

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2008-511596

(P2008-511596A)

(43) 公表日 平成20年4月17日(2008.4.17)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 261/04 (2006.01)	C O 7 D 261/04 C S P	4 C O 5 6
C O 7 D 413/14 (2006.01)	C O 7 D 413/14	4 C O 6 3
C O 7 D 413/12 (2006.01)	C O 7 D 413/12	4 H O 1 1
C O 7 D 261/08 (2006.01)	C O 7 D 261/08	
C O 7 D 417/12 (2006.01)	C O 7 D 417/12	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 191 頁) 最終頁に続く		

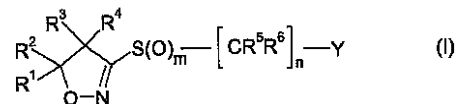
(21) 出願番号	特願2007-528958 (P2007-528958)	(71) 出願人	500371307
(86) (22) 出願日	平成17年8月17日 (2005. 8. 17)		シンジェンタ リミテッド
(85) 翻訳文提出日	平成19年4月19日 (2007. 4. 19)		イギリス国 サリー ジーユー2 7ワイ
(86) 国際出願番号	PCT/GB2005/003228		エイチ, ギルドフォード, サリー リサー
(87) 国際公開番号	W02006/024820		チ パーク, プリーストリー ロード, ユ
(87) 国際公開日	平成18年3月9日 (2006. 3. 9)		アロピーアン リージョナル センター
(31) 優先権主張番号	0419634.1	(74) 代理人	100099759
(32) 優先日	平成16年9月3日 (2004. 9. 3)		弁理士 青木 篤
(33) 優先権主張国	英国 (GB)	(74) 代理人	100077517
(31) 優先権主張番号	0420645.4		弁理士 石田 敬
(32) 優先日	平成16年9月16日 (2004. 9. 16)	(74) 代理人	100087871
(33) 優先権主張国	英国 (GB)		弁理士 福本 積
(31) 優先権主張番号	0502486.4	(74) 代理人	100087413
(32) 優先日	平成17年2月7日 (2005. 2. 7)		弁理士 古賀 哲次
(33) 優先権主張国	英国 (GB)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 イソオキサゾリン誘導体と、その除草剤としての利用法

(57) 【要約】

一般式 (I) の化合物 (ただしその置換基は請求項 1 に規定のとおりである) は除草剤として有用である。また、一般式 (I) の化合物 (ただし m は 2 であり、 n は 1 であり、そしてその他の置換基は請求項 1 に規定のとおりである) の調製方法であって、一般式 (Ia) の化合物を 1 ステップまたは連続したステップで、一般式 R^5 -X および/または R^6 -X の化合物 (ただし R^5 と R^6 は請求項 1 で定義した通りであり、X は離脱基である) と反応させる方法、一般式 (I) の化合物 (ただし R^6 は $C_1 \sim C_{10}$ アルキルまたはハロゲンであり、 m は 2 であり、 n は 1 であり、そしてその他の置換基は請求項 1 に規定のとおりである) の調製方法であって、一般式 (Ib) の化合物を、一般式 R^5 -X および/または R^6 -X の化合物 (ただし R^5 と R^6 は請求項 1 で定義した通りであり、X は離脱基である) と反応させる方法、一般式 (I) の化合物 (ただし R^5 は、塩素、臭素、ヨウ素のいずれかであり、 m は 1 または 2 であり、 n は 1 であり、そしてその他の置換基は請求項 1 に規定のとおりである) の調製方法であって、一般式 (Ic) の化合物を、N-ハロスクシンイミドおよび酸化剤と順番に反応

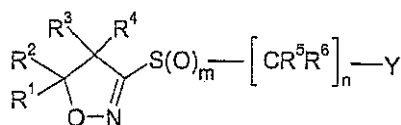


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) の化合物：

【化 1】



(I)

10

と、一般式 (I) の化合物のN-オキシド、塩、光学異性体（ただし、

R¹とR²は、それぞれ互いに独立に、水素、C₁～C₁₀アルキル、C₁～C₁₀ハロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル-C₁～C₃アルキルのいずれかであるか、

R¹とR²は、これらの基が結合している炭素原子と合わさってC₃～C₇環を形成し、

R³とR⁴は、それぞれ互いに独立に、水素、C₁～C₁₀アルキル、C₁～C₁₀ハロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル-C₁～C₁₀アルキル、C₁～C₆アルコキシ-C₁～C₁₀アルキル、C₃～C₈シクロアルキルのいずれかであるか、

R³とR⁴は、これらの基が結合している炭素原子と合わさってC₃～C₇環を形成するか、

20

R¹が、R³またはR⁴に加え、これらの基が結合している炭素原子と合わさってC₅～C₈環を形成するか、

R²が、R³またはR⁴に加え、これらの基が結合している炭素原子と合わさってC₅～C₈環を形成し；

R⁵とR⁶は、それぞれ互いに独立に、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆ヒドロキシアルキル、ピロリル-CH₂-、ピラゾリル-CH₂-、4,5-ジヒドロピラゾリル-CH₂-、トリアゾリル-CH₂-、イミダゾリル-CH₂-、テトラゾリル-CH₂-、インドリル-CH₂-、インダゾリル-CH₂-、ベンゾトリアゾリル-CH₂-、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ-C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルケニルオキシ、C₂～C₆アルキニルオキシ、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₃～C₆シクロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシ-C₁～C₆アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、1～3個のR⁹で置換されたフェニルカルボニルのいずれかであるか、

30

R⁵とR⁶は、それぞれ互いに独立に、フェノキシカルボニル、または1～3個のR⁹で置換されたフェノキシカルボニルであるか、

R⁵とR⁶は、それぞれ互いに独立に、ベンジルオキシカルボニル、または1～3個のR⁹で置換されたベンジルオキシカルボニルであるか、

R⁵とR⁶は、それぞれ互いに独立に、ニトロ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ(C₁～C₆アルキル)シリル、C₁～C₆アルキルカルボニル-C₁～C₂アルキル、C₁～C₆アルコキシカルボニル-C₁～C₂アルキル、シアノ-C₁～C₂アルキル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニル-C₁～C₂アルキル、ジ-C₁～C₆アルキルアミノカルボニル-C₁～C₂アルキル、C₁～C₆アルコキシ-C₁～C₂アルキル、C₁～C₂アルキル-P(O)(OC₁～C₆アルキル)₂、C₁～C₂アルキル-NO₂、メルカプト、フェニルチオ、1～3個のR⁹で置換されたフェニルチオのいずれかであるか、

40

R⁵とR⁶は、それぞれ互いに独立に、ピリジルチオ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルチオ-C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル-C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルスルホニル-C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルホニルオキシ-C₁～C₆アルキル、ベンジルスルホニル、1～3個のR⁹で置換されたベンジルスルホニルのいずれかであるか、

50

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、フェニルスルフィニル、または1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルフィニルであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、フェニルスルホニル、または1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニルであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1～3個の R^9 で置換されたフェノキシのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、ベンジル、または1～3個の R^9 で置換されたベンジルであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、ベンジルオキシ、または1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCHO}$ 、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCoo}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHSO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHSO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHSO}_2$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{NHSO}_2$ -フェニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCO}$ -フェニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCONH}$ -フェニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3\sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3\sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1～2個のアミノ基または $C_1\sim C_6$ アルキルアミノ基を含んでいる）であるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、フェニルまたはナフチル（そのフェニルまたはナフチルは、場合によっては1～3個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、独立に、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、フェニルチオ、1～3個の R^9 で置換されたフェニルチオ、フェニルスルフィニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルフィニル、 $-\text{SF}_5$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ アルキル- $\text{SO}(\text{NH})-$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキル- $\text{SO}(\text{NCH}_3)$ 、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1～3個の R^9 で置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCoo}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCoo}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかで

10

20

30

40

50

あるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3 \sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3 \sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1～2個のアミノ基または $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ基を含んでいる)の中からなされる)であるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1～3個含む5～10員の複素環(この複素環は、場合によってはベンゾと縮合しており、場合によっては、1～3個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシカルボニル、フェニルチオ、1～3個の R^9 で置換されたフェニルチオ、フェニルスルフィニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルフィニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1～3個の R^9 で置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシ、 $-CONH-SO_2-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CONH-SO_2-C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NHCOC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-NHCOC_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NHCOC_2-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-NHCOC_2-C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCOC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCOC_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCOC_1$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-OCOC_1$ -フェニル、 $-OCONHC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCONHC_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCONHC_1$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-OCONHC_1$ -フェニル、 $-CONR^7R^8$ (ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3 \sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3 \sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1～2個のアミノ基または $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ基を含んでいる)の中からなされる)であり、しかも

R^6 は、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルのいずれかになっていることも可能であるか、

R^5 と R^6 は、これらの基が結合している炭素原子と合わさって3～10員の環を形成する(この環は、場合によっては、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1～3個含んでおり、場合によっては、1～4個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、独立に、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、ハロゲン、シアノ、ニトロ、フェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニル、フェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルカルボニル、ニトロで置換されたフェニルカルボニル、シアノで置換されたフェニルカルボニル、ハロゲンで置換されたフェニルカルボニルの中からなされる)か、

R^5 と R^6 は、これらの基が結合している炭素原子と合わさって一般式 $C=CR^{10}R^{11}$ の基(ただし R^{10} と R^{11} は、独立に、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ- $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ- $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ- $C_1 \sim C_2$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ- $C_1 \sim C_2$ アルキルカルボニルオキシの中から選択される)を形成し；

mは、0、1、2のいずれかであり；

nは、1、2、3のいずれかであり；

10

20

30

40

50

Yは、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、ヒドロキシル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、1~3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニルのいずれかであるか、

Yは、フェニルスルホニル、または1~3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニルであるか、

Yは、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1~3個の R^9 で置換されたフェノキシのいずれかであるか、

Yは、ベンジルオキシ、または1~3個の R^9 で置換されたベンジルオキシであるか、

Yは、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、または $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキルであるか、

Yは、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル（ただしそのフェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチルは、場合によっては1~3個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、独立に、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ- $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、フェニルチオ、フェニルスルフィニル、 $-\text{SF}_5$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、1~3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、1~3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキルオキシ（ただし CH_2 基のうちの1つは、場合によっては酸素原子で置換されている）、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2\sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2\sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1~3個の R^9 で置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、1~3個の R^9 で置換されたベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}$ -フェニル、1~3個の R^9 で置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}$ -フェニル、1~3個の R^9 で置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $\text{C}_3\sim \text{C}_8$ アルキレン基を形成し、その $\text{C}_3\sim \text{C}_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1~2個のアミノ基または $\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキルアミノ基を含んでいる）の中からなされる）のいずれかであるか、

Yは、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1~3個含む5~10員の複素環（この複素環は、場合によってはベンゾと縮合しており、場合によっては、1~3個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ- $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、 $-\text{SF}_5$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル

、ベンジルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキルオキシ（ただし CH_2 基のうちの1つは、場合によっては酸素原子で置換されている）、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2\sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2\sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1～3個の R^9 で置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシ、 $-CONH-SO_2-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-CONH-SO_2-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH-SO_2-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-NH-SO_2-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-NHCO-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-NHCO-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-NHCOC_2-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-NHCOC_2-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCO-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-OCO-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCO$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-OCO$ -フェニル、 $-CONH-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-OCONH-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCONH$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-OCONH$ -フェニル、 $-CONR^7R^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3\sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3\sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1～2個のアミノ基または $C_1\sim C_6$ アルキルアミノ基を含んでいる）の中からなされる）であり；

10

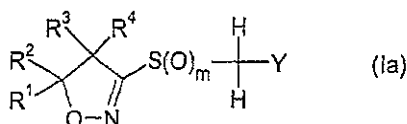
R^9 は、それぞれ互いに独立に、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲンのいずれかである）。

20

【請求項2】

一般式（I）の化合物（ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 Y は請求項1で定義した通りであり、 m は2であり、 n は1である）の調製方法であって、一般式（Ia）の化合物：

【化2】



30

（ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y は請求項1で定義した通りであり、 m は2である）を、不活性な溶媒の中で、塩基の存在下にて、1ステップまたは連続したステップで、一般式 R^5-X および／または R^6-X の化合物（ただし R^5 と R^6 は請求項1で定義した通りであり、 X は離脱基である）と反応させる方法。

【請求項3】

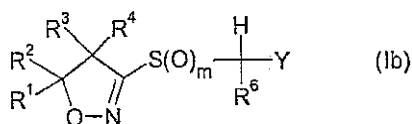
R^5 および／または R^6 がハロゲンである、請求項2に記載の方法。

【請求項4】

一般式（I）の化合物（ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Y は請求項1で定義した通りであり、 R^6 は $C_1\sim C_{10}$ アルキルまたはハロゲンであり、 m は2であり、 n は1である）の調製方法であって、一般式（Ib）の化合物：

40

【化 3】



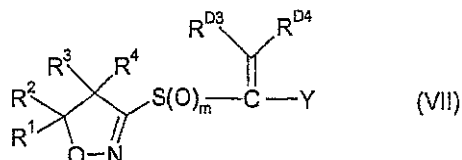
(ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y は請求項1で定義した通りであり、 R^6 は $C_1 \sim C_{10}$ アルキルまたはハロゲンであり、 m は2である)を、不活性な溶媒の中で、塩基の存在下にて、一般式 R^5-X および／または R^6-X の化合物(ただし R^5 と R^6 は請求項1で定義した通りであり、 X は離脱基である)と反応させる方法。

【請求項 5】

R^5 がハロゲンである、請求項4に記載の方法。

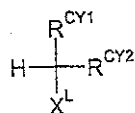
【請求項 6】

一般式(I)の化合物(ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y は請求項1で定義した通りであり、 R^5 と R^6 は、これらの基が結合している炭素原子と合わさってシクロプロピル環を形成し、そのシクロプロピル環は、場合によっては1~4個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、独立に、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、ニトロ、フェニルカルボニルの中からなされ、 m は2であり、 n は1である)の調製方法であって、一般式(VII)の化合物：



(ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y は請求項1で定義した通りであり、 m は2であり、 R^{D3} と R^{D4} は、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである)を、不活性な溶媒の中で、塩基の存在下にて、ハロゲン化トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)スルホニウムまたはハロゲン化トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)スルホキソニウムと反応させるか、一般式：

【化 5】

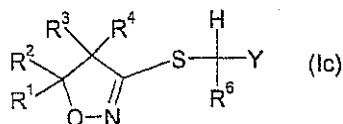


の化合物(ただし R^{CY1} と R^{CY2} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、ニトロのいずれかであり、 R^{CY1} はさらに水素でもよく、 X^L は離脱基である)と反応させる方法。

【請求項 7】

一般式(I)の化合物(ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 Y は請求項1で定義した通りであり、 R^5 は、塩素、臭素、ヨウ素のいずれかであり、 m は1または2であり、 n は1である)の調製方法であって、一般式(Ic)の化合物：

【化 6】



(ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 Y は請求項1で定義した通りである)を、不活性な溶媒の中で、N-ハロスクシンイミドおよび酸化剤と順番に反応させる方法。 10

【請求項 8】

除草に有効な量の一般式 (I) の化合物に加え、調合用アジュバントを含む除草用組成物。

【請求項 9】

有用な作物の間に生える草または雑草を制御する方法であって、除草に有効な量の一般式 (I) の化合物、またはその化合物を含む組成物を、その作物に対して施用するか、その作物が生えている場所に施用する操作を含む方法。

【請求項 10】

一般式 (I) の化合物に加えて除草剤をさらに含む、請求項8に記載の組成物。 20

【請求項 11】

一般式 (I) の化合物に加えて毒性緩和剤を含む、請求項8に記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な除草用イソオキサゾリン化合物と、その調製方法と、その化合物を含む組成物と、その組成物を利用して、特に有用な植物の間に生える雑草を制御したり、植物の生長を抑制したりする方法に関する。

【背景技術】

【0002】

除草作用を示すイソオキサゾリン化合物は、例えば、WO 01/012613、WO 02/062770、WO 03/000686、WO 04/010165、日本国特開2005-035924に記載されている。この化合物の調製法もWO 04/013106に記載されている。

【0003】

除草特性と生長抑制特性を示す新規なイソオキサゾリン化合物が見いだされた。

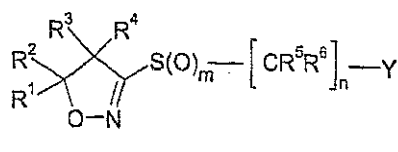
【発明の開示】

【課題を解決するための手段】

【0004】

したがって本発明は、一般式 (I) の化合物：

【化 1】



と、一般式 (I) の化合物のN-オキシド、塩、光学異性体に関する。ただし一般式 (I) において、

10

20

30

40

50

R^1 と R^2 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル- $C_1\sim C_3$ アルキルのいずれかであるか、

R^1 と R^2 は、これらの基が結合している炭素原子と合わさって $C_3\sim C_7$ 環を形成し、

R^3 と R^4 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル- $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ- $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキルのいずれかであるか、

R^3 と R^4 は、これらの基が結合している炭素原子と合わさって $C_3\sim C_7$ 環を形成するか、

R^1 が、 R^3 または R^4 に加え、これらの基が結合している炭素原子と合わさって $C_5\sim C_8$ 環を形成するか、

R^2 が、 R^3 または R^4 に加え、これらの基が結合している炭素原子と合わさって $C_5\sim C_8$ 環を形成し；

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヒドロキシアルキル、ピロリル- CH_2 -、ピラゾリル- CH_2 -、4,5-ジヒドロピラゾリル- CH_2 -、トリアゾリル- CH_2 -、イミダゾリル- CH_2 -、テトラゾリル- CH_2 -、インドリル- CH_2 -、インダゾリル- CH_2 -、ベンゾトリアゾリル- CH_2 -、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ- $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2\sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ- $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、1~3個の R^9 で置換されたフェニルカルボニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、フェノキシカルボニル、または1~3個の R^9 で置換されたフェノキシカルボニルであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、ベンジルオキシカルボニル、または1~3個の R^9 で置換されたベンジルオキシカルボニルであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、ニトロ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル- $C_1\sim C_2$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル- $C_1\sim C_2$ アルキル、シアノ- $C_1\sim C_2$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルアミノカルボニル- $C_1\sim C_2$ アルキル、ジ- $C_1\sim C_6$ アルキルアミノカルボニル- $C_1\sim C_2$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ- $C_1\sim C_2$ アルキル、 $C_1\sim C_2$ アルキル-P(0)($OC_1\sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $C_1\sim C_2$ アルキル- NO_2 、メルカプト、フェニルチオ、1~3個の R^9 で置換されたフェニルチオのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、ピリジルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ- $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル- $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル- $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ- $C_1\sim C_6$ アルキル、ベンジルスルホニル、1~3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、フェニルスルフィニル、または1~3個の R^9 で置換されたフェニルスルフィニルであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、フェニルスルホニル、または1~3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニルであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1~3個の R^9 で置換されたフェノキシのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、ベンジル、または1~3個の R^9 で置換されたベンジルであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、ベンジルオキシ、または1~3個の R^9 で置換されたベンジルオキシであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、-CONH-SO₂- $C_1\sim C_6$ アルキル、-CONH-SO₂- $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、-NHCHO、-NHCO- $C_1\sim C_6$ アルキル、-NHCO- $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、-NHCOO- $C_1\sim C_6$

10

20

30

40

50

アルキル、 $-\text{NHCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHSO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHSO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHSO}_2$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{NHSO}_2$ -フェニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCO}$ -フェニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCONH}$ -フェニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、フェニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ アルキレン基を形成し、その $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1～2個のアミノ基または $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルアミノ基を含んでいる）であるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、フェニルまたはナフチル（そのフェニルまたはナフチルは、場合によっては1～3個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、独立に、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ヒドロキシアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ ハロアルケニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル)シリル、メルカプト、フェニルチオ、1～3個の R^9 で置換されたフェニルチオ、フェニルスルフィニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルフィニル、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル- $\text{SO}(\text{NH})-$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル- $\text{SO}(\text{NCH}_3)$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1～3個の R^9 で置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}$ -フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、フェニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ アルキレン基を形成し、その $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1～2個のアミノ基または $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルアミノ基を含んでいる）の中からなされる）であるか、

