A	22.03.2012	(ファミリーなし)	
JP	2012-512211	A	31.05.2012	US 2010/0173775 A1	
				特許請求の範囲、実施例	
				JP 2012-512209 A	
				US 2010/0184602 A1	
				US 2011/0003692 A1	
				WO 2010/069525 A1	
				WO 2010/069526 A1	
				WO 2010/078912 A1	
				EP 2204366 A1	
				EP 2379508 A1	
				EP 2379509 A1	
				AR 74773 A	
				AR 74774 A	
				AR 75673 A	
				CA 2747638 A	
				CA 2747639 A	
				AU 2009336854 A	
				AU 2009328607 A	
				CN 102325756 A	
				CN 102325757 A	
				BR PI0922428 A	
				CN 105732513 A	
				CN 106928148 A	
				BR PI0923035 A	
WO	2023/189602	A1	05.10.2023	TW 202402749 A	
				AR 128925 A	