R^5 と R^6 は、それぞれ互いに独立に、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1～3個含む5～10員の複素環（この複素環は、場合によってはベンゾと縮合しており、場合によっては、1～3個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ヒドロキシアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ ハロアルケニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシカルボニル、フェニルチオ、1～3個の R^9 で置換されたフェニルチオ、フェニルスルフィニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルフィニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル)シリル、メルカプト、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロ

10

20

30

40

50

アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1～3個の R^9 で置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-$ フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}-$ フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCONH}-$ フェニル、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3\sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3\sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1～2個のアミノ基または $C_1\sim C_6$ アルキルアミノ基を含んでいる）の中からなされる）であり、しかも

R^6 は、水素、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルのいずれかになっていることも可能であるか、

R^5 と R^6 は、これらの基が結合している炭素原子と合わさって3～10員の環を形成する（この環は、場合によっては、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1～3個含んでおり、場合によっては、1～4個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、独立に、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、ハロゲン、シアノ、ニトロ、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニル、フェニルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルカルボニル、ニトロで置換されたフェニルカルボニル、シアノで置換されたフェニルカルボニル、ハロゲンで置換されたフェニルカルボニルの中からなされる）か、

R^5 と R^6 は、これらの基が結合している炭素原子と合わさって一般式 $\text{C}=\text{CR}^{10}\text{R}^{11}$ の基（ただし R^{10} と R^{11} は、独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $-\text{NH}(C_1\sim C_6$ アルキル)、 $-\text{N}(C_1\sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ- $C_1\sim C_2$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ- $C_1\sim C_2$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ- $C_1\sim C_2$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ- $C_1\sim C_2$ アルキルカルボニルオキシの中から選択される）を形成し；

m は、0、1、2のいずれかであり；

n は、1、2、3のいずれかであり；

Y は、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、ヒドロキシル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニルのいずれかであるか、

Y は、フェニルスルホニル、または1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニルであるか、

Y は、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1～3個の R^9 で置換されたフェノキシのいずれかであるか、

Y は、ベンジルオキシ、または1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシであるか、

Y は、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ アルキル、または $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim \text{C}_6$ ハロアルキルであるか、

Yは、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル（ただしそのフェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチルは、場合によっては1～3個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、独立に、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ- $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、フェニルチオ、フェニルスルフィニル、 $-\text{SF}_5$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキルオキシ（ただし CH_2 基のうちの1つは、場合によっては酸素原子で置換されている）、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2\sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2\sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1～3個の R^9 で置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHC}(\text{O})-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{NHC}(\text{O})-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHC}(\text{O})_2-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{NHC}(\text{O})_2-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-$ フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、 $-\text{OCONH}-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}-$ フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCONH}-$ フェニル、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3\sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3\sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1～2個のアミノ基または $C_1\sim C_6$ アルキルアミノ基を含んでいる）の中からなされる）のいずれかであるか、

Yは、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1～3個含む5～10員の複素環（この複素環は、場合によってはベンゾと縮合しており、場合によっては、1～3個の置換基で置換されていて、その置換基の選択は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ- $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、 $-\text{SF}_5$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、1～3個の R^9 で置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキルオキシ（ただし CH_2 基のうちの1つは、場合によっては酸素原子で置換されている）、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2\sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2\sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、1～3個の R^9 で置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、1～3個の R^9 で置換されたベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHC}(\text{O})-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{NHC}(\text{O})-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHC}(\text{O})_2-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{NHC}(\text{O})_2-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-$ フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、 $-\text{OCONH}-$ $C_1\sim C_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-$ $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}-$ フェニル、1～3個の R^9 で置換された $-\text{OCONH}-$ フェニル、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアル

キルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3 \sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3 \sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1~2個のアミノ基または $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ基を含んでいる)の中からなされる)であり;

R^9 は、それぞれ互いに独立に、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲンのいずれかである。

【0005】

本発明の化合物は、1個以上の不斉炭素原子を例えば $-CR^5R^6$ -基に含むことができ、鏡像異性体(またはジアステレオマーのペア)として、またはその混合物として存在することができる。さらに、 m が1である場合には、本発明の化合物はスルホキシドであり、2通りの鏡像異性体の形態で存在でき、隣接する炭素も2通りの鏡像異性体の形態で存在できる。したがって一般式(I)の化合物はラセミ化合物、ジアステレオマー、単一の鏡像異性体のいずれかとして存在でき、本発明には、可能な異性体またはあらゆる割合での異性体混合物がすべて含まれる。ある化合物に関し、1つの異性体が他の異性体よりも除草性能が優れている可能性がある。

10

【0006】

特に断わらない限り、アルキル基と、アルコキシやアルキルチオなどのアルキル部分は、直鎖または分岐鎖の形態になった1~10個(一般に1~6個)の炭素原子を含んでいることが好ましい。具体例は、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソ-プロピル、*n*-ブチル、*s*-ブチル、イソ-ブチル、*t*-ブチルである。

20

【0007】

特に断わらない限り、シクロアルキル基と、シクロアルコキシやシクロアルキル-アルコキシなどのシクロアルキル部分は、3~8個(一般に3~6個)の炭素原子を含んでいることが好ましい。具体例は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルである。シクロアルキル基は、二環または三環の形態が可能である。

【0008】

特に断わらない限り、ハロアルキル基と、ハロアルコキシやハロアルキルチオなどのハロアルキル部分は、直鎖または分岐鎖の形態になった1~6個(一般に1~4個)の炭素原子を含んでいることが好ましい。具体例は、ジフルオロメチルや2,2,2-トリフルオロエチルである。

30

【0009】

特に断わらない限り、ヒドロキシアルキル基も、直鎖または分岐鎖の形態になった1~6個(一般に1~4個)の炭素原子を含んでいることが好ましい。具体例は、1,2-ジヒドロキシエチルや3-ヒドロキシプロピルである。

【0010】

特に断わらない限り、アルケニル部分とアルキニル部分も、直鎖または分岐鎖の形態になった2~6個(一般に2~4個)の炭素原子を含んでいることが好ましい。具体例は、アリル、ブト-2-エニル、3-メチルブト-2-エニル、エチニル、プロパルギル、ブト-2-イニルである。

40

【0011】

特に断わらない限り、ハロアルケニル基とハロアルキニル基も、直鎖または分岐鎖の形態になった2~6個(一般に2~4個)の炭素原子を含んでいることが好ましい。具体例は、トリフルオロアリルや1-クロロプロプ-1-イン-3-イルである。

【0012】

ハロには、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨードが含まれる。最も一般的なのはフルオロ、クロロ、ブロモであり、通常はフルオロまたはクロロである。

【0013】

特に断わらない限り、アルキレン基は、直鎖または分岐鎖の形態になった1~10個(一般に1~6個)の炭素原子を含んでいることが好ましい。具体例は、メチレン、エチレン、

50

n-プロピレン、イソ-プロピレン、n-ブチレン、s-ブチレン、イソ-ブチレン、t-ブチレンである。

【0014】

特に断わらない限り、複素環基は、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1~3個含む5~10員の環であることが好ましい。この環は、場合によってはベンゾと縮合していてもよい。具体例は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、1,2,3,4-テトラジニル、1,2,3,5-テトラジニル、1,2,4,5-テトラジニル、ベンゾフリル、イソベンゾフリル、ベンゾチオフェニル、イソベンゾチオフェニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾオキサゾリル、1,2-ベンゾイソオキサゾリル、2,1-ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、1,2-ベンゾイソチアゾリル、2,1-ベンゾイソチアゾリル、1,2,3-ベンゾオキサジアゾリル、2,1,3-ベンゾオキサジアゾリル、1,2,3-ベンゾチアジアゾリル、2,1,3-ベンゾチアジアゾリル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル、インドリジニル、ベンゾ-1,3-ジオキサソリル、4H-ベンゾ-1,3-ジオキシニル、4H-ベンゾ-1,4-ジオキシニルであり、適切な場合には、そのN-オキシドや塩も挙げられる。

【0015】

本発明による化合物の中に置換基として存在できる3~10員の環としては、芳香族の炭素環と複素環、非芳香族の炭素環と複素環の両方がある。そのような環は、単環または多環の形態が可能であり、さらに置換基を持つこと、および／またはベンゾと縮合することができる。具体例として、フェニル、ナフチル、アントリル、インデニル、フェナントレニル、上記のシクロアルキル基に加え、酸素原子、イオウ原子、窒素原子を含む環（例えば、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、1,3-ジオキサニル、1,3-ジオキサニル、1,4-ジオキサニル、モルホリニル）や、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、1,2,3,4-テトラジニル、1,2,3,5-テトラジニル、1,2,4,5-テトラジニル、ベンゾフリル、イソベンゾフリル、ベンゾチオフェニル、イソベンゾチオフェニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾオキサゾリル、1,2-ベンゾイソオキサゾリル、2,1-ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、1,2-ベンゾイソチアゾリル、2,1-ベンゾイソチアゾリル、1,2,3-ベンゾオキサジアゾリル、2,1,3-ベンゾオキサジアゾリル、1,2,3-ベンゾチアジアゾリル、2,1,3-ベンゾチアジアゾリル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル、インドリジニル、ベンゾ-1,3-ジオキサソリル、4H-ベンゾ-1,3-ジオキシニル、4H-ベンゾ-1,4-ジオキシニルもある。

【0016】

R⁵またはR⁶が独立に複素環-メチル基（例えばイミダゾリル-CH₂-）である場合には、複素環は、窒素によってメチル基に結合している。

【0017】

本発明には、一般式（I）の化合物のN-オキシドも含まれる。

【0018】

同様に、本発明は、一般式 (I) の化合物が、アミン、アルカリ金属塩基、アルカリ土類金属塩基、第四級アンモニウム塩基との間に形成することのできる塩にも関する。

【0019】

塩を形成するアルカリ金属水酸化物とアルカリ土類金属水酸化物のうちで、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化マグネシウム、水酸化カルシウムに特に注目すべきだが、その中でも水酸化ナトリウムと水酸化カリウムが特に挙げられる。本発明による一般式 (I) の化合物には、塩を形成している間に形成される可能性のある水和物も含まれる。

【0020】

アンモニウム塩を形成するのに適したアミンの具体例として、アンモニアのほか、第一級 $C_1 \sim C_{18}$ アルキルアミン、第二級 $C_1 \sim C_{18}$ アルキルアミン、第三級 $C_1 \sim C_{18}$ アルキルアミン、 $C_1 \sim C_4$ ヒドロキシアルキルアミン、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキルアミン（例えばメチルアミン、エチルアミン、*n*-プロピルアミン、イソプロピルアミン、ブチルアミンの4つの異性体、*n*-アミルアミン、イソアミルアミン、ヘキシルアミン、ヘプチルアミン、オクチルアミン、ノニルアミン、デシルアミン、ペンタデシルアミン、ヘキサデシルアミン、ヘプタデシルアミン、オクタデシルアミン、メチルエチルアミン、メチルイソプロピルアミン、メチルヘキシルアミン、メチルノニルアミン、メチルペンタデシルアミン、メチルオクタデシルアミン、エチルブチルアミン、エチルヘプチルアミン、エチルオクチルアミン、ヘキシルヘプチルアミン、ヘキシルオクチルアミン、ジメチルアミン、ジエチルアミン、ジ-*n*-プロピルアミン、ジイソプロピルアミン、ジ-*n*-ビチルアミン、ジ-*n*-アミルアミン、ジイソアミルアミン、ジヘキシルアミン、ジヘプチルアミン、ジオクチルアミン、エタノールアミン、*n*-プロパノールアミン、イソプロパノールアミン、*N,N*-ジエタノールアミン、*N*-エチルプロパノールアミン、*N*-ブチルエタノールアミン、アリルアミン、*n*-ブテニル-2-アミン、*n*-ペンテニル-2-アミン、2,3-ジメチルブテニル-2-アミン、ジブテニル-2-アミン、*n*-ヘキセニル-2-アミン、プロピレンジアミン、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリ-*n*-プロピルアミン、トリイソプロピルアミン、トリ-*n*-ブチルアミン、トリイソブチルアミン、トリ-*s*-ブチルアミン、トリ-*n*-アミルアミン、メトキシエチルアミン、エトキシエチルアミン）、複素環アミン（例えばピリジン、キノリン、イソキノリン、モルホリン、ピペリジン、ピロリジン、インドリン、キヌクリジン、アゼピン）、第一級アリールアミン（例えばアニリン、メトキシアニリン、エトキシアニリン、*o*-トルイジン、*m*-トルイジン、*p*-トルイジン、フェニレンジアミン、ベンジジン、ナフチルアミン、*o*-クロロアニリン、*m*-クロロアニリン、*p*-クロロアニリン）があるが、特に挙げられるのは、トリエチルアミン、イソプロピルアミン、ジイソプロピルアミンである。

【0021】

塩の形成に適した好ましい第四級アンモニウム塩基は、例えば一般式 $[N(R_a R_b R_c R_d)]OH$ に対応する。ただし、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d は、それぞれ互いに独立に、 $C_1 \sim C_4$ アルキルである。他のアニオンを有する他の適切なテトラアルキルアンモニウム塩基は、例えばアニオン交換反応によって得られる。

【0022】

本発明はさらに、一般式 (I) において、

R^1 と R^2 が、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ アルキルのいずれかであるか、

R^1 と R^2 が、これらの基が結合している炭素原子と合わさって $C_3 \sim C_7$ 環を形成し、

R^3 と R^4 が、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ- $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルのいずれかであるか、

R^3 と R^4 が、これらの基が結合している炭素原子と合わさって $C_3 \sim C_7$ 環を形成するか、

R^1 が、 R^3 または R^4 に加え、これらの基が結合している炭素原子と合わさって $C_5 \sim C_8$ 環を形成するか、

R^2 が、 R^3 または R^4 に加え、これらの基が結合している炭素原子と合わさって $C_5 \sim C_8$ 環を

形成し；

R⁵とR⁶が、それぞれ互いに独立に、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆ヒドロキシアルキル、ピロリル-CH₂-、ピラゾリル-CH₂-、トリアゾリル-CH₂-、イミダゾリル-CH₂-、テトラゾリル-CH₂-、インドリル-CH₂-、インダゾリル-CH₂-、ベンゾトリアゾリル-CH₂-、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルケニルオキシ、C₂～C₆アルキニルオキシ、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、フェニルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルで置換されたフェニルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニルで置換されたフェニルカルボニル、ニトロで置換されたフェニルカルボニル、シアノで置換されたフェニルカルボニル、ホルミルで置換されたフェニルカルボニル、カルボキシルで置換されたフェニルカルボニル、ハロゲンで置換されたフェニルカルボニルのいずれかであるか、

10

R⁵とR⁶が、それぞれ互いに独立に、フェノキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルで置換されたフェノキシカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニルで置換されたフェノキシカルボニル、ニトロで置換されたフェノキシカルボニル、シアノで置換されたフェノキシカルボニル、ホルミルで置換されたフェノキシカルボニル、カルボキシルで置換されたフェノキシカルボニル、ハロゲンで置換されたフェノキシカルボニルのいずれかであるか、

R⁵とR⁶が、それぞれ互いに独立に、ベンジルオキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルで置換されたベンジルオキシカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニルで置換されたベンジルオキシカルボニル、ニトロで置換されたベンジルオキシカルボニル、シアノで置換されたベンジルオキシカルボニル、ホルミルで置換されたベンジルオキシカルボニル、カルボキシルで置換されたベンジルオキシカルボニル、ハロゲンで置換されたベンジルオキシカルボニルのいずれかであるか、

20

R⁵とR⁶が、それぞれ互いに独立に、ニトロ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ(C₁～C₆アルキル)シリル、C₁～C₆アルキルカルボニル-C₁～C₂アルキル、C₁～C₆アルコキシカルボニル-C₁～C₂アルキル、シアノ-C₁～C₂アルキル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニル-C₁～C₂アルキル、ジ-C₁～C₆アルキルアミノカルボニル-C₁～C₂アルキル、C₁～C₆アルコキシ-C₁～C₂アルキル、C₁～C₂アルキル-P(0)(OC₁～C₆アルキル)₂、C₁～C₂アルキル-NO₂、メルカプト、フェニルチオ、C₁～C₆ハロアルキルで置換されたフェニルチオ、C₁～C₆アルコキシカルボニルで置換されたフェニルチオ、ニトロで置換されたフェニルチオ、シアノで置換されたフェニルチオ、ホルミルで置換されたフェニルチオ、カルボキシルで置換されたフェニルチオ、ハロゲンで置換されたフェニルチオのいずれかであるか、

30

R⁵とR⁶が、それぞれ互いに独立に、ピリジルチオ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルチオ-C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル-C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルスルホニル-C₁～C₆アルキル、ベンジルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルで置換されたベンジルスルホニル、C₁～C₆アルコキシカルボニルで置換されたベンジルスルホニル、ニトロで置換されたベンジルスルホニル、シアノで置換されたベンジルスルホニル、ホルミルで置換されたベンジルスルホニル、カルボキシルで置換されたベンジルスルホニル、ハロゲンで置換されたベンジルスルホニルのいずれかであるか、

40

R⁵とR⁶が、それぞれ互いに独立に、フェニルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルで置換されたフェニルスルフィニル、C₁～C₆アルコキシカルボニルで置換されたフェニルスルフィニル、ニトロで置換されたフェニルスルフィニル、シアノで置換されたフェニルスルフィニル、ホルミルで置換されたフェニルスルフィニル、カルボキシルで置換されたフェニルスルフィニル、ハロゲンで置換されたフェニルスルフィニルのいずれかであるか、

R⁵とR⁶が、それぞれ互いに独立に、フェニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルで置換されたフェニルスルホニル、C₁～C₆アルコキシカルボニルで置換されたフェニルスルホニル、ニトロで置換されたフェニルスルホニル、シアノで置換されたフェニルスルホニル、ホルミルで置換されたフェニルスルホニル、カルボキシルで置換されたフェニルスルホニル

50

、ハロゲンで置換されたフェニルスルホニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェノキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェノキシ、ニトロで置換されたフェノキシ、シアノで置換されたフェノキシ、ホルミルで置換されたフェノキシ、カルボキシルで置換されたフェノキシ、ハロゲンで置換されたフェノキシのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、ベンジル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジル、ニトロで置換されたベンジル、シアノで置換されたベンジル、ホルミルで置換されたベンジル、カルボキシルで置換されたベンジル、ハロゲンで置換されたベンジルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、ベンジルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルオキシ、ニトロで置換されたベンジルオキシ、シアノで置換されたベンジルオキシ、ホルミルで置換されたベンジルオキシ、カルボキシルで置換されたベンジルオキシ、ハロゲンで置換されたベンジルオキシのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCHO}$ 、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCoo}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHSO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHSO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHSO}_2$ -フェニル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}$ -フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、ニトロで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、シアノで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、ホルミルで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、カルボキシルで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、ハロゲンで置換された $-\text{OCO}$ -フェニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}$ -フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、カルボキシルで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、ニトロで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、シアノで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、ハロゲンで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3\sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3\sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個の酸素原子またはイオウ原子か、1~2個のアミノ基または $C_1\sim C_6$ アルキルアミノ基を含んでいる）であるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、フェニルまたはナフチル（ただしその環は、場合によっては置換基で置換されていてもよく、その置換基の選択は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルオキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルオキシカルボニル、ニトロで置換されたベンジルオキシカルボニル、シアノで置換されたベンジルオキシカルボニル、ホルミルで置換されたベンジルオキシカルボニル、カルボキシルで置換されたベンジルオキシカルボニル、ハロゲンで置換されたベンジルオキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、フェニルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェニルチオ、ニトロで置換されたフェニルチオ、シアノで置換されたフェニルチオ、ホルミルで置換されたフェニルチオ、カルボキ

10

20

30

40

50

シルで置換されたフェニルチオ、ハロゲンで置換されたフェニルチオ、フェニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェニルスルフィニル、ニトロで置換されたフェニルスルフィニル、シアノで置換されたフェニルスルフィニル、ホルミルで置換されたフェニルスルフィニル、カルボキシルで置換されたフェニルスルフィニル、ハロゲンで置換されたフェニルスルフィニル、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-SO(NH)-、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-SO(NCH₃)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルスルホニル、ニトロで置換されたベンジルスルホニル、シアノで置換されたベンジルスルホニル、ホルミルで置換されたベンジルスルホニル、カルボキシルで置換されたベンジルスルホニル、ハロゲンで置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェニルスルホニル、ニトロで置換されたフェニルスルホニル、シアノで置換されたフェニルスルホニル、ホルミルで置換されたフェニルスルホニル、カルボキシルで置換されたフェニルスルホニル、ハロゲンで置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェノキシ、ニトロで置換されたフェノキシ、シアノで置換されたフェノキシ、ホルミルで置換されたフェノキシ、カルボキシルで置換されたフェノキシ、ハロゲンで置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルオキシ、ニトロで置換されたベンジルオキシ、シアノで置換されたベンジルオキシ、ホルミルで置換されたベンジルオキシ、カルボキシルで置換されたベンジルオキシ、ハロゲンで置換されたベンジルオキシ、 $-CONH-SO_2-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CONH-SO_2-C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NHCO-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-NHCO-C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NHCO_2-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-NHCO_2-C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCO-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCO-C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCO$ -フェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換された $-OCO$ -フェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-OCO$ -フェニル、ニトロで置換された $-OCO$ -フェニル、シアノで置換された $-OCO$ -フェニル、ホルミルで置換された $-OCO$ -フェニル、カルボキシルで置換された $-OCO$ -フェニル、ハロゲンで置換された $-OCO$ -フェニル、 $-OCONH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCONH-C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCONH$ -フェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換された $-OCONH$ -フェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-OCONH$ -フェニル、カルボキシルで置換された $-OCONH$ -フェニル、ニトロで置換された $-OCONH$ -フェニル、シアノで置換された $-OCONH$ -フェニル、ハロゲンで置換された $-OCONH$ -フェニル、 $-CONR^7R^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3 \sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3 \sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個以上の酸素原子またはイオウ原子か、1個以上のアミノ基またはアルキルアミノ基を含んでいてもよい）の中からなされる）であるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1個以上含む5～10員の複素環（この複素環は、ベンゾと縮合してもよく、さらに、置換基で置換されていてもよく、その置換基の選択は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルオキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルオキシカルボニル、ニトロで置換されたベンジルオキシカルボニル、シアノで置換されたベンジルオキシカルボニル、ホルミルで置換されたベンジルオキシカルボニル、カルボキシルで置換されたベンジルオキシカルボニル、ハロ

ゲンで置換されたベンジルオキシカルボニル、フェニルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェニルチオ、ニトロで置換されたフェニルチオ、シアノで置換されたフェニルチオ、ホルミルで置換されたフェニルチオ、カルボキシルで置換されたフェニルチオ、ハロゲンで置換されたフェニルチオ、フェニルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェニルスルフィニル、ニトロで置換されたフェニルスルフィニル、シアノで置換されたフェニルスルフィニル、ホルミルで置換されたフェニルスルフィニル、カルボキシルで置換されたフェニルスルフィニル、ハロゲンで置換されたフェニルスルフィニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1\sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、 $-SF_5$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルスルホニル、ニトロで置換されたベンジルスルホニル、シアノで置換されたベンジルスルホニル、ホルミルで置換されたベンジルスルホニル、カルボキシルで置換されたベンジルスルホニル、ハロゲンで置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェニルスルホニル、ニトロで置換されたフェニルスルホニル、シアノで置換されたフェニルスルホニル、ホルミルで置換されたフェニルスルホニル、カルボキシルで置換されたフェニルスルホニル、ハロゲンで置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェノキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェノキシ、ニトロで置換されたフェノキシ、シアノで置換されたフェノキシ、ホルミルで置換されたフェノキシ、カルボキシルで置換されたフェノキシ、ハロゲンで置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルオキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルオキシ、ニトロで置換されたベンジルオキシ、シアノで置換されたベンジルオキシ、ホルミルで置換されたベンジルオキシ、カルボキシルで置換されたベンジルオキシ、ハロゲンで置換されたベンジルオキシ、 $-CONH-SO_2-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-CONH-SO_2-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-NHC(=O)-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-NHC(=O)-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-OC(=O)-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-OC(=O)-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-OC(=O)-$ フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換された $-OC(=O)-$ フェニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-OC(=O)-$ フェニル、ニトロで置換された $-OC(=O)-$ フェニル、シアノで置換された $-OC(=O)-$ フェニル、ホルミルで置換された $-OC(=O)-$ フェニル、カルボキシルで置換された $-OC(=O)-$ フェニル、ハロゲンで置換された $-OC(=O)-$ フェニル、 $-OCONH-C_1\sim C_6$ アルキル、 $-OCONH-C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $-OCONH-$ フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換された $-OCONH-$ フェニル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-OCONH-$ フェニル、カルボキシルで置換された $-OCONH-$ フェニル、ニトロで置換された $-OCONH-$ フェニル、シアノで置換された $-OCONH-$ フェニル、ハロゲンで置換された $-OCONH-$ フェニル、 $-CONR^7R^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3\sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3\sim C_8$ アルキレン基は、場合によっては1個以上の酸素原子またはイオウ原子、または1個以上のアミノ基またはアルキルアミノ基を含んでいてもよい）の中からなされる）であり、しかも

10

20

30

40

50

R^6 が、水素、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニルのいずれかになっていることも可能であるか、

R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素原子と合わさって3～10員の環を形成する（ただしこの環は、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1個以上含んでいてもよく、さらに、置換基で置換されていてもよく、その置換基の選択は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロア

ルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、ハロゲン、シアノ、ニトロ、フェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニル、フェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルカルボニル、ニトロで置換されたフェニルカルボニル、シアノで置換されたフェニルカルボニル、ハロゲンで置換されたフェニルカルボニルの中からなされる)か、

R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素原子と合わさって、 $C=CH_2$ 、 $C=CH-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C=CH-N(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2$ 、 $C=CH-NH(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $C=CH-C_1 \sim C_6$ アルコキシのいずれかを形成し；

mが、0、1、2のいずれかであり；

nが、1、2、3のいずれかであり；

Yが、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、ヒドロキシル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)シリル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルスルホニル、カルボキシルで置換されたベンジルスルホニル、ニトロで置換されたベンジルスルホニル、シアノで置換されたベンジルスルホニル、ハロゲンで置換されたベンジルスルホニルのいずれかであるか、

Yが、フェニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェニルスルホニル、カルボキシルで置換されたフェニルスルホニル、ニトロで置換されたフェニルスルホニル、シアノで置換されたフェニルスルホニル、ハロゲンで置換されたフェニルスルホニルであるか、

Yが、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェノキシ、カルボキシルで置換されたフェノキシ、ニトロで置換されたフェノキシ、シアノで置換されたフェノキシ、ハロゲンで置換されたフェノキシのいずれかであるか、

Yが、ベンジルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルオキシ、カルボキシルで置換されたベンジルオキシ、ニトロで置換されたベンジルオキシ、シアノで置換されたベンジルオキシ、ハロゲンで置換されたベンジルオキシのいずれかであるか、

Yが、 $-CONH-SO_2-C_1 \sim C_6$ アルキル、または $-CONH-SO_2-C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであるか、

Yが、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル(ただしその環は置換基で置換されていてもよく、その置換基の選択は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、フェニルチオ、フェニルスルフィニル、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルスルホニル、ニトロで置換されたベンジルスルホニル、シアノで置換されたベンジルスルホニル、ホルミルで置換されたベンジルスルホニル、カルボキシルで置換されたベンジルスルホニル、ハロゲンで置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェニルスルホニル、ニトロで置換されたフェニルスルホニル、シアノで置換されたフェニル

スルホニル、ホルミルで置換されたフェニルスルホニル、カルボキシルで置換されたフェニルスルホニル、ハロゲンで置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェノキシ、ニトロで置換されたフェノキシ、シアノで置換されたフェノキシ、ホルミルで置換されたフェノキシ、カルボキシルで置換されたフェノキシ、ハロゲンで置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルオキシ、ニトロで置換されたベンジルオキシ、シアノで置換されたベンジルオキシ、ホルミルで置換されたベンジルオキシ、カルボキシルで置換されたベンジルオキシ、ハロゲンで置換されたベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}_2-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}_2-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-$ フェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、ニトロで置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、シアノで置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、ホルミルで置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、カルボキシルで置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、ハロゲンで置換された $-\text{OCO}-$ フェニル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}-$ フェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換された $-\text{OCONH}-$ フェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-\text{OCONH}-$ フェニル、カルボキシルで置換された $-\text{OCONH}-$ フェニル、ニトロで置換された $-\text{OCONH}-$ フェニル、シアノで置換された $-\text{OCONH}-$ フェニル、ハロゲンで置換された $-\text{OCONH}-$ フェニル、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $C_3 \sim C_8$ アルキレン基を形成し、その $C_3 \sim C_8$ アルキレン基は、1個以上の酸素原子またはイオウ原子か、1個以上のアミノ基またはアルキルアミノ基を含んでいてもよい）の中からなされる）のいずれかであるか、

10

20

30

40

50

Yが、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1個以上含む5～10員の複素環（ただしこの複素環は、ベンゾと縮合してもよく、さらにも、置換基で置換されていてもよく、その置換基の選択は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロキシアリル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)シリル、メルカプト、 $-\text{SF}_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、ベンジルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルスルホニル、ニトロで置換されたベンジルスルホニル、シアノで置換されたベンジルスルホニル、ホルミルで置換されたベンジルスルホニル、カルボキシルで置換されたベンジルスルホニル、ハロゲンで置換されたベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェニルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェニルスルホニル、ニトロで置換されたフェニルスルホニル、シアノで置換されたフェニルスルホニル、ホルミルで置換されたフェニルスルホニル、カルボキシルで置換されたフェニルスルホニル、ハロゲンで置換されたフェニルスルホニル、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたフェノキシ、ニトロで置換されたフェノキシ、シアノで置換されたフェノキシ、ホルミルで置換されたフェノキシ、カルボキシルで置換されたフェノキシ、ハロゲンで置換されたフェノキシ、ベンジルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルで置換されたベンジルオキシ、ニトロ

で置換されたベンジルオキシ、シアノで置換されたベンジルオキシ、ホルミルで置換されたベンジルオキシ、カルボキシルで置換されたベンジルオキシ、ハロゲンで置換されたベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{NHC}\text{O}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NHC}\text{O}_2-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCO}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCO}$ -フェニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、ニトロで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、シアノで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、ホルミルで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、カルボキシルで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、ハロゲンで置換された $-\text{OCO}$ -フェニル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCONH}-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{OCONH}$ -フェニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニルで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、カルボキシルで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、ニトロで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、シアノで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、ハロゲンで置換された $-\text{OCONH}$ -フェニル、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、フェニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかであるか、 R^7 と R^8 は、合わさって $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ アルキレン基を形成し、その $\text{C}_3\sim\text{C}_8$ アルキレン基は、1個以上の酸素原子またはイオウ原子か、1個以上のアミノ基またはアルキルアミノ基を含んでいてもよい）の中からなされる）である化合物と、

この一般式 (I) の化合物のN-オキシド、塩、光学異性体に関する。

【0023】

置換基の定義に現われるアルキル基とアルコキシ基は、例えば、メチル、メトキシ、エチル、エトキシ、プロピル、プロポキシ、ブチル、ブトキシ、ヘキシル、ヘキシルオキシ、ノニル、ノニルオキシ、デシル、デシルオキシと、これらの分岐した異性体である。適切なアルケニル基およびアルキニル基は、上記のアルキル基に由来する。シクロアルキル基は、一般に、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチルである。シクロアルキル基は、二環または三環の形態が可能である。フェニル基は、置換された形態でもよい。例えばYとして、アルコキシで置換されたフェニル基、またはハロゲンなどで置換されたアルコキシで置換されたフェニル基が可能である。本発明による化合物の中に置換基として存在できる3~10員の環としては、芳香族の炭素環と複素環、非芳香族の炭素環と複素環の両方がある。そのような環は、単環または多環の形態が可能であり、さらに置換基を持つこと、および／またはベンゾと縮合することができる。具体例として、フェニル、ナフチル、アントリル、インデニル、フェナントレニル、上記のシクロアルキル基に加え、酸素原子、イオウ原子、窒素原子を含む環（例えば、1,3-ジオキサニル、ジヒドロ-1,3-ジオキサニル、テトラヒドロフラニル、モルホリニル）や、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、ジヒドロイソオキサゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、テトラゾリル、テトラジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、2,1,3-ベンゾオキサジアゾリル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル、インドリジニルもある。

【0024】

本発明には、一般式 (I) の化合物のN-オキシドも含まれる。

【0025】

本発明には、一般式 (I) の化合物の光学異性体（特に $-\text{CR}^5\text{R}^6$ 基にキラル炭素原子を有

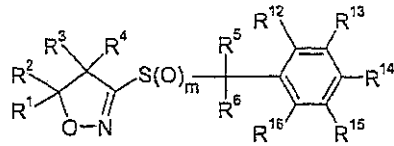
するもの) も含まれる。

【0026】

【表1】

表1:

式I.1の化合物



R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	CF ₃	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	F	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	I	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	F	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	F	H	H	Me	H	H	H

【表 2】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	2	CF ₃	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	Br	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Br	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	Br	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	Br	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	I	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	F	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	Br	H	F	H	H	H	F

10

20

30

40

【表 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	2	I	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Cl	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	Br	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	F	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	I	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	I	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H

10

20

30

40

【表 4】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	Cl	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	CF ₃	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	F	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	Cl	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Cl	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	I	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	Br	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Br	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Br	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H

10

20

30

40

【表 5】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	F	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Cl	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	Cl	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Cl	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	F	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	Cl	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Br	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	Cl	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Cl	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	H	H	Me	H	H	H

10

20

30

40

【表 6】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	2	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	F	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	H	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	I	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Cl	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	F	H	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	Br	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	I	H	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	H	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Cl	H	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	H	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	H	F	H	H	H	Cl

10

20

30

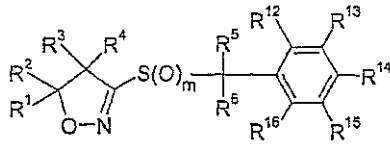
40

【表 7】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	H	H	Me	H	H	H

表 2 :

式 I. 1 の化合物



R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	I	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	F	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	I	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	F	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Br	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H

【表 8】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	1	I	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	I	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Br	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Br	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	F	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	F	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	F	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	F	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	I	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Br	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Br	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	I	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	F	Br	H	Me	H	H	H

10

20

30

40

【表 9】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	Br	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	Cl	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Cl	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Cl	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	I	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	I	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	Cl	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Br	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Br	H	Me	H	H	H

10

20

30

40

【表 10】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Cl	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Cl	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	F	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Cl	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	F	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	Cl	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Br	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	Br	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Cl	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H

10

20

30

40

【表 1 1】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	1	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Cl	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	F	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Br	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	I	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	Br	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	I	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	I	Br	F	H	H	H	F

10

20

30

40

【表 1 2】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	1	I	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Br	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	Br	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Br	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Cl	Br	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Cl	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Br	Br	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Br	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Br	Br	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Br	F	H	H	H	Cl

10

20

30

40

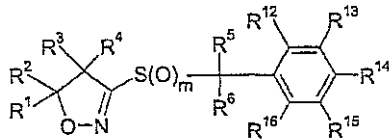
【表 1 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	2	I	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Br	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Br	H	Me	H	H	H

10

表 3 :

式 1.1 の化合物



R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	I	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	F	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Cl	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Cl	F	H	H	H	Cl

20

30

40

【表 1 4】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	1	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Cl	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	F	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	I	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	F	Cl	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	Cl	Cl	H	Me	H	H	H

10

20

30

40

【表 15】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Cl	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	I	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	I	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	F	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H

10

20

30

40

【表 16】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	F	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	F	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	I	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Cl	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Cl	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	Cl	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	Cl	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	F	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	Cl	H	Me	H	H	H

10

20

30

40

【表 17】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	Cl	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	Cl	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	Cl	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	I	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	F	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	Cl	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	F	Cl	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Cl	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	Cl	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	CF ₃	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	F	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	Cl	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	Cl	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	F	Cl	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	I	Cl	F	H	H	H	Cl

10

20

30

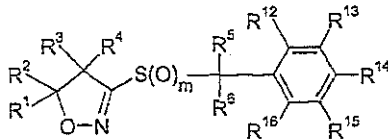
40

【表 18】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	Cl	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	Cl	F	H	H	H	F

表 4 :

式 1.1 の化合物



R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	F	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	F	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	F	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	F	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	I	F	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	F	F	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	I	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	I	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	F	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	F	F	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	CF ₃	F	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	F	H	Me	H	H	H

【表 19】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	2	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	I	F	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	F	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	F	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	F	F	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	F	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	F	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	F	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	F	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	F	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	F	F	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	F	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	F	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	I	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	F	F	H	H	H	Cl

10

20

30

40

【表 20】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	F	F	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	I	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	F	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	I	F	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	F	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	F	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	F	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	F	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	F	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	F	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	F	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	F	H	Me	H	H	H

10

20

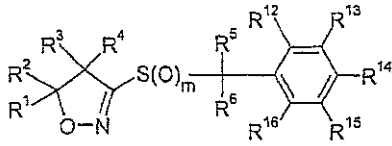
30

40

【表 2 1】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	2	F	F	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	F	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	F	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	F	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	F	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	F	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	F	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	F	F	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	F	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	I	F	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	F	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	F	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	CF ₃	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	F	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	F	F	H	H	H	F

【表 2 2】

表 5 :
式 1. 1 の化合物

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	I	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	I	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	1	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	I	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	I	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	I	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	I	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	I	I	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	I	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	I	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	I	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	I	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	I	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	I	F	H	H	H	Cl

【表 2 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	I	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	I	I	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	CF ₃	I	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	I	I	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	I	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	I	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	I	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	I	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	I	I	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	I	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	I	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	I	I	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	I	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	CF ₃	I	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H

10

20

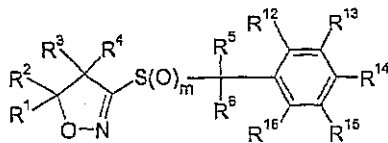
30

40

【表 2 4】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	I	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	I	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	I	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	CF ₃	I	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	I	I	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	I	I	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	I	I	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	I	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	I	I	H	Me	H	H	H

表 6 :
式 1.1 の化合物



R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H

【表 2 5】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶
Me	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	Cl
Me	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
Me	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	CF ₃	CF ₃	NO ₂	H	H	Cl	H
Me	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	0	CF ₃	CF ₃	F	H	H	H	F
Me	Me	H	H	2	CF ₃	CF ₃	H	Me	H	H	H

10

20

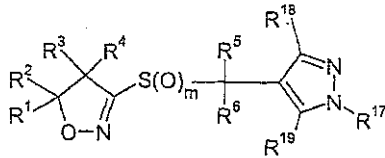
30

40

【表 2 6】

表 7 :

式 I. 2 の化合物



R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	OCF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCF ₃	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	OCF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCHF ₂	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCHF ₂	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	OCF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CF ₃

【表 27】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ F	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ F	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	Cl	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCF ₃	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ F	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCHF ₂	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCF ₃	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ F	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCHF ₂	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ F	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	OCH ₂ F

10

20

30

40

【表 28】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	OCF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	Cl
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	OCF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	Cl	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	Cl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	Cl	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	Cl	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	OCF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	Cl
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃

10

20

30

40

【表 2 9】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ F	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	Cl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	OCF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	Cl	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	Cl	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	OCF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ F	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCHF ₂	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ F	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ F	CH ₂ F

10

20

30

40

【表 30】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	Cl	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ F	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	Cl	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ F	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ F	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	OCF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ F	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	Cl	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ F	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ F	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ F	CH ₂ F

10

20

30

40

【表 3 1】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCHF ₂	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCHF ₂	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	Cl
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ F	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCF ₃	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCHF ₂	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCHF ₂	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	Cl
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ F	CHF ₂

10

20

30

40

【表 3 2】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCHF ₂	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	Cl	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCF ₃	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ F	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	Cl	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCH ₂ F	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CF ₃	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCH ₂ F	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	Cl	CH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCH ₂ CF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CH ₂ F	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	OCH ₂ F
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CHF ₂	OCHF ₂

10

20

30

40

【表 3 3】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	m	R ⁵	R ⁶	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CH ₂ F	OCF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCHF ₂	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCHF ₂	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	Cl
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	OCH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	Cl	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	CH ₂ F	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCHF ₂	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	Cl
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	CHF ₂	OCH ₂ CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	OCF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CH ₂ F	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	OCF ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Me	CHF ₂	OCHF ₂
CH ₂ Cl	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCHF ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Me	CF ₃	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCHF ₂	CH ₂ F
Me	Me	H	H	2	Br	H	Et	OCF ₃	CH ₂ F
CH ₂ Cl	Me	H	H	1	Br	H	Et	OCF ₃	CHF ₂
Me	Me	H	H	1	Br	H	Et	CHF ₂	OCF ₃

10

20

30

40

50

【0027】

表8

表8は、一般式 (I.2) において、R⁵がクロロであり、R¹、R²、R³、R⁴、m、R⁶、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表8の化合物1は、R⁵がプロモの代わりにクロロである点を除いて表7の化合物1と同じである。同様に、表

8の化合物2～240は、それぞれ、R⁵がプロモの代わりにクロロである点を除いて表7の化合物2～240と同じである。

【0028】

表9

表9は、一般式(I.2)において、R⁵がフルオロであり、R¹、R²、R³、R⁴、m、R⁶、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表9の化合物1は、R⁵がプロモの代わりにフルオロである点を除いて表7の化合物1と同じである。同様に、表9の化合物2～240は、それぞれ、R⁵がプロモの代わりにフルオロである点を除いて表7の化合物2～240と同じである。

【0029】

表10

表10は、一般式(I.2)において、R⁵がヨードであり、R¹、R²、R³、R⁴、m、R⁶、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表10の化合物1は、R⁵がプロモの代わりにヨードである点を除いて表7の化合物1と同じである。同様に、表10の化合物2～240は、それぞれ、R⁵がプロモの代わりにヨードである点を除いて表7の化合物2～240と同じである。

【0030】

表11

表11は、一般式(I.2)において、R⁵がトリフルオロメチルであり、R¹、R²、R³、R⁴、m、R⁶、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表11の化合物1は、R⁵がプロモの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表7の化合物1と同じである。同様に、表11の化合物2～240は、それぞれ、R⁵がプロモの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表7の化合物2～240と同じである。

【0031】

表12

表12は、一般式(I.2)において、R⁶がフルオロであり、R¹、R²、R³、R⁴、m、R⁵、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表12の化合物1は、R⁶が水素の代わりにフルオロである点を除いて表7の化合物1と同じである。同様に、表12の化合物2～240は、それぞれ、R⁶が水素の代わりにフルオロである点を除いて表7の化合物2～240と同じである。

【0032】

表13

表13は、一般式(I.2)において、R⁵がクロロであり、R⁶がフルオロであり、R¹、R²、R³、R⁴、m、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表13の化合物1は、R⁵がプロモの代わりにクロロである点を除いて表12の化合物1と同じである。同様に、表13の化合物2～240は、それぞれ、R⁵がプロモの代わりにクロロである点を除いて表12の化合物2～240と同じである。

【0033】

表14

表14は、一般式(I.2)において、R⁵とR⁶がフルオロであり、R¹、R²、R³、R⁴、m、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表14の化合物1は、R⁵がプロモの代わりにフルオロである点を除いて表12の化合物1と同じである。同様に、表14の化合物2～240は、それぞれ、R⁵がプロモの代わりにフルオロである点を除いて表12の化合物2～240と同じである。

【0034】

表15

表15は、一般式(I.2)において、R⁵がヨードであり、R⁶がフルオロであり、R¹、R²、R³、R⁴、m、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表15の化合物1は、R⁵がプロモの代わりにヨードである点を除いて表12の化合物1と同じである。同様に、表15の化合物2～240は、それぞれ、R⁵がプロモの代わりにヨードであ

る点を除いて表12の化合物2～240と同じである。

【0035】

表16

表16は、一般式 (I.2) において、 R^5 がトリフルオロメチルであり、 R^6 がフルオロであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表16の化合物1は、 R^5 がプロモの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表12の化合物1と同じである。同様に、表16の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がプロモの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表12の化合物2～240と同じである。

【0036】

10

表17

表17は、一般式 (I.2) において、 R^6 がプロモであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^5 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表17の化合物1は、 R^6 が水素の代わりにプロモである点を除いて表7の化合物1と同じである。同様に、表17の化合物2～240は、それぞれ、 R^6 が水素の代わりにプロモである点を除いて表7の化合物2～240と同じである。

【0037】

表18

表18は、一般式 (I.2) において、 R^5 がクロロであり、 R^6 がプロモであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表18の化合物1は、 R^5 がプロモの代わりにクロロである点を除いて表17の化合物1と同じである。同様に、表18の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がプロモの代わりにクロロである点を除いて表17の化合物2～240と同じである。

20

【0038】

表19

表19は、一般式 (I.2) において、 R^5 がヨードであり、 R^6 がプロモであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表19の化合物1は、 R^5 がプロモの代わりにヨードである点を除いて表17の化合物1と同じである。同様に、表19の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がプロモの代わりにヨードである点を除いて表17の化合物2～240と同じである。

30

【0039】

表20

表20は、一般式 (I.2) において、 R^5 がトリフルオロメチルであり、 R^6 がプロモであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表20の化合物1は、 R^5 がプロモの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表17の化合物1と同じである。同様に、表20の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がプロモの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表17の化合物2～240と同じである。

【0040】

表21

表21は、一般式 (I.2) において、 R^5 と R^6 がクロロであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表21の化合物1は、 R^5 がプロモの代わりにクロロであり、 R^6 が水素の代わりにクロロである点を除いて表7の化合物1と同じである。同様に、表21の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がプロモの代わりにクロロであり、 R^6 が水素の代わりにクロロである点を除いて表7の化合物2～240と同じである。

40

【0041】

表22

表22は、一般式 (I.2) において、 R^5 がヨードであり、 R^6 がクロロであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表22の化合物1は、 R^5 がクロロの代わりにヨードである点を除いて表21の化合物1と同じ

50

である。同様に、表22の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がクロロの代わりにヨードである点を除いて表21の化合物2～240と同じである。

【0042】

表23

表23は、一般式 (I.2) において、 R^5 がトリフルオロメチルであり、 R^6 がクロロであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表23の化合物1は、 R^5 がクロロの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表21の化合物1と同じである。同様に、表23の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がクロロの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表21の化合物2～240と同じである。

【0043】

表24

表24は、一般式 (I.2) において、 R^5 と R^6 がヨードであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表24の化合物1は、 R^5 がプロモの代わりにヨードであり、 R^6 が水素の代わりにヨードである点を除いて表7の化合物1と同じである。同様に、表24の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がプロモの代わりにヨードであり、 R^6 が水素の代わりにヨードである点を除いて表7の化合物2～240と同じである。

【0044】

表25

表25は、一般式 (I.2) において、 R^5 がトリフルオロメチルであり、 R^6 がヨードであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表25の化合物1は、 R^5 がヨードの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表24の化合物1と同じである。同様に、表25の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がヨードの代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表24の化合物2～240と同じである。

【0045】

表26

表26は、一般式 (I.2) において、 R^5 と R^6 がトリフルオロメチルであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} が表7に掲載したものである240種類の化合物からなる。したがって表26の化合物1は、 R^5 がプロモの代わりにトリフルオロメチルであり、 R^6 が水素の代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表7の化合物1と同じである。同様に、表26の化合物2～240は、それぞれ、 R^5 がプロモの代わりにトリフルオロメチルであり、 R^6 が水素の代わりにトリフルオロメチルである点を除いて表7の化合物2～240と同じである。

【0046】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、

R^1 と R^2 が両方とも C_1 ～ C_{10} アルキルであり；

R^3 と R^4 が両方とも水素であり；

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、 C_1 ～ C_6 ハロアルキル、 C_1 ～ C_6 ヒドロキシアルキル、ピラゾリル- CH_2 -、4,5-ジヒドロピラゾリル- CH_2 -、トリアゾリル- CH_2 -、イミダゾリル- CH_2 -、インダゾリル- CH_2 -、 C_2 ～ C_6 アルケニル、 C_2 ～ C_6 アルキニル、 C_2 ～ C_6 ハロアルケニル、 C_1 ～ C_6 アルキルカルボニルオキシ- C_2 ～ C_6 アルケニル、 C_1 ～ C_6 アルキルカルボニル、 C_1 ～ C_6 ハロアルキルカルボニル、 C_3 ～ C_6 シクロアルキルカルボニル、 C_1 ～ C_6 アルコキシ- C_1 ～ C_6 アルキルカルボニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、ハロゲン、 C_1 ～ C_6 アルキルカルボニル- C_1 ～ C_2 アルキル、 C_1 ～ C_6 アルコキシカルボニル- C_1 ～ C_2 アルキル、 C_1 ～ C_6 アルキルアミノカルボニル- C_1 ～ C_2 アルキル、ジ- C_1 ～ C_6 アルキルアミノカルボニル- C_1 ～ C_2 アルキル、 C_1 ～ C_6 アルコキシ- C_1 ～ C_2 アルキル、 C_1 ～ C_2 アルキル-P(O)(OC $_1$ ～ C_6 アルキル) $_2$ のいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、 C_1 ～ C_6 アルキルチオ、 C_1 ～ C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 ～ C_6 アルキルスルホニル、 C_1 ～ C_6 ハロアルキルスルホニル、 C_1 ～ C_6 アルキルスルホニル- C_1 ～ C_6 アルキル、 C_1 ～ C_6 アルキルスルホニルオキシ- C_1 ～ C_6 アルキル、ベンジルスルホニル、1～3個のハロゲンで置換されたベンジルスルホニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、ベンジル、または1～3個のハロゲンで置換されたベンジルであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、 $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ （ただし R^7 と R^8 は、それぞれ互いに独立に、水素、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、フェニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのいずれかである）であり、

しかも R^6 がさらに、水素、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニルのいずれかになっていることが可能であるか、

R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素原子と合わさって3～10員の環を形成する（ただしこの環は、場合によっては、1～4個の置換基で置換されており、その置換基の選択は、独立に、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニル、ハロゲン、ニトロ、フェニルカルボニルの中からなされる）か、

10

R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素原子と合わさって一般式 $\text{C}=\text{CR}^{10}\text{R}^{11}$ （ただし R^{10} と R^{11} の選択は、独立に、水素、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $-\text{NH}(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\sim\text{C}_6\text{アルキル})_2$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニルオキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキルカルボニルオキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニルオキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキルカルボニルオキシの中からなされる）の基を形成し；

m は1または2であり；

n は1であり；

20

Y は、フェニル（ただしこのフェニルは、場合によっては1～3個の置換基で置換されており、その置換基の選択は、独立に、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニルオキシ、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニルオキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、フェニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルで置換されたフェニル、ニトロで置換されたフェニル、シアノで置換されたフェニル、ハロゲンで置換されたフェニルのの中からなされる）であるか、

Y は、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1～3個含む5～10員の複素環（ただしこの複素環は、場合によっては1～3個の置換基で置換されており、その置換基の選択は、独立に、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、シアノ、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルスルホニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキルオキシ（ただし CH_2 基の1つは、場合によっては、酸素原子または $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシで置換されている）の中からなされる）である化合物と、

30

一般式（I）の化合物のN-オキシド、塩、光学異性体が含まれる。

【0047】

一般式（I）の特に好ましい化合物の1つのグループには、

R^1 と R^2 が両方とも $\text{C}_1\sim\text{C}_{10}$ アルキルであり；

40

R^3 と R^4 が両方とも水素であり；

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、トリアゾリル- CH_2 -、イミダゾリル- CH_2 -、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ ハロアルケニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニルオキシ- $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキルカルボニル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキルカルボニル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルカルボニルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシカルボニル- $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ- $\text{C}_1\sim\text{C}_2$ アルキルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、ベンジルスルホニルであるか、

R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、 $-\text{CONH}_2$ であり、しかも

50

R⁶がさらに、水素、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコシカルボニルのいずれかになっていることが可能であるか、

R⁵とR⁶が、これらの基が結合している炭素原子と合わさって3~10員の環を形成する（ただしこの環は、場合によっては、1~4個の置換基で置換されており、その置換基の選択は、独立に、C₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、ハロゲン、ニトロの中からなされる）か、

R⁵とR⁶が、これらの基が結合している炭素原子と合わさって一般式C=CR¹⁰R¹¹（ただしR¹⁰とR¹¹の選択は、独立に、水素、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニルオキシの中からなされる）の基を形成し；

mは1または2であり；

10

nは1であり；

Yは、フェニル（ただしこのフェニルは、場合によっては1~3個の置換基で置換されており、その置換基の選択は、独立に、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコシカルボニル、シアノ、ハロゲン、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルスルホニルオキシ、フェニルの中からなされる）であるか、

Yは、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1~3個含む5~10員の複素環（ただしこの複素環は、場合によっては1~3個の置換基で置換されており、その置換基の選択は、独立に、C₁~C₆アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₁~C₆ハロアルキル、シアノ、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシの中からなされる）である化合物と、

20

一般式（I）の化合物のN-オキシド、塩、光学異性体が含まれる。

【0048】

一般式（I）の好ましい化合物の1つのグループには、

R¹とR²が、それぞれ互いに独立に、水素、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロブチル、フルオロメチル、クロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルのいずれかであるか、

R¹とR²が、これらの基が結合している炭素原子と合わさってC₃環またはC₄環を形成し、

R³とR⁴が、それぞれ互いに独立に、水素、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロブチル、フルオロメチル、クロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルのいずれかであるか、

30

R³とR⁴が、これらの基が結合している炭素原子と合わさってC₃環またはC₄環を形成するか、

R¹が、R³またはR⁴に加え、これらの基が結合している炭素原子と合わさってC₅~C₆環を形成するか、

R²が、R³またはR⁴に加え、これらの基が結合している炭素原子と合わさってC₅~C₆環を形成する化合物が含まれる。

【0049】

一般式（I）の特に好ましい化合物の1つのグループには、R¹、R²、R³、R⁴が、それぞれ互いに独立に、水素、メチル、フルオロメチル、クロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルのいずれかである化合物が含まれる。

40

【0050】

一般式（I）の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、R¹とR²が両方ともC₁~C₁₀アルキルである化合物が含まれる。

【0051】

一般式（I）の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、R¹とR²が両方ともメチルである化合物が含まれる。

【0052】

一般式（I）の特に好ましい化合物の別のグループには、R³とR⁴が両方とも水素である化合物が含まれる。

50

【0053】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、 m が1または2である化合物が含まれる。

【0054】

一般式 (I) の極めて好ましい化合物のさらに別のグループには、 m が2である化合物が含まれる。

【0055】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、 R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、アセチル、1-アセチルオキシ-エテン-1-イル、ベンジルスルホニル、カルバモイル、クロロアセチル、N-シクロプロピル-カルバモイル、シクロプロピルカルボニル、N,N-ジエチル-カルバモイル、2-ジエチルホスホナト-エト-1-イル、ジフルオロアセチル、N-(2,2-ジフルオロエチル)-カルバモイル、1,1-ジフルオロプロプ-1-エン-3-イル、4,5-ジヒドロピラゾル-1-イルメチル、2-(N,N-ジメチル-カルバモイル)-エト-1-イル、2-エトキシカルボニル-エト-1-イル、4-フルオロアニリノカルボニル、4-フルオロベンジル、1-ヒドロキシ-ブト-1-イル、1-ヒドロキシ-プロプ-1-イル、イミダゾル-1-イルメチル、インダゾル-1-イルメチル、メトキシアセチル、2-メトキシ-エト-1-イル、メトキシメチル、メチルスルホニル、2-メチルスルホニル-エト-1-イル、メチルスルホニルメチル、1-メチルスルホニルオキシ-ブト-1-イル、プロパルギル、2-プロピオノイル-エト-1-イル、ピラゾル-1-イルメチル、1,2,4-トリアゾル-1-イルメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルチオのいずれかであり、しかも

R^6 がさらに、水素、エトキシカルボニル、エチル、メトキシカルボニル、メチルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素と合わさって、1-クロロ-1-メトキシカルボニル-シクロプロピル、シクロプロピル、1,1-ジクロロシクロプロピル、ニトロ-シクロプロピル、フェニルカルボニル-シクロプロピル、プロペン-2-イル-シクロプロピル、ビニル-シクロプロピルのいずれかを形成するか、

R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素と合わさって、3-アセチルオキシ-2-アセチルオキシアセチルオキシ-プロピリデン、2-アセチルオキシ-プロピリデン、ブチリデン、N,N-ジメチルアミノエチリデン、3-メトキシ-2-メトキシアセチルオキシ-プロピリデンのいずれかを形成する化合物が含まれる。

【0056】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、 R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、アセチル、1-アセチルオキシ-エテン-1-イル、ベンジルスルホニル、カルバモイル、クロロアセチル、シクロプロピルカルボニル、ジフルオロアセチル、1,1-ジフルオロプロプ-1-エン-3-イル、イミダゾル-1-イルメチル、メトキシメチル、2-メトキシ-エト-1-イル、プロパルギル、1,2,4-トリアゾル-1-イルメチル、トリフルオロメチルのいずれかであり、しかも

R^6 がさらに、水素、エチル、メトキシカルボニル、メチルのいずれかであるか、

R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素と合わさって、シクロプロピル、1,1-ジクロロシクロプロピル、ニトロ-シクロプロピル、ビニル-シクロプロピルのいずれかを形成するか、

R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素と合わさって、2-アセチルオキシ-プロピリデンを形成する化合物が含まれる。

【0057】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、 R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、アセチル、1-アセチルオキシ-エテン-1-イル、ベンジルスルホニル、カルバモイル、クロロアセチル、N-シクロプロピル-カルバモイル、シクロプロピルカルボニル、N,N-ジエチル-カルバモイル、2-ジエチルホスホナト-エト-1-イル、ジフルオロアセチル、N-(2,2-ジフルオロエチル)-カルバモイル、1,1-ジフルオロプロプ-1-エン-3-イル、4,5-ジヒドロピラゾル-1-イルメチル、2-(N,N-ジメチル-カルバ

モイル)-エト-1-イル、2-エトキシカルボニル-エト-1-イル、4-フルオロアニリノカルボニル、4-フルオロベンジル、1-ヒドロキシ-ブト-1-イル、1-ヒドロキシ-プロプ-1-イル、イミダゾル-1-イルメチル、インダゾル-1-イルメチル、メトキシアセチル、2-メトキシ-エト-1-イル、メトキシメチル、メチルスルホニル、2-メチルスルホニル-エト-1-イル、メチルスルホニルメチル、1-メチルスルホニルオキシ-ブト-1-イル、プロパルギル、2-プロピオノイル-エト-1-イル、ピラゾル-1-イルメチル、1,2,4-トリアゾル-1-イルメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルチオのいずれかであり、しかもR⁶がさらに、水素、エトキシカルボニル、エチル、メトキシカルボニル、メチルのいずれかである化合物が含まれる。

【0058】

10

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、R⁵とR⁶が、それぞれ互いに独立に、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、アセチル、1-アセチルオキシ-エテン-1-イル、ベンジルスルホニル、カルバモイル、クロロアセチル、シクロプロピルカルボニル、ジフルオロアセチル、1,1-ジフルオロプロプ-1-エン-3-イル、イミダゾル-1-イルメチル、メトキシメチル、2-メトキシ-エト-1-イル、メトキシメチル、プロパルギル、1,2,4-トリアゾル-1-イルメチル、トリフルオロメチルのいずれかであり、しかもR⁶がさらに、水素、エチル、メトキシカルボニル、メチルのいずれかである化合物が含まれる。

【0059】

20

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、R⁵とR⁶が、これらの基が結合している炭素と合わさって、1-クロロ-1-メトキシカルボニル-シクロプロピル、シクロプロピル、1,1-ジクロロシクロプロピル、ニトロ-シクロプロピル、フェニルカルボニル-シクロプロピル、プロペン-2-イル-シクロプロピル、ビニル-シクロプロピルのいずれかを形成する化合物が含まれる。

【0060】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、R⁵とR⁶が、これらの基が結合している炭素と合わさって、シクロプロピル、1,1-ジクロロシクロプロピル、ニトロ-シクロプロピル、ビニル-シクロプロピルのいずれかを形成する化合物が含まれる。

【0061】

30

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、R⁵とR⁶が、これらの基が結合している炭素と合わさって、3-アセチルオキシ-2-アセチルオキシアセチルオキシ-プロピリデン、2-アセチルオキシ-プロピリデン、ブチリデン、N,N-ジメチルアミノエチリデン、3-メトキシ-2-メトキシアセチルオキシ-プロピリデンのいずれかを形成する化合物が含まれる。

【0062】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、R⁵とR⁶が、これらの基が結合している炭素と合わさって、2-アセチルオキシ-プロピリデンを形成する化合物が含まれる。

【0063】

40

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、R⁵とR⁶が、それぞれ互いに独立に、シクロプロピル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ヒドロキシメチル、メトキシメチル、メチルチオメチル、メチルスルフィニルメチル、メチルスルホニルメチル、ビニル、ジフルオロビニル、ジクロロビニル、エチニル、プロパルギル、アセチル、トリフルオロアセチル、メトキシカルボニルエチル、ニトロ、ホルミル、臭素、塩素、フッ素、ヨウ素、アジド、トリメチルシリル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、シアノメチル、シアノエチル、-CH₂CH₂CON(CH₃)₂、-CH₂CH₂P(O)(OCH₃)₂、-CH₂CH₂P(O)(OC₂H₅)₂、-CH₂CH₂COCH₃、-CH₂CH₂COCH₂CH₃、-CH₂CH₂CO₂CH₃、-CH₂CH₂CO₂CH₂CH₃、-CH₂CH₂SO₂CH₃、-CH₂CH₂NO₂、メルカプト、フェニルチオ、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、ベンジルスルホニル、フェニルスルフィニル、フェニルスルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキ

50

シ、トリフルオロエトキシ、メタンスルホニルオキシ、トリフルオロメタンスルホニルオキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{CF}_3$ 、 $-\text{NHCO}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{NHCO}-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCO}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{OCO}-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCO}$ -フェニル、 $-\text{OCONH}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{OCONH}-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCONH}$ -フェニル、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{CONHCH}_3$ 、 $-\text{CON}(\text{CH}_3)_2$ のいずれかであり、しかも R^6 がさらに、水素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニルのいずれかであってもよい化合物が含まれる。

【0064】

一般式(I)の特に好ましい化合物の別の1つのグループには、 R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立にフェニルまたはナフチルであり、その環は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メチル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、メトキシカルボニル、 $-\text{CONH}_2$ 、カルボキシルのいずれかで置換されていてもよく、しかも R^6 がさらに、水素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ハロゲン、トリフルオロメチルのいずれかであってもよい化合物が含まれる。

【0065】

一般式(I)の特に好ましい化合物の別の1つのグループには、 R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、1,3-ジオキサニル、テトラヒドロフラニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、テトラゾリル、テトラジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、2,1,3-ベンゾオキサジアゾリル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル、インドリジニルのいずれかであり、これら複素環は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メチル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、メトキシカルボニル、 $-\text{CONH}_2$ 、カルボキシルのいずれかで置換されていてもよく、しかも R^6 がさらに、水素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ハロゲン、トリフルオロメチルのいずれかであってもよい化合物が含まれる。

【0066】

一般式(I)の特に好ましい化合物の別の1つのグループには、 R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、1,3-ジオキサニル、テトラヒドロフラニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、テトラゾリル、テトラジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、2,1,3-ベンゾオキサジアゾリル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル、インドリジニルのいずれかであり、これら複素環は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メチル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチル

スルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、メトキシカルボニル、 $-\text{CONH}_2$ 、カルボキシルのいずれかで置換されていてもよく、しかも R^6 がさらに、水素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ハロゲン、トリフルオロメチルのいずれかであってもよい化合物が含まれる。

【0067】

一般式(I)の特に好ましい化合物の別の1つのグループには、 R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素と合わさってシクロプロピル環を形成し、このシクロプロピル環は、メチル、トリフルオロメチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ニトロ、ビニル、2-プロペニル、アセチル、フェニルカルボニル、フェニル、トリフルオロアセチル、メチルスルホニル、シアノ、塩素、フッ素、臭素、メトキシのいずれかで置換されていてもよい化合物が含まれる。

10

【0068】

一般式(I)の特に好ましい化合物の別の1つのグループには、 R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素と合わさって、窒素原子、酸素原子、イオウ原子いずれかを含む3~6員の複素環を形成し、この複素環は、メチル、トリフルオロメチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、トリフルオロアセチル、トリフルオロメチルスルホニル、メチルスルホニル、アセチル、フェニル、シアノ、塩素、フッ素、臭素、メトキシのいずれかで置換されていてもよい化合物が含まれる。

20

【0069】

一般式(I)の特に好ましい化合物の別の1つのグループには、 R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素と合わさって、一般式 $\text{C}=\text{CH}_2$ 、 $\text{C}=\text{CH}-\text{CH}_3$ 、 $\text{C}=\text{CH}-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{C}=\text{CH}-\text{NH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{C}=\text{CH}-\text{OCH}_3$ 、 $\text{C}=\text{CH}-\text{OC}_2\text{H}_5$ のいずれかで表わされる基を形成する化合物が含まれる。

【0070】

一般式(I)の特に好ましい化合物の別の1つのグループには、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素と合わさって、窒素原子、酸素原子、イオウ原子を1個以上含んでもよい3~10員の環(特に3~6員の複素環、その中でも特にシクロプロピル)を形成し、この環は、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルコキシカルボニル、ハロゲン、ニトロ、シアノのいずれかで置換されていてもよい化合物が含まれる。

30

【0071】

一般式(I)の極めて好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、シクロプロピル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ビニル、ジフルオロビニル、ジクロロビニル、エチニル、プロパルギル、アセチル、トリフルオロアセチル、ベンジルオキシカルボニル、ニトロ、ホルミル、臭素、塩素、フッ素、ヨウ素、アジド、トリメチルシリル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、シアノメチル、メルカプト、フェニルチオ、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、ベンジルスルホニル、フェニルスルフィニル、フェニルスルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルチオメチル、メチルスルフィニルメチル、メチルスルホニルメチル、メチルスルホニルオキシ、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{CF}_3$ 、 $-\text{NHCO}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{NHCO}-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCO}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{OCO}-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCO}-\text{フェニル}$ 、 $-\text{OCONH}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{OCONH}-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCONH}-\text{フェニル}$ のいずれかであり、しかも R^6 がさらに、水素、シアノ、メチル、エチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ハロゲン、トリフルオロメチルのいずれかであってもよい化合物が含まれる。

40

【0072】

一般式(I)の極めて好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立にフェニルまたはナフチルであり、その環は、フッ素、塩素、トリフルオロメ

50

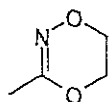
チル、メチルスルホニル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、メトキシカルボニルのいずれかで置換されていてもよく、しかも R^6 がさらに、水素、シアノ、メチル、エチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ハロゲン、トリフルオロメチルのいずれかであってもよい化合物が含まれる。

【0073】

一般式 (I) の極めて好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^5 と R^6 が、それぞれ互いに独立に、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、チアジアゾリル、オキサジアゾリル、ジヒドロイソオキサゾリル、一般式

【化2】

10



の基のいずれかであり、これらの環はメチルまたはメトキシで置換されていてもよく、しかも R^6 がさらに、水素、シアノ、メチル、エチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ハロゲン、トリフルオロメチルのいずれかであってもよい化合物が含まれる。

【0074】

20

一般式 (I) の極めて好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素と合わさってシクロプロピル環を形成し、このシクロプロピル環は、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、メトキシ、ニトロ、ビニル、臭素、フッ素、塩素のいずれかで置換されていてもよい化合物が含まれる。

【0075】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 m 、 n 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 がハロゲンである化合物が含まれる。

【0076】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 と R^6 が両方ともハロゲンである化合物が含まれる。

30

【0077】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 m 、 n 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 がフッ素である化合物が含まれる。

【0078】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 と R^6 が両方ともフッ素である化合物が含まれる。

【0079】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 m 、 n 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 が塩素である化合物が含まれる。

40

【0080】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 と R^6 が両方とも塩素である化合物が含まれる。

【0081】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 がフッ素であり、 R^6 が塩素である化合物が含まれる。

【0082】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 m 、 n 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル（特にトリフルオロメチル）である化合物が含まれる。

50

【0083】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、nが1または2である化合物が含まれる。

【0084】

一般式 (I) の極めて好ましい化合物のさらに別のグループには、nが1である化合物が含まれる。

【0085】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、シクロプロピル、トリフルオロメチル、トリフルオロエチル、ビニル、エチニル、ジフルオロビニル、プロパルギル、アセチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ニトロ、シアノ、ホルミル、ヒドロキシル、カルボキシル、ハロゲン、アジド、チオシアナト、トリメチルシリル、メチルチオ、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ベンジルスルホニル、フェニルスルホニル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、メチルスルホニルオキシ、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、フェノキシ、ベンジロキシ、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CONH}-\text{SO}_2-\text{CF}_3$ のいずれかである化合物が含まれる。

10

【0086】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、Yがフェニルであり、そのフェニルは場合によっては1~3個の置換基で置換されており、その置換基の選択が、独立に、フルオロ、クロロ、シアノ、ジフルオロメトキシ、エトキシカルボニル、メトキシ、メトキシカルボニル、メチル、メチルスルホニルオキシ、ニトロ、フェニル、プロパルギルオキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルの中からなされる化合物が含まれる。

20

【0087】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがフェニルであり、そのフェニルは、場合によっては1~3個の置換基で置換されており、その置換基の選択が、独立に、フルオロ、クロロ、シアノ、ジフルオロメトキシ、エトキシカルボニル、メトキシ、メトキシカルボニル、メチル、メチルスルホニルオキシ、フェニル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルの中からなされる化合物が含まれる。

30

【0088】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yがフェニルである化合物が含まれる。

【0089】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-ビフェニルである化合物が含まれる。

【0090】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが6-クロロ-2-フルオロフェニルである化合物が含まれる。

【0091】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-シアノフェニルである化合物が含まれる。

40

【0092】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-ジフルオロメトキシフェニルである化合物が含まれる。

【0093】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2,3-ジフルオロフェニルである化合物が含まれる。

【0094】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2,4-ジフルオロフェ

50

ニルである化合物が含まれる。

【0095】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2,5-ジフルオロフェニルである化合物が含まれる。

【0096】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2,6-ジフルオロフェニルである化合物が含まれる。

【0097】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが3,5-ジフルオロフェニルである化合物が含まれる。

10

【0098】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2,6-ジフルオロ-3-トリルである化合物が含まれる。

【0099】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが3,5-ジメトキシフェニルである化合物が含まれる。

【0100】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-フルオロフェニルである化合物が含まれる。

【0101】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-フルオロ-4-エトキシカルボニルフェニルである化合物が含まれる。

20

【0102】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-フルオロ-4-メトキシカルボニルフェニルである化合物が含まれる。

【0103】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-フルオロ-6-トリフルオロメチルフェニルである化合物が含まれる。

【0104】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-メトキシフェニルである化合物が含まれる。

30

【0105】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-メチルスルホニルオキシフェニルである化合物が含まれる。

【0106】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-トリルである化合物が含まれる。

【0107】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが3-トリルである化合物が含まれる。

40

【0108】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-トリフルオロメトキシフェニルである化合物が含まれる。

【0109】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-トリフルオロメチルフェニルである化合物が含まれる。

【0110】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-トリフルオロメチルスルフィニルフェニルである化合物が含まれる。

【0111】

50

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが2-トリフルオロメチルチオフェニルである化合物が含まれる。

【0112】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、Yがピラゾリルであり、そのピラゾリルは場合によっては1~3個の置換基で置換されており、その置換基の選択が、独立に、クロロ、2,2-ジフルオロエトキシ、ジフルオロメトキシ、エトキシ、メトキシ、メチル、オキセタン-3-イルオキシ、イソ-プロピルスルホニル、2,2,2-トリフルオロエトキシ、トリフルオロメチルの中からなされる化合物が含まれる。

【0113】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがピラゾル-3-イル (1-メチル-4-トリフルオロメチル-ピラゾル-3-イルが最も好ましい) である化合物が含まれる。

10

【0114】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

【0115】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

【0116】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが3-ジフルオロメトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

20

【0117】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

【0118】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが1,3-ジメチル-5-(2,2-トリフルオロエトキシ)-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

【0119】

一般式 (I) の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが5-エトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

【0120】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがピラゾル-5-イルである化合物が含まれる。

30

【0121】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yが1-メチル-5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-3-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

【0122】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yが1-メチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

【0123】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yが1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

40

【0124】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yが1-メチル-5-イソ-プロピルスルホニル-3-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

【0125】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yが1-メチル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-3-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

【0126】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yが1-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾル-4-イルである化合物が含まれる。

50

【0127】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、Yがイミダゾリルであり、そのイミダゾリルは場合によっては1～3個の置換基で置換されていて、その置換基が、独立に、メチルの中から選択される化合物が含まれる。

【0128】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがイミダゾル-2-イル (1-メチルイミダゾル-2-イルが最も好ましい) である化合物が含まれる。

【0129】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、Yがイソオキサゾリルであり、そのイソオキサゾリルは場合によっては1個または2個の置換基で置換されていて、その置換基が、独立に、プロモ、シクロプロピル、メトキシ、メチルの中から選択される化合物が含まれる。

10

【0130】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがイソオキサゾル-3-イル (5-メチルイソオキサゾル-3-イルが最も好ましい) である化合物が含まれる。

【0131】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがイソオキサゾル-4-イル (3,5-ジメチルイソオキサゾル-4-イル、3-シクロプロピル-5-メチルイソオキサゾル-4-イル、5-シクロプロピル-3-メチルイソオキサゾル-4-イルのいずれかが最も好ましい) である化合物が含まれる。

20

【0132】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがイソオキサゾル-5-イル (3-メトキシイソオキサゾル-5-イルまたは3-プロモ-4-メチルイソオキサゾル-5-イルが最も好ましい) である化合物が含まれる。

【0133】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、Yがイソチアゾリルであり、そのイソチアゾリルは場合によっては1個または2個の置換基で置換されていて、その置換基が、独立に、シアノまたはメチルの中から選択される化合物が含まれる。

【0134】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがイソチアゾル-4-イル (5-シアノ-3-メチルイソチアゾル-4-イルが最も好ましい) である化合物が含まれる。

30

【0135】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、Yがチアゾリルであり、そのチアゾリルは場合によっては1個または2個の置換基で置換されていて、その置換基が、独立に、エトキシ、エチル、メトキシメチル、トリフルオロメチルの中から選択される化合物が含まれる。

【0136】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがトリアゾル-5-イル (4-エトキシ-2-トリフルオロメチルチアゾリル-5-イルまたは2-エチル-4-メトキシメチルチアゾル-5-イルが最も好ましい) である化合物が含まれる。

40

【0137】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、Yがピリジルであり、そのピリジルは場合によっては1～3個の置換基で置換されていて、その置換基が、独立に、クロロ、メチル、トリフルオロメチルの中から選択される化合物が含まれる。

【0138】

一般式 (I) の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがピリド-3-イル (2-クロロピリド-3-イルまたは2-メチル-6-トリフルオロメチル-ピリド-3-イルが最も好ましい) である化合物が含まれる。

【0139】

一般式 (I) の好ましい化合物の1つのグループには、Yが4H-ベンゾ-1,3-ジオキシニル

50

であり、その4H-ベンゾ-1,3-ジオキシニルは場合によっては1個または2個のフッ素原子で置換されている化合物が含まれる。

【0140】

一般式(I)の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yが4H-ベンゾ-1,3-ジオキシニル(6-フルオロ-4H-ベンゾ-1,3-ジオキシニルが最も好ましい)である化合物が含まれる。

【0141】

一般式(I)の好ましい化合物の1つのグループには、Yがベンゾ-1,3-ジオキソリルであり、そのベンゾ-1,3-ジオキソリルは場合によっては1個または2個のフッ素原子で置換されている化合物が含まれる。

10

【0142】

一般式(I)の特に好ましい化合物の1つのグループには、Yがベンゾ-1,3-ジオキソル-5-イル(2,2-ジフルオロ-ベンゾ-1,3-ジオキソル-5-イルが最も好ましい)である化合物が含まれる。

【0143】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、1,3-ジオキサニル、テトラヒドロフラニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、テトラゾリル、テトラジニル、4H-ベンゾ-1,3-ジオキシニル、ベンゾ-1,3-ジオキソリル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、2,1,3-ベンゾオキサジアゾリル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル、インドリジニルのいずれかであり、これらの環は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メチル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、メトキシカルボニル、 $-\text{CONH}_2$ 、カルボキシルのいずれかで置換されていてもよい化合物が含まれる。

20

30

【0144】

一般式(I)の特に好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、1,3-ジオキサニル、テトラヒドロフラニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1,2,3-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、1,3,5-トリアジニル、テトラゾリル、テトラジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、2,1,3-ベンゾオキサジアゾリル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル、インドリジニルのいずれかであり、これらの環は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メチル、メチルチオ、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、シアノ、ニトロ、メトキシカルボニル、 $-\text{CONH}_2$ 、カルボキシルのいずれか

40

50

で置換されていてもよい化合物が含まれる。

【0145】

一般式 (I) の極めて好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが、フェニル、ピリミジン-5-イル、ピリジン-3-イル、チアゾル-2-イル、チアゾル-5-イル、イソチアゾル-4-イル、イソオキサゾル-3-イル、イソオキサゾル-4-イル、イソオキサゾル-5-イル、イミダゾル-2-イル、ピラゾル-4-イル、ピラゾル-5-イル、チオフェン-3-イル、4H-ベンゾ-1,3-ジオキシン-8-イル、ベンゾ-1,3-ジオキソル-5-イルのいずれかであり、これら複素環はすべて、好ましくは表1～表26に示した置換基でさらに置換されていてもよい化合物が含まれる。

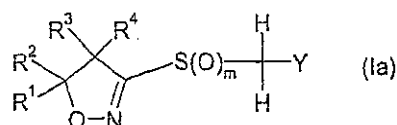
【0146】

一般式 (I) の極めて好ましい化合物のさらに別のグループには、Yが、フェニル、ピリミジン-5-イル、ピリジン-3-イル、イソチアゾル-4-イル、イソオキサゾル-4-イル、ピラゾル-4-イル、ピラゾル-5-イル、チオフェン-3-イルのいずれかであり、これら複素環はすべて、好ましくは表1～表26に示した置換基でさらに置換されていてもよい化合物が含まれる。

【0147】

一般式 (I) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、Yが上に定義した通りであり、mが2、nが1である化合物は、公知の方法により、例えば一般式 (Ia) の化合物：

【化3】



(ただし、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yは上に定義した通りであり、mは2である) を、a) 単一のステップまたは連続したステップで、一般式 R^5 -Xおよび／または R^6 -Xの化合物(ただし、 R^5 と R^6 は上に定義した通りであり、Xは適切な離脱基(例えばハロゲン(臭化物など)、カルボン酸塩(酢酸塩など)、アルキルスルホン酸塩またはアリールスルホン酸塩(p-トルエンスルホン酸塩など)、イミド(スクシンイミドなど)、スルホンイミド(ビス(フェニルスルホニル)イミドなど)、ハロアルキルスルホン酸塩(トリフルオロメチルスルホン酸塩など))である)と、塩基の存在下で、場合によってはさらに希釈剤(不活性な溶媒が好ましい)の存在下で、場合によってはさらに錯化剤の存在下で、 $-120^{\circ}\text{C} \sim 100^{\circ}\text{C}$ の温度範囲($-80^{\circ}\text{C} \sim 50^{\circ}\text{C}$ が好ましい)にて反応させることによって調製できる。このような方法は文献で知られており、例えば、J. Med. Chem.、2003年、第46巻、3021～3032ページ；J. Org. Chem.、2003年、第68巻、1443～1446ページ；J. Org. Chem.、2002年、第67巻、5216～5225ページ；J. Org. Chem.、2002年、第67巻、3065～3071ページに記載されている。

【0148】

一般式 (Ia) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義した通りであり、mが2である化合物は、b) 一般式：

【化4】



10

20

30

40

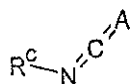
50

(ただし、Gは、シアノ、ニトロ、 $P(O)(O-C_1\sim C_6\text{アルキル})_2$ 、 $CON(C_1\sim C_6\text{アルキル})_2$ 、 CO
 $NH(C_1\sim C_6\text{アルキル})$ 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_4$
 アルキルカルボニルなどの電子求引基である)の化合物と、塩基の存在下で、場合によっ
 てはさらに希釈剤の存在下で、場合によってはさらに錯化剤の存在下で、 $-120^\circ\text{C}\sim 100^\circ\text{C}$
 の温度範囲 ($-80^\circ\text{C}\sim 50^\circ\text{C}$ が好ましい) にて反応させることもできる。このような方法は
 文献で知られており、例えば、J. Org. Chem.、2002年、第67巻、5216～5225ページ；Het
 erocycles、2002年、第57巻、2267～2278ページに記載されている。

【0149】

一般式 (Ia) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義した通りであり、mが2である化
 合物は、c) 一般式：

【化5】

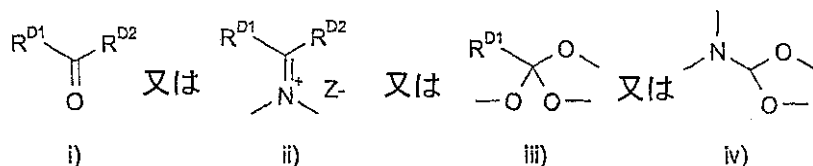


(ただし、AはOまたはSであり、 R^C は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、フェニル
 (置換されていないか、フェニル環上で $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、ニトロ、シアノ、ハロゲン
 のいずれかによって置換されている)、ベンジル (置換されていないか、 $C_1\sim C_6$ ハロアル
 キル、ニトロ、シアノ、ハロゲンのいずれかによって置換されている)、トリ- $C_1\sim C_4$ ア
 ルキルシリル、 $C_1\sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、ベンジルカル
 ボニル (置換されていないか、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、ニトロ、シアノ、ハロゲンのい
 ずれかによって置換されている)、フェニルカルボニル (置換されていないか、 $C_1\sim C_6$ ハ
 ロアルキル、ニトロ、シアノ、ハロゲンのいずれかによって置換されている)、 $C_1\sim C_6$ アル
 キルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ベンジルスルホニル (置換され
 ていないか、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、ニトロ、シアノ、ハロゲンのいずれかによって置換さ
 れている)、 $C_1\sim C_6$ フェニルスルホニル (置換されていないか、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、ニ
 トロ、シアノ、ハロゲンのいずれかによって置換されている) のいずれかである) の化合
 物と、場合によっては塩基の存在下で、場合によってはさらに希釈剤の存在下で、場合によ
 ってはさらに錯化剤の存在下で、 $-120^\circ\text{C}\sim 100^\circ\text{C}$ の温度範囲 ($-80^\circ\text{C}\sim 50^\circ\text{C}$ が好ましい)
 にて反応させることもできる。このような方法は文献で知られており、例えば、Eur. J.
 Org. Chem.、2000年、第16巻、2851～2860ページ；J. Org. Chem.、1996年、第61巻、500
 4～5012ページ；Tetrahedron、1995年、第51巻、2763～2776ページに記載されている。

【0150】

一般式 (Ia) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義した通りであり、mが2である化
 合物は、d) 一般式：

【化6】



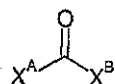
(ただし、 R^{D1} と R^{D2} は水素または $C_1\sim C_6$ アルキルであり、Zは適切な対イオン (例えばハ
 ロゲン) である) と、場合によっては塩基の存在下で、場合によってはさらに希釈剤の存
 在下で、場合によってはさらに錯化剤の存在下で、場合によってはさらにルイス酸の存在

下で、 $-120^{\circ}\text{C}\sim 100^{\circ}\text{C}$ の温度範囲 ($-80^{\circ}\text{C}\sim 50^{\circ}\text{C}$ が好ましい) にて反応させることもできる。このような方法は文献で知られており、例えば、J. Org. Chem.、2002年、第67巻、5216～5225ページ；Chem. Europ. J.、1999年、第5巻、1355～1363ページ；J. Amer. Chem. Soc.、1974年、第96巻、2275～2276ページ；Synthesis、1984年、第12巻、1045～1047ページに記載されている。試薬ii) は、Tetrahedron Lett.、2004年、第45巻、3345～3348ページに記載されているようにして、無水酢酸の存在下でN,N,N',N'-テトラメチルジアミノメタンからその場で合成することができる。

【0151】

一般式 (Ia) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義した通りであり、mが2である化合物は、e) 一般式：

【化7】



(ただし、 X^{A} と X^{B} は、それぞれ互いに独立に、Cl、 OCCl_3 、1-イミダゾリルなどの適切な離脱基である) および一般式：



(ただし、 R^7 と R^8 は上に定義した通りである) と、塩基の存在下で、場合によってはさらに希釈剤の存在下で、場合によってはさらに錯化剤の存在下で、 $-120^{\circ}\text{C}\sim 100^{\circ}\text{C}$ の温度範囲 ($-80^{\circ}\text{C}\sim 50^{\circ}\text{C}$ が好ましい) にて反応させることもできる。

【0152】

上記の方法における希釈剤として、不活性な溶媒 (例えば、炭化水素、エーテル (THF や1,2-ジメトキシエタンなど)、N,N-ジメチルホルムアミド、ハロゲン化炭化水素 (ジクロロメタンなど))、またはこれらの混合物を用いることができる。塩基としては、例えば、アルキル-リチウム化合物 (例えばメチル-リチウム、n-ブチル-リチウム、t-ブチル-リチウム)、リチウムジアルキルアミド (例えばリチウムジイソプロピルアミド)、金属水素化物 (アルカリ金属水素化物が好ましく、例えば水素化ナトリウムが挙げられる)、アルカリ金属アミド (例えばナトリウムアミド)、金属ビス(トリ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル)シリル)アミド (例えばリチウムビス(トリメチルシリル)アミド)、金属アルコキシド (例えばカリウムt-ブトキシド)、ホスファゼン塩基 (例えばN'-t-ブチル-N,N,N',N',N'',N''-ヘキサメチルホスホルイミドトリアミド ($\text{P}_1\text{-}^t\text{Bu}$)、1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) ($\text{P}_2\text{-Et}$)、1-t-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) ($\text{P}_2\text{-}^t\text{Bu}$)、2-t-ブチルイミノ-2-ジエチルアミノ-1,3-ジメチル-ペルヒドロ-1,3,2-ジアザホスホリン (BEMP)、2,8,9-トリイソブチル-2,5,8,9-テトラアザ-1-ホスファビシクロ[3.3.3]ウンデカン (フェルカーデ塩基)) が可能である。錯化剤としては、例えば、1,3-ジメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジノン (DMPU)、ヘキサメチルホスホルアミド (HMPA)、テトラメチルエチレンジアミン (TMEDA) が可能である。ルイス酸としては、例えば、 SnCl_4 、 AlCl_3 、 ZnCl_2 が可能である。

【0153】

方法a)、b)、c)、e) は、独立に、または繰り返して、または互いに組み合わせて実施することができる。

【0154】

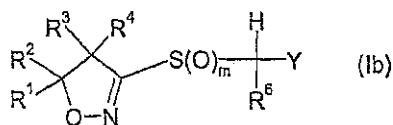
一般式 (Ia) の化合物は、例えばWO 01/012613、WO 02/062770、WO 03/000686、WO 04/010165、WO 04/013106によって公知である。

【0155】

方法a) が有用なのは、特に、一般式 (I) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義し

た通りであり、 R^5 がハロゲンであり、 R^6 が水素またはハロゲンであり、 m が2であり、 n が1である化合物の調製を：

【化 8】



10

一般式 (Ia) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y が上に定義した通りであり、 m が2である化合物（上記のもの）を単一のステップまたは連続したステップで、一般式 R^5 -Xおよび／または R^6 -Xの化合物（ただし R^5 および／または R^6 は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素などのハロゲンであり、Xは上記の適切な離脱基である）をハロゲン化することによって行なう場合である。好ましい試薬は、フッ素化に関してはN-フルオロベンゼンスルホンイミド (NFSI) または1-(クロロメチル)-4-フルオロ-1,4-ジアゾニアビスクロ[2.2.2]オクタンビス(テトラフルオロボレート) (SELECTFLUOR) であり、塩素化に関してはN-クロロスクシンイミド (NCS) またはヘキサクロロエタンであり、臭素化に関してはN-ブロモスクシンイミド (NBS) またはフェニルトリメチルアミノトリブロミド (PTT) であり、ヨウ素化に関してはN-ヨードスクシンイミド (NIS) である。ハロゲン化は、不活性な溶媒（エーテルが好ましく、例えばTHFが挙げられる）の中で、塩基（ホスファゼン塩基が好ましく、1-*t*-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P_2 -^{*t*}Bu)、1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P_2 -Et)、2,8,9-トリイソブチル-2,5,8,9-テトラアザ-1-ホスファビスクロ[3.3.3]ウンデカン（フェルカーデ塩基）などが挙げられる）の存在下で、0℃～50℃の温度範囲（0℃～30℃が好ましい）にて実施することが好ましい。あるいはハロゲン化は、アルコキシド塩基（例えばカリウム*t*-ブトキシド）の存在下で、さらに希釈剤（エーテルが好ましく、例えばTHFが挙げられる）の存在下で、-100℃～50℃の温度範囲（-80℃～0℃が好ましい）にて実施する。あるいはハロゲン化は、アルキル-リチウム化合物（例えば*n*-ブチルリチウム）の存在下で、さらに錯化剤（例えば1,3-ジメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジノン (DMPU)）の存在下で、さらに希釈剤（エーテルが好ましく、例えばTHFが挙げられる）の存在下で、-100℃～50℃の温度範囲（-80℃～0℃が好ましい）にて実施する。あるいはハロゲン化は、金属ビス(トリ(C_1 ～ C_6 アルキル)シリル)アミド（例えばナトリウムビス(トリメチルシリル)アミド）の存在下で、さらに希釈剤（エーテルが好ましく、例えばTHFが挙げられる）の存在下で、-100℃～50℃の温度範囲（-80℃～0℃が好ましい）にて実施する。

20

30

【0156】

さらに、方法a)が有用なのは、一般式 (I) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Y が上に定義した通りであり、 R^6 が C_1 ～ C_{10} アルキルまたはハロゲンであり、 m が2であり、 n が1である化合物の調製を、一般式 (Ib) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y が上に定義した通りであり、 m が2であり、 R^6 が C_1 ～ C_{10} アルキル（例えばメチル）またはハロゲン（例えば塩素またはフッ素）である化合物を、一般式 R^5 -Xの化合物（ただし R^5 は上に定義した通りであり、Xは上記の適切な離脱基である）と、塩基の存在下で、場合によってはさらに希釈剤（不活性な溶媒が好ましい）の存在下で、場合によってはさらに錯化剤の存在下で、-120℃～100℃の温度範囲（-80℃～50℃が好ましい）にて反応させることによって行なう場合である。

40

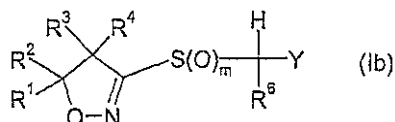
【0157】

方法a)が有用なのは、特に、一般式 (I) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 がハロゲンであり、 R^6 が C_1 ～ C_{10} アルキルまたはハロゲンであり、 m が2

50

であり、nが1である化合物の調製を：

【化 9】

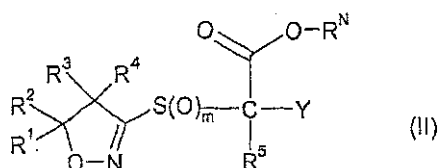


一般式 (Ib) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義した通りであり、mが2であり、 R^6 が $C_1 \sim C_{10}$ アルキル（例えばメチル）またはハロゲン（例えば塩素またはフッ素）である化合物を、一般式 R^5 -Xの化合物（ただし R^5 は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素などのハロゲンであり、Xは上記の適切な離脱基である）を用いてハロゲン化することによって行なう場合である。好ましい試薬は、フッ素化に関してはN-フルオロベンゼンスルホンイミド（NFSI）または1-(クロロメチル)-4-フルオロ-1,4-ジアゾニアビスクロ[2.2.2]オクタンビス(テトラフルオロボレート)（SELECTFLUOR）であり、塩素化に関してはN-クロロスクシンイミド（NCS）またはヘキサクロロエタンであり、臭素化に関してはN-ブロモスクシンイミド（NBS）またはフェニルトリメチルアミノトリプロミド（PTT）であり、ヨウ素化に関してはN-ヨードスクシンイミド（NIS）である。ハロゲン化は、不活性な溶媒（エーテルが好ましく、例えばTHFが挙げられる）の中で、塩基（ホスファゼン塩基が好ましく、1-t-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P_2 -^tBu)、1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P_2 -Et)、2,8,9-トリイソブチル-2,5,8,9-テトラアザ-1-ホスファビスクロ[3.3.3]ウンデカン（フェルカーデ塩基）などが挙げられる）の存在下で、0℃～50℃の温度範囲（0℃～30℃が好ましい）にて実施することが好ましい。あるいはハロゲン化は、アルコキシド塩基（例えばカリウムt-ブトキシド）の存在下で、さらに希釈剤（エーテルが好ましく、例えばTHFが挙げられる）の存在下で、-100℃～50℃の温度範囲（-80℃～0℃が好ましい）にて実施する。あるいはハロゲン化は、アルキル-リチウム化合物（例えばn-ブチルリチウム）の存在下で、さらに錯化剤（例えば1,3-ジメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジノン（DMPU））の存在下で、さらに希釈剤（エーテルが好ましく、例えばTHFが挙げられる）の存在下で、-100℃～50℃の温度範囲（-80℃～0℃が好ましい）にて実施する。あるいはハロゲン化は、金属ビス(トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)シリル)アミド（例えばナトリウムビス(トリメチルシリル)アミド）の存在下で、さらに希釈剤（エーテルが好ましく、例えばTHFが挙げられる）の存在下で、-100℃～50℃の温度範囲（-80℃～0℃が好ましい）にて実施する。

【0158】

さらに、一般式 (I) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、Yが上に定義した通りであり、 R^6 が水素であり、mが2であり、nが1である化合物は、一般式 (II) の化合物：

【化 10】



（ただし、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、Yは上に定義した通りであり、 R^N は $C_1 \sim C_6$ アルキルまた

はアリルであり、 m は2である）から出発して、この化合物を脱カルボキシル化することによって調製できる。このような反応は文献で知られており、場合によっては塩基（例えばアルカリ金属水酸化物であり、NaOHやLiOHなどが挙げられる）の存在下で（J. Org. Chem., 1998年、第63巻、220～221ページ）、または場合によっては無機酸や有機酸（例えばHCl、 H_2SO_4 、酢酸）の存在下で（Synthesis, 1997年、第6巻、691～695ページ）、または場合によっては中性条件下で（Tetrahedron, 1995年、第51巻、8573～8574ページ；J. Chem. Soc. Perkin Trans., 第1巻、1985年、1541～1546ページ）実施することができる。希釈剤としては、通常は、エーテル（例えばTHF、ジオキサン）、アルコール（例えばメタノール、エタノール）、DMSO、水、またはこれらの混合物が用いられ、反応は、通常は、 $-20^{\circ}C \sim 200^{\circ}C$ の範囲（ $25^{\circ}C \sim 160^{\circ}C$ が好ましい）で実施される。

10

【0159】

一般式 (II) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Y が上に定義した通りであり、 R^N が $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリルであり、 m が2である化合物は、例えば、一般式 (II) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 が水素であり、 R^N が $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリルであり、 m が2である化合物から出発して、場合に応じてa)～c) またはe) に記載した方法で調製することができる。

【0160】

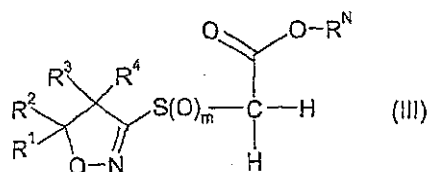
一般式 (II) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 が水素であり、 R^N が $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリルであり、 m が2である化合物は、例えば、一般式 (Ia) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y が上に定義した通りであり、 m が2である化合物（上記のもの）から出発し、試薬 $R^N-O_2CX^A$ （ただし R^N は $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリルであり、 X^A は上記の適切な離脱基である）を用いてa)の方法で調製することができる。

20

【0161】

あるいは一般式 (II) において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y が上に定義した通りであり、 R^5 が水素であり、 R^N が $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリルであり、 m が2である化合物は、一般式 (II I) の化合物：

【化11】



30

（ただし、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 は上に定義した通りであり、 R^N は $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはアリルであり、 m は2である）を、一般式 $Y-X^C$ の化合物（ただし、 Y は電子が少ない活性化された芳香族基または複素芳香族基であり、 X^C は、ハロゲン、ニトロ、スルホン酸アルキル（スルホン酸メチルなど）、スルホン酸アリール（スルホン酸フェニルなど）、スルホン酸ハロアルキル（スルホン酸トリフルオロメチルなど）の適切な離脱基である）と、場合によっては塩基（例えばジアルキルアミド（リチウムジイソプロピルアミドなど）、金属水素化物（アルカリ金属水素化物が好ましく、例えば水素化ナトリウムが挙げられる）、金属ビス(トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)シリル)アミド（リチウムビス(トリメチルシリル)アミドなど）、金属アルコキシド（カリウム t -ブトキシドなど）ホスファゼン塩基（ N' - t -ブチル- N,N,N',N'',N'' -ヘキサメチルホスホリミドトリアミド（ P_1-tBu ）、1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン)（ P_2-Et ）、1- t -ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン)（ P_2-tBu ）、2- t -ブチルイミノ-2-ジエチルアミノ-1,3-ジメチル-ベルヒドロ-1,3,2-ジアザホスホリン（BEMP）、2,8,9-トリイソブチル-2,5,8,9-テトラア

40

50

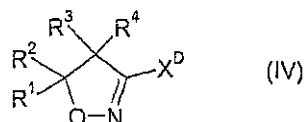
ザ-1-ホスファビシクロ[3.3.3]ウンデカン（フェルカーデ塩基）など）の存在下で、場合によってはさらに希釈剤（例えばTHF、DMF、ジオキサン）の存在下で、 $-120^{\circ}\text{C}\sim 150^{\circ}\text{C}$ の範囲（ $-20^{\circ}\text{C}\sim 120^{\circ}\text{C}$ が好ましい）にて反応させて得ることもできる。このような方法は文献で知られており、例えばSymthesis、1997年、第6巻、691～695ページや、Chem. Heterocycl. Compd.（英訳）、1984年、第20巻、676～680ページに記載されている。

【0162】

一般式（III）において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 が上に定義した通りであり、 R^N が $C_1\sim C_6$ アルキルまたはアリルであり、 m が1または2である化合物は、例えば、一般式（III）において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 が上に定義した通りであり、 R^N が $C_1\sim C_6$ アルキルまたはアリルであり、 m が0である化合物を、適切な有機または無機の酸化剤（例えばペルオキシ酸（3-クロロペルオキシ安息香酸、過酢酸など）、過酸化水素、アルコキシペルオキシド、過ヨウ素酸塩（過ヨウ素酸ナトリウムなど））と、場合によっては希釈剤（例えばハロゲン化炭化水素（ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタンなど）、アルコール（メタノールなど）、N,N-ジメチルホルムアミド、水、酢酸、またはこれらの混合物）の存在下で反応させて酸化することによって得られる。反応は、通常は、 $-80^{\circ}\text{C}\sim 120^{\circ}\text{C}$ の範囲（ $-20^{\circ}\text{C}\sim 50^{\circ}\text{C}$ が好ましい）にて実施する。このような方法は文献で知られており、例えば、J. Org. Chem.、2003年、第68巻、3849～3859ページ；J. Med. Chem.、2003年、第46巻、3021～3032ページ；J. Org. Chem.、2003年、第68巻、500～511ページ；Bioorg. Med. Chem.、1999年、第9巻、1837～1844ページに記載されている。 m が0である硫化物を m が1である対応するスルホキシドに変換するには、または m が1であるスルホキシドを m が2である対応するスルホンに変換するには、1当量の酸化剤が必要とされる。 m が0である硫化物を m が2である対応するスルホンに変換するには、2当量の酸化剤が必要とされる。

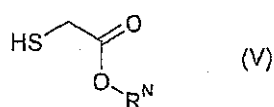
【0163】

一般式（III）において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 が上に定義した通りであり、 R^N が $C_1\sim C_6$ アルキルまたはアリルであり、 m が0である化合物は、例えば、一般式（IV）の化合物：



（ただし、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 は上に定義した通りであり、 X^D は、ハロゲン（例えば塩化物）、アルキルスルホニル基（例えばメチルスルホニル）、アリールスルホニル基（例えばフェニルスルホニル）、ハロアルキルスルホニル基（例えばトリフルオロメチルスルホニル）、ニトロなどの適切な離脱基である）から出発して、一般式（V）の化合物：

【化13】



（ただし、 R^N は $C_1\sim C_6$ アルキルまたはアリルである）と、場合によっては塩基（アルカリ金属水素化物（例えば水素化ナトリウム）、炭酸アルカリ金属（例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム）、塩基性アミン（例えばトリエチルアミン、ピリジン）など）の存在下で、場合によってはさらに希釈剤（例えばDMF、アセトン、エーテル（THFなど））の存在下

で、 $-20^{\circ}\text{C} \sim 120^{\circ}\text{C}$ の範囲 ($0^{\circ}\text{C} \sim 80^{\circ}\text{C}$ が好ましい) にて反応させることによって調製できる。

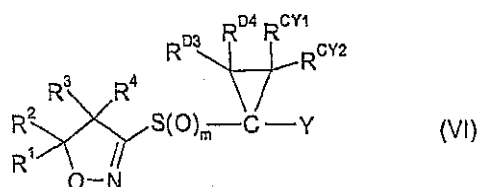
【0164】

一般式 (IV) の化合物は、例えば WO 01/12613、WO 02/062770、WO 03/000686 によって公知であり、一般式 (V) の化合物は市販されている。

【0165】

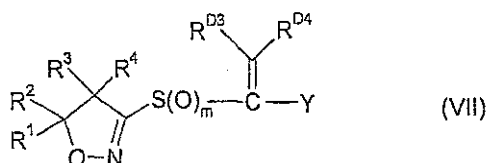
一般式 (IV) の化合物は、一般式 (I) において、 R^5 と R^6 が、これらの基が結合している炭素原子と合わさってシクロプロピル環を形成していて、このシクロプロピル環が、場合によっては1~4個の置換基で置換され、その置換基の選択が、独立に、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシカルボニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルカルボニル、ニトロ、フェニルカルボニルの中からなされ、 m が2であり、 n が1である化合物の例である。一般式 (IV) の化合物：

【化14】



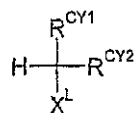
(ただし、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 は上に定義した通りであり、 m は2であり、 $\text{R}^{\text{D}3}$ と $\text{R}^{\text{D}4}$ は水素または $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり、 $\text{R}^{\text{CY}1}$ と $\text{R}^{\text{CY}2}$ は、水素、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシカルボニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、ニトロのいずれかである) は、公知の方法により、一般式 (VII) の化合物：

【化15】



(ただし、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 は上に定義した通りであり、 m は2であり、 $\text{R}^{\text{D}3}$ と $\text{R}^{\text{D}4}$ は水素または $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルである) (この一般式 (VII) の化合物は、調製することができる) から出発して、方法d) に記載されているようにして、例えば、ハロゲン化トリ ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)スルホニウム (ヨウ化トリメチルスルホニウムなど) またはハロゲン化トリ ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)スルホキソニウム (ヨウ化トリメチルスルホキソニウムなど) と、塩基 (例えばアルカリ金属ハロゲン化物 (NaH など) またはアルカリ金属水酸化物 (NaOH 、 KOH など)) の存在下で、さらに希釈剤 (例えばDMSO、DMF、水、ジクロロメタン、またはこれらの混合物) の存在下で、通常は $0^{\circ}\text{C} \sim 50^{\circ}\text{C}$ の温度範囲にて反応させて調製すること (Indian J. Chem. Sect. B、1982年、第21巻、1092~1094ページ；J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1、1997年、第20巻、3035~3042ページ)、またはジアゾメタンと、希釈剤 (例えばエーテル (ジエチルエーテルなど)) の存在下で、通常は $-25^{\circ}\text{C} \sim 0^{\circ}\text{C}$ の温度範囲にて反応させて調製すること (Heterocycles、1995年、第40巻、191~204ページ)、または一般式：

【化 16】



の化合物（ただし、 R^{CY1} と R^{CY2} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、フェニルカルボニル、ニトロのいずれかであり、 R^{CY1} はさらに水素であってもよく、 X^L は適切な置換基（例えばハロゲン）である）を、塩基（例えばアルカリ金属水酸化物（NaOHなど）、アルキル-リチウム化合物（*n*-ブチル-リチウムなど）、リチウムジアルキルアミド（リチウムジイソプロピルアミドなど）、金属水素化物（アルカリ金属水素化物が好ましく、水素化ナトリウムが挙げられる）、金属ビス(トリ($C_1 \sim C_6$ アルキル)シリル)アミド（リチウムビス(トリメチルシリル)アミドなど）、アルカリ金属炭酸塩（炭酸カリウムなど））の存在下で、さらに希釈剤（例えばテトラヒドロフラン（THF）、アセトニトリル、水、ハロゲン化炭化水素（クロロホルムなど）、またはこれら溶媒の混合物（例えば水とクロロホルム））の存在下で、場合によっては相間移動触媒（例えば塩化トリエチルベンジルアンモニウム）の存在下で、通寿命は $-80^\circ\text{C} \sim 20^\circ\text{C}$ の温度範囲にて反応させて調製すること（Indian J. Chem. Sect. B, 1997年、第36巻、608～611ページ；Synth. Commun., 1986年、第16巻、1255～1259ページ；Tetrahedron, 2001年、第57巻、9423～9427ページ）ができる。

【0166】

一般式（I）において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 Y が上に定義した通りであり、 R^6 が水素であり、 m が2であり、 n が1である化合物は、公知の方法により、例えば一般式（VII）において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y が上に定義した通りであり、 R^{D3} と R^{D4} が水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 m が1または2であるマイケル受容体として化合物（上記のもの）を、一般式 R^{D5} -Mまたは R^{D5} -Hの求核剤（ただし R^{D5} -Mは適切な塩または有機金属化合物であり、Mは、例えばLi、MgBr、Na、K、テトラアルキルアンモニウムのいずれかであり、 R^{D5} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、シアノ、ニトロ- $C_1 \sim C_6$ アルキルイミダゾリル、トリアゾリル、インダゾリル、ピラゾリルなどの求核剤である）と反応させることによって調製できる。化合物 R^{D5} -Mは、あらかじめ形成すること、またはその場で生成させることができる。反応は、 R^{D5} -H（ただし R^{D5} は、例えば、イミダゾリル、トリアゾリル、インダゾリル、ピラゾリルのいずれかである）を、中性条件下で用いて実施することもできる。溶媒として、エーテル（例えばTHF）、ハロゲン化溶媒（例えばジクロロメタン）、アルコール（例えばメタノール）、アセトニトリル、アセトンを、 $-120^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の温度範囲（ $-80^\circ\text{C} \sim 50^\circ\text{C}$ が好ましい）でを使用することができる。このような方法は文献で知られており、例えばTetrahedron Letters, 2002年、第43巻(17)、3175～3179ページ；Tetrahedron Letters, 1992年、第33巻(1)、131～134ページ；Journal of Organic Chemistry, 1991年、第56巻(13)、4098～4112ページ；Tetrahedron, 1989年、第45巻(18)、5805～5814ページに記載されている。

【0167】

さらに、一般式（I）において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 Y 、 n が上に定義した通りであり、 m が1または2である化合物は、公知の方法により、一般式（I）において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 Y 、 n が上に定義した通りであり、 m がそれぞれ0または1である化合物から出発して、その化合物を適切な有機または無機の酸化剤（例えばペルオキシ酸（3-クロロペルオキシ安息香酸、過酢酸など）、過酸化水素、アルコキシペルオキシド、過ヨウ素酸塩（過ヨウ素酸ナトリウムなど））と、場合によっては希釈剤（例えばハロゲン化炭化水素（ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタンなど）、アルコール（メタノールなど）、N,

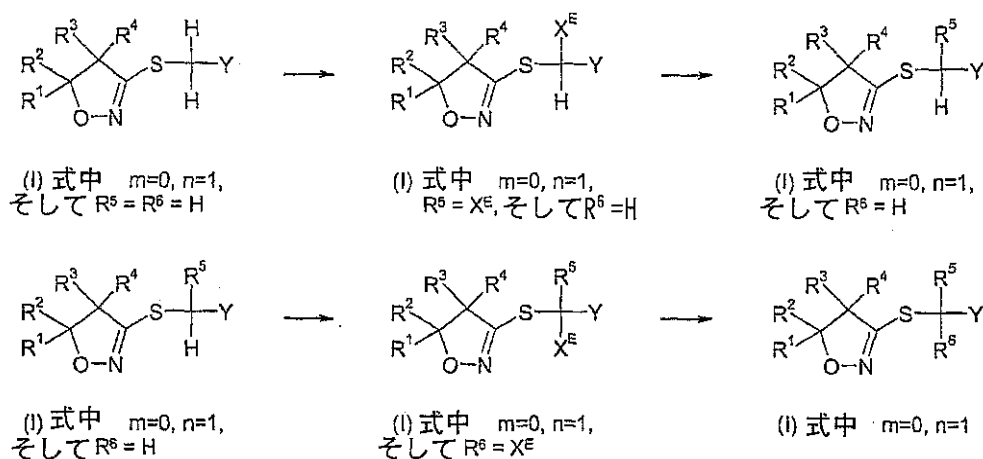
N-ジメチルホルムアミド、水、酢酸、またはこれらの混合物)の存在下で反応させて酸化することによって調製できる。反応は、通常は、 $-80^{\circ}\text{C} \sim 150^{\circ}\text{C}$ の範囲($-20^{\circ}\text{C} \sim 120^{\circ}\text{C}$ が好ましい)にて実施する。このような方法は文献で知られており、例えば、J. Org. Chem.、2003年、第68巻、3849~3859ページ；J. Med. Chem.、2003年、第46巻、3021~3032ページ；J. Org. Chem.、2003年、第68巻、500~511ページ；Bioorg. Med. Chem.、1999年、第9巻、1837~1844ページに記載されている。mが0である硫化物をmが1である対応するスルホキシドに変換するには、またはmが1であるスルホキシドをmが2である対応するスルホンに変換するには、1当量の酸化剤が必要とされる。mが0である硫化物をmが2である対応するスルホンに変換するには、2当量の酸化剤が必要とされる。

【0168】

10

一般式(I)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、Yが上に定義した通りであり、mが0であり、nが1である化合物は、例えば、一般式(I)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義した通りであり、 R^5 と R^6 が水素であり、mが0であり、nが1である化合物、または一般式(I)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、Yが上に定義した通りであり、 R^6 が水素であり、mが0であり、nが1である化合物から出発し、

【化17】



20

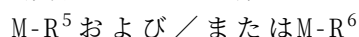
30

これらの化合物をハロゲン化剤(例えば臭素、N-ハロスクシンイミド(N-クロロスクシンイミドやN-ブロモスクシンイミドなど))と、場合によっては希釈剤(例えば酢酸、ハロゲン化炭化水素(CCl_4 やジクロロメタンなど))の存在下で、 $-80^{\circ}\text{C} \sim 120^{\circ}\text{C}$ の温度範囲($-20^{\circ}\text{C} \sim 60^{\circ}\text{C}$ が好ましい)にて反応させて、一般式(I)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義した通りであり、 R^5 が X^E (X^E はハロゲン)であり、 R^6 が水素であり、mが0であり、nが1である化合物、または一般式(I)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、Yが上に定義した通りであり、 R^6 が X^E (X^E はハロゲン)であり、mが0であり、nが1である化合物をそれぞれ形成することによって調製できる。

40

【0169】

次に、一般式(I)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義した通りであり、 R^5 が X^E (X^E はハロゲン)であり、 R^6 が水素であり、mが0であり、nが1である化合物、または一般式(I)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、Yが上に定義した通りであり、 R^6 が X^E (X^E はハロゲン)であり、mが0であり、nが1である化合物は、上記のようにして直接酸化すること、または場合によっては第2ステップまたは第3ステップにおいて、一般式：



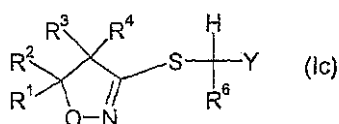
(ただし R^5 と R^6 は上に定義した通りであり、 $\text{M}-\text{R}^5$ と $\text{M}-\text{R}^6$ は、適切な塩または有機金属化合物であり、Mは、例えばLi、MgBr、Na、K、テトラアルキルアンモニウムのいずれかである)と、場合によってはルイス酸(例えば SnCl_4)の存在下で、場合によってはさらに錯化

50

剤（例えばヘキサメチルホスホルアミド（HMPA）または1,3-ジメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジノン（DMPU））の存在下で、場合によってはさらに希釈剤（例えばアセトニトリル、ジクロロメタン、エーテル、THF）の存在下で、 $-120^{\circ}\text{C}\sim 100^{\circ}\text{C}$ の温度範囲（ $-80^{\circ}\text{C}\sim 80^{\circ}\text{C}$ が好ましい）にて反応させることができる。このような方法は文献で知られており、例えば、J. Org. Chem.、1998年、第63巻、3706～3716ページ；J. Chem. Soc. Perkin Trans.、1995年、第22巻、2845～2848ページ；Synthesis、1982年、第2巻、131～132ページ；Liebigs Annalen、1993年、49～54ページ；Synth. Commun.、1990年、第20巻、1943～1948ページに記載されている。

【0170】

一般式（I）において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、Yが上に定義した通りであり、 R^5 が、塩素、臭素、ヨウ素のいずれかであり、mが1または2であり、nが1である化合物は、一般式（Ic）の化合物：



10

20

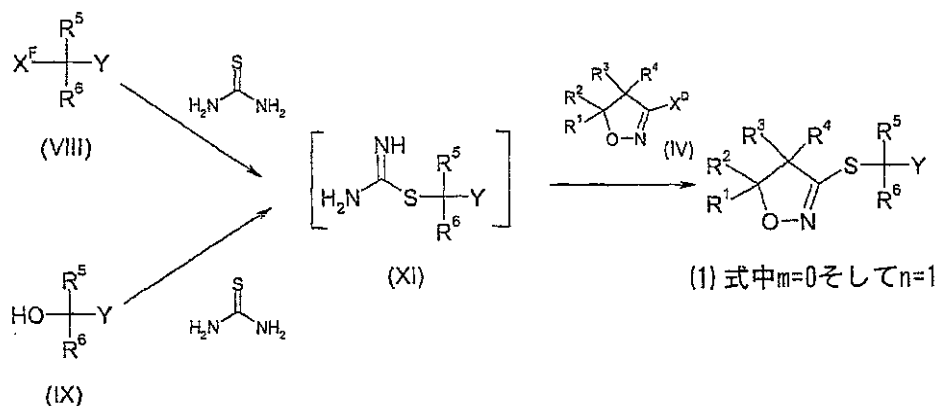
（ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^6 、Yは上に定義した通りである）を、不活性な溶媒中で、まず最初にN-ハロスクシンイミドと反応させ、次いで上記の酸化剤のうちの1つと反応させることによって調製できる。

【0171】

あるいは一般式（I）において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、Yが上に定義した通りであり、mが0であり、nが1である化合物は、一般式（VIII）において、 R^5 、 R^6 、Yが上に定義した通りであり、 X^F が離脱基（例えばハロゲン（臭化物や塩化物など）、スルホン酸アルキル（スルホン酸メチルなど）、スルホン酸アリール（トシラートなど））である化合物を、チオ尿素と、場合によっては希釈剤（例えばアルコール（エタノールなど））の存在下で、場合によってはさらにアルカリ金属ヨウ化物（例えばヨウ化ナトリウム、ヨウ化カリウム）の存在下で、 $-30^{\circ}\text{C}\sim 100^{\circ}\text{C}$ に温度範囲（ $0^{\circ}\text{C}\sim 80^{\circ}\text{C}$ が好ましい）にて反応させて一般式（XI）のイソチオ尿素中間体を取得し、それを一般式（IV）の化合物：

30

【化19】



40

（ただし R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 は上に定義した通りであり、 X^D は適切な離脱基（例えばハロゲン

50

(塩化物など)、アルキルスルホニル基(メチルスルホニルなど)、アリールスルホニル基(フェニルスルホニルなど)、ハロアルキルスルホニル基(トリフルオロメチルスルホニルなど)、ニトロ)である)と、塩基(例えば炭酸塩(炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウムなど)、水酸化物(水酸化カリウムなど)、アルコキシド(ナトリウムアルコキシドなど))の存在下で、場合によってはさらに希釈剤(例えばアルコール(エタノールなど)、エーテル(1,4-ジオキサン、THFなど)、極性溶媒(水、DMFなど)、または溶媒の混合物(1,4-ジオキサンと水の混合物))の存在下で、20℃～200℃の温度範囲(50℃～150℃が好ましい)にて、場合によっては不活性ガス(例えば窒素)の存在下で、場合によってはマイクロ波を照射して反応させることによって調製できる。このような方法は文献で知られており、例えばWO 04/0131106に記載されている。

10

【0172】

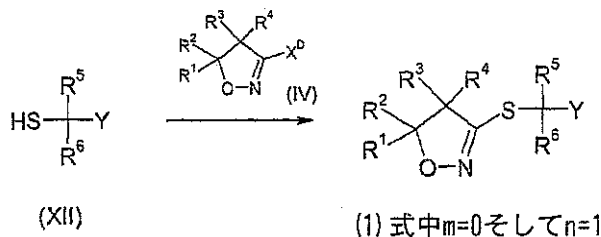
一般式(XI)において、 R^5 、 R^6 、Yが上に定義した通りである中間体を調製するさらに別の方法は、一般式(IX)において、 R^5 、 R^6 、Yが上に定義した通りである化合物を、チオ尿素と、酸(例えば無機酸(塩酸、臭化水素酸、硫酸など)、有機酸(トリフルオロ酢酸など))の存在下で、場合によってはさらに希釈剤(例えばエーテル(1,4-ジオキサン、THFなど)、極性溶媒(水、DMFなど)、または溶媒の混合物(1,4-ジオキサンと水の混合物))の存在下で、20℃～270℃の温度範囲(20℃～150℃が好ましい)にて、場合によってはマイクロ波を照射して反応させるというものである。このような方法は文献で知られており、例えば、BuchwaldとNielsen、JACS、第110巻(10)、3171～3175ページ、1988年；FrankとSmith、JACS、第68巻、2103～2104ページ、1946年；Vetter、Syn. Comm.、第28巻、3219～3233ページ、1998年に記載されている。

20

【0173】

一般式(I)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、Yが上に定義した通りであり、mが0であり、nが1である化合物は、一般式(XII)において、 R^5 、 R^6 、Yが上に定義した通りである化合物を、

【化20】



30

一般式(IV)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 が上に定義した通りであり、 X^D が適切な離脱基(例えばハロゲン(塩化物など)、アルキルスルホニル基(メチルスルホニルなど)、アリールスルホニル基(フェニルスルホニルなど)、ハロアルキルスルホニル基(トリフルオロメチルスルホニルなど)、ニトロ)である化合物と、塩基(例えば炭酸カリウム)の存在下で、場合によってはさらに希釈剤(例えばDMF)の存在下で、0℃～100℃の温度範囲(20℃～50℃が好ましい)にて、場合によっては不活性雰囲気下(例えば窒素)で反応させるというものである。このような方法は文献で知られており、例えば、WO 01/012613、WO 02/062770、WO 04/010165に記載されている。

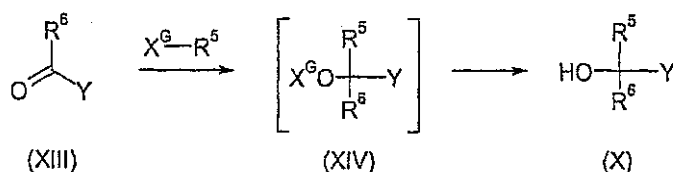
40

【0174】

R^5 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル(特にペルフルオロアルキル(トリフルオロメチルなど))である特別な場合には、一般式(I)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、Yが上に定義した通りであり、 R^6 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルのいずれかであり、mが0であり、nが1である化合物は、一般式(XIII)のカルボニル化合物：

50

【化 2 1】



10

(ただし、Yは上に定義した通りであり、R⁶は、水素、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキルのいずれかである)を、試薬R⁵-X^G(ただしX^Gはトリアルキルシリル基(例えばトリメチルシリル)である)と、開始剤(例えばフッ化物(フッ化セシウム、フッ化テトラブチルアンモニウム、フッ化カリウム)、アルコキシド)の存在下で、場合によってはさらに希釈剤(例えばエーテル(THF、1,4-ジオキサンなど))の存在下で、0℃~100℃の温度範囲(20℃~30℃が好ましい)にて反応させて一般式(XIV)のシリル化された中間体を形成することによって調製するとよい。一般に、一般式(XIV)のこのシリル化された中間体を単離または精製することなしに、酸(例えば塩酸、臭化水素酸、酢酸)の存在下で、場合によっては追加の希釈剤(例えばエーテル(1,4-ジオキサン、THFなど)、極性溶媒(水、DMFなど)、または溶媒の混合物)の存在下で、0℃~100℃の温度範囲(20℃~30℃が好ましい)にて脱シリル化し、一般式(X)のアルコールを形成する。このような方法は文献で知られており、例えば、Chem. Rev.、1997年、第97巻、757~786ページ；J. Am. Chem. Soc.、1989年、第111巻、393ページ；J. Med. Chem.、1992年、第35巻、641ページ；J. Org. Chem.、1992年、第57巻、1124ページに記載されている。

20

【0175】

このようにして得られたアルコールは、例えばWO 01/012613やWO 02/062770に記載されているようにして、まず最初にアルコールをより適した離脱基(例えばハロゲン(臭化物など)、スルホン酸アルキル(スルホン酸メチルなど)、スルホン酸アリール(トシラートなど))で置換し、次いで一般式(IV)において、R¹、R²、R³、R⁴が上に定義した通りであり、X^Dが適切な離脱基(例えばハロゲン(塩化物など)、アルキルスルホニル基(メチルスルホニルなど)、アリールスルホニル基(フェニルスルホニルなど))である化合物(上記のもの)と、塩基(例えば炭酸カリウム、ヒドロ硫化ナトリウム水和物、ロンガリット塩(ヒドロキシメタンスルフィン酸ナトリウムとその水和物))の存在下で、場合によってはさらに希釈剤(例えばDMF)の存在下で、-20℃~150℃の温度範囲(0℃~40℃が好ましい)にて、場合によっては不活性ガス(例えば窒素)の存在下で反応させることによって誘導体化することができる。このような方法は文献で知られており、例えば、WO 01/012613、WO 02/062770、WO 04/010165に記載されている。

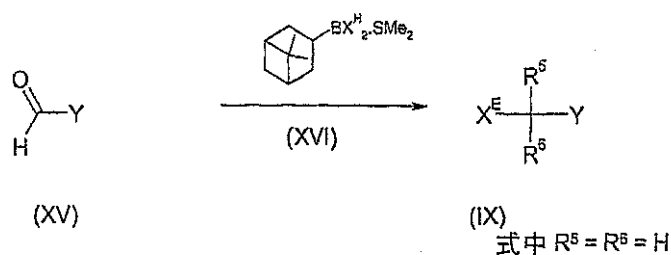
30

【0176】

さらに、一般式(IX)において、R⁵とR⁶が水素である化合物は、一般式(XV)の化合物を、試薬(XVI)

40

【化 2 2】



10

(ただし X^{H} はハロゲン原子(臭素、塩素など)である、)と、希釈剤(例えばハロゲン化炭化水素(ジクロロメタンなど)、炭化水素(ヘキサンなど)、アルコール(エタノールなど)、N,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン(THF)、またはこれらの混合物)の存在下で反応させることによって調製できる。芳香族ベンジルハロゲン化物の調製法は、Tetrahedron Letts., 2000年、第41巻、5161~5164ページに記載されている。試薬(XVI)の調製法は、J. Org. Chem., 1980年、第45巻、384~389ページに記載されている。

【0177】

20

本発明による一般式(I)の化合物は、合成で得られたままの修飾しない形態で除草剤として使用できるが、一般には、さまざまな調合用アジュバント(例えば基剤、溶媒、界面活性物質)を用いて除草組成物にされる。その組成物は、さまざまな物理的形態にすることができる。例えば、散布用粉末、ゲル、湿潤化可能な粉末、水に分散可能な顆粒、水に分散可能な錠剤、発泡性ペレット、乳化可能な濃縮液、マイクロエマルジョンにすることが可能な濃縮液、水中油型エマルジョン、高流動油、水性分散液、油性分散液、サスポエマルジョン、カプセル懸濁液、乳化可能な顆粒、可溶性液体、水溶性濃縮液(基剤として水、または水と混和可能な有機溶媒を用いる)、含浸ポリマー膜、または公知の他の形態(『植物保護製品のためのFAO仕様の開発と利用に関するマニュアル』、第5版、1999年からわかる)がある。このような組成物は、直接使用すること、または希釈してから使用することができる。希釈物は、例えば水、液体肥料、微量栄養素、生物学的有機体、油、溶媒を用いて製造することができる。

30

【0178】

組成物は、例えば活性成分を調合用アジュバントと混合し、細かく粉砕した固体、顆粒、溶液、分散液、エマルジョンの形態の調合剤にすることができる。活性成分は、他のアジュバント(例えば細かく粉砕した固体、鉱物油、植物起源の油、動物起源の油、植物起源の改質油、動物起源の改質油、有機溶媒、水、界面活性物質、またはこれらの組み合わせ)を用いて調合剤にすることもできる。活性成分は、ポリマーからなる非常に細かいマイクロカプセルに含有された状態にすることもできる。マイクロカプセルは、多孔性基質の中に活性成分を含んでいる。こうすることにより、制御された量の活性成分を環境中に放出することができる(例えばゆっくりとした放出)。マイクロカプセルは、通常は、直径が0.1~500ミクロンである。マイクロカプセルは、活性成分を、カプセルの重量の約25~95重量%の量を含んでいる。活性成分は、一体となった固体の形態、固体または液体中の微粒子の形態、適切な溶液の形態にすることができる。カプセル化用の膜は、例えば、天然ゴム、合成ゴム、セルロース、スチレン/ブタジエン・コポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタン、化学的に修飾したポリマー、キサンタン酸デンプンのいずれか、またはこの分野で当業者に知られている他のポリマーを含んでいる。あるいは活性成分をベースとなる物質からなる固体マトリックス中に細かく粉砕した粒子の形態で含む非常に細かいマイクロカプセルを形成することもできるが、マイクロカプセル自体はカプセルの中に入れることはない。

40

50

【0179】

本発明の組成物を調製するのに適した調合用アジュバントは公知である。液体基剤として使用できるのは、水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、炭酸ブチレン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、アビエチン酸ジエチレングリコール、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジ安息香酸ジプロピレングリコール、ジプロキシトール、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、炭酸エチレン、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、 α -ピネン、d-リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 γ -ブチロラクトン、グリセロール、酢酸グリセロール、二酢酸グリセロール、三酢酸グリセロール、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチルアミン、オクタデカン酸、酢酸オクチルアミン、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール（PEG400）、プロピオン酸、乳酸プロピル、炭酸プロピレン、プロピレングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱物油、トリクロロエチレン、ペルクロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、高分子量のアルコール（例えばアミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール）、N-メチル-2-ピロリドンなどである。濃縮液を希釈するための基剤として、水が一般に選択される。適切な固体基剤は、例えば、タルク、二酸化チタン、葉蠟石、シリカ、アタパルジャイト、珪藻土、石灰石、炭酸カルシウム、ベントナイト、カルシウムモンモリロナイト、綿実の殻、小麦粉、ダイズ粉、軽石、木材粉、粉碎したクルミの殻、リグニン、ならびに同様の物質であり、例えば CFR 180.1001.(c) と (d) に記載されている。

【0180】

好ましいことに、多数の界面活性物質を固体調合剤と液体調合剤の両方で使用することができる。特に使用前に基剤を用いて希釈することのできる調合剤で使用できる。界面活性物質は、アニオン性界面活性物質、カチオン性界面活性物質、非イオン性界面活性物質、ポリマー界面活性物質のいずれでもよく、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、または他の目的で使用できる。典型的な界面活性物質としては、例えば、アルキル硫酸塩（ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなど）、アルキルアリールスルホン酸塩（ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなど）、アルキルフェノール／アルキレンオキシド付加物（ノニルフェノールエトキシレート）、アルコール／アルキレンオキシド付加物（トリデシルアルコールエトキシレート）、石鹼（ステアリン酸ナトリウムなど）、アルキルナフタレンスルホン酸塩（ブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなど）、スルホコハク酸塩のジアルキルエステル（ジ(2-エチルヘキシル)スルホコハク酸ナトリウムなど）、ソルビトールエステル（オレイン酸ソルビトールなど）、第四級アミン（ラウリルトリメチルアンモニウムクロリドなど）、脂肪酸のポリエチレングリコールエステル（ステアリン酸ポリエチレングリコールなど）、エチレンオキシドとプロピレンオキシドのブロックコポリマー、モノアルキルリン酸エステルの塩、ジアルキルリン酸エステルの塩や、例えば『マッカッチョンの洗剤と乳化剤年鑑』、MC出版社、リッジウッド、ニュージャージー州、1981年に記載されているさらに別の物質などがある。

【0181】

殺虫調合剤に通常使用できるさらに別のアジュバントとして、結晶化阻止剤、粘性変更剤、懸濁剤、染料、酸化防止剤、発泡剤、光吸収剤、混合助剤、泡止め剤、錯化剤、中和用またはpH変更用の物質と緩衝剤、腐食阻止剤、芳香剤、湿潤剤、溶解促進剤、微量栄養素、可塑剤、流動促進剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、凍結防止剤、殺微生物剤、液体肥料、固体肥料などがある。

【0182】

本発明の組成物にはさらに、添加剤として、植物起源の油、動物起源の油、鉱物油、これらの油のアルキルエステル、これらの油と油誘導体の混合物などが含まれていてもよい。本発明の組成物に含まれる油添加剤の量は、一般に、スプレー混合物の0.01~10%である。例えばスプレー混合物を調製した後、油添加剤をスプレー・タンクに望む濃度で添加することができる。好ましい油添加剤としては、鉱物油、または植物起源の油（例えばナタネ油、オリーブ油、ヒマワリ油）、乳化した植物油（例えばアミゴ（登録商標、ローヌ-プーラン・カナダ社））、植物起源の油のアルキルエステル（例えばメチル誘導体）、動物起源の油（例えば魚油、牛脂）などがある。好ましい添加剤は、例えば、活性成分として、魚油のアルキルエステルをほぼ80重量%と、メチル化されたナタネ油を15%と、通常使用される乳化剤およびpH変更剤を5重量%含んでいる。特に好ましい油添加剤は、 C_8 ~ C_{22} 脂肪酸のアルキルエステル（特に C_{12} ~ C_{18} 脂肪酸のメチル誘導体）であり、ラウリル酸、パルミチン酸、オレイン酸のメチルエステルが重要である。これらのエステルはラウリル酸メチル（CAS-111-82-0）、パルミチン酸メチル（CAS-112-39-0）、オレイン酸メチル（CAS-112-62-9）として知られている。好ましい脂肪酸メチルエステル誘導体は、エメリー（登録商標）2230と2231（コグニス社）である。これらの油誘導体と他の油誘導体は、『除草剤のアジュバント概論』、第5版、南イリノイ大学、2000年に掲載されている。

【0183】

油添加剤の添加と作用は、界面活性物質（例えば非イオン性、アニオン性、カチオン性の界面活性剤）と組み合わせることによってさらに改善できる。非イオン性、アニオン性、カチオン性の適切な界面活性剤の具体例は、WO 97/34485の7ページと8ページに記載されている。好ましい界面活性物質は、ドデシルベンジルスルホン酸塩のタイプのアニオン性界面活性剤（その中でもそのカルシウム塩）と、脂肪アルコールエトキシレート・タイプの非イオン性界面活性剤である。特に好ましいのは、エトキシ化度が5~40のエトキシ化 C_{12} ~ C_{22} 脂肪アルコールである。市販されている界面活性剤の具体例は、ゲナポール・タイプ（クラリアント社）である。シリコーン界面活性剤（特にポリアルキル-オキシド改変ヘプタメチルトリロキサン（例えばSilwet L-77（登録商標）として市販されている））と、ペルフルオロ化された界面活性剤も好ましい。全添加剤に対する界面活性物質の濃度は、一般に、1~30重量%である。油または鉱物油またはその誘導体と、界面活性剤との混合物からなる油添加剤の具体例は、Edenor ME SU（登録商標）、Turbocharge（登録商標）（シンジェンタ社、スイス国）、ActipronC（BPオイルUK社、イギリス国）である。

【0184】

望むのであれば、上記の界面活性物質それ自体を調合剤として使用すること、すなわち油添加剤なしに使用することもできる。

【0185】

さらに、有機溶媒を油添加剤／界面活性物質の混合物に添加すると、作用をさらに増強できる可能性がある。適切な溶媒は、例えば、Solvesso（登録商標、エッソ社）またはAromatic Solvent（登録商標、エクソン社）である。このような溶媒の濃度は、全重量の10~80重量%にすることができる。溶媒との混合物の中に存在する油添加剤は、例えばアメリカ合衆国特許第4,834,908号に記載されている。この明細書に記載した市販の油添加剤は、MERGE（登録商標、BASF社）という名称で知られている。本発明において好ましいさらに別の油添加剤は、SCORE（登録商標、シンジェンタ・クロップ・プロテクション・カ

ナダ社）である。

【0186】

本発明による組成物の作用を増強するには、上記の油添加剤に加え、アルキルピロリドン（例えばAgrimax（登録商標））調合剤をスプレー混合物に添加することも可能である。合成格子（例えばポリアクリルアミド、ポリビニル化合物、ポリ-1-p-メンテン（例えばBond（登録商標）、Courier（登録商標）、Emerald（登録商標）））調合剤も使用することができる。プロピオン酸を含む溶液（例えばEurogkem Pen-e-trate（登録商標））を作用増強剤としてスプレー混合物に添加することも可能である。

【0187】

除草組成物は、一般に、一般式（I）の化合物を0.1～99重量％（特に0.1～95重量％）と、調合用アジュバントを1～99.9重量％を含んでいる。調合用アジュバントには、0～25重量％の界面活性物質が含まれていることが好ましい。市販の製品は濃縮液にすることが好ましいが、エンド・ユーザーは、通常は希釈調合剤を使用することになる。

【0188】

一般式（I）の化合物の施用量は広い範囲にわたる可能性があるが、土の性質、施用方法（発芽前または発芽後；種子表面への付着；種子を播いた畝間への施用；耕作なしの施用など）、作物用植物、制御する草または雑草、優勢な気象条件や、施用方法によって決まる他の因子、施用時期によって決まる他の因子、標的とする作間によって決まる他の因子に応じて異なる。本発明による一般式（I）の化合物は、一般に、10～2000g/ha、特に50～1000g/haの割合で散布される。

【0189】

好ましい調合剤は、特に以下の組成を有する（％=重量パーセント）。

【0190】

乳化可能な濃縮液

活性成分：1～95％、60～90％が好ましい

界面活性剤：1～30％、5～20％が好ましい

液体基剤：1～80％、1～35％が好ましい

【0191】

ダスト：

活性成分：0.1～10％、0.1～5％が好ましい

固体基剤：99.9～90％、99.9～99％が好ましい

【0192】

懸濁濃縮液：

活性成分：5～75％、10～50％が好ましい

水：94～24％、88～30％が好ましい

界面活性剤：1～40％、2～30％が好ましい

【0193】

湿潤化可能な粉末：

活性成分：0.5～90％、1～80％が好ましい

界面活性剤：0.5～20％、1～15％が好ましい

固体基剤：5～95％、15～90％が好ましい

【0194】

顆粒：

活性成分：0.1～30％、0.1～15％が好ましい

固体基剤：99.5～70％、97～85％が好ましい

【0195】

以下の実施例により本発明をさらに説明するが、本発明がその実施例に限定されることはない。

【0196】

一般式（I）の除草剤のための調合剤の実施例（％=重量％）

10

20

30

40

50

【0197】

F1. 乳化可能な濃縮液	a)	b)	c)	d)	
活性成分	5%	10%	25%	50%	
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム					
	6%	8%	6%	8%	
ひまし油ポリグリコールエーテル（エチレンオキシドが36モル）					
	4%	-	4%	4%	
オクチルフェノールポリグリコールエーテル（エチレンオキシドが7～8モル）					
	-	4%	-	2%	
NMP	-	-	10%	20%	10
C ₉ ～C ₁₂ 芳香族炭化水素混合物	85%	78%	55%	16%	

【0198】

望む濃度のエマルジョンは、この濃縮液を水で希釈することによって得られる。

【0199】

F2. 溶液	a)	b)	c)	d)	
活性成分	5%	10%	50%	90%	
1-メトキシ-3-(3-メトキシプロポキシ)-プロパン					
	-	20%	20%	-	
ポリエチレングリコール分子量400	20%	10%	-	-	
NMP	-	-	30%	10%	20
C ₉ ～C ₁₂ 芳香族炭化水素混合物	75%	60%	-	-	

【0200】

この溶液は、微小液滴の形態で使用するのに適している。

【0201】

F3. 湿潤化可能な粉末	a)	b)	c)	d)	
活性成分	5%	25%	50%	80%	
リグノスルホン酸ナトリウム	4%	-	3%	-	
ラウリル硫酸ナトリウム	2%	3%	-	4%	
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム					
	-	6%	5%	6%	30
オクチルフェノールポリグリコールエーテル（エチレンオキシドが7～8モル）					
	-	1%	2%	-	
高度に分散されたケイ酸	1%	3%	5%	10%	
カオリン	88%	62%	35%	-	

【0202】

活性成分をアジュバントと完全に混合し、得られた混合物を適切なミルの中で完全に粉碎すると、湿潤化可能な粉末が得られる。それを水で希釈すると、望む任意の濃度の懸濁液が得られる。

【0203】

F4. コーティングされた顆粒	a)	b)	c)		40
活性成分	0.1%	5%	15%		
高度に分散されたケイ酸	0.9%	2%	2%		
無機基剤（例えばCaCO ₃ やSiO ₂ ）（直径0.1～1mm）					
	99.0%	93%	83%		

【0204】

活性成分を塩化メチレンに溶かし、スプレーによって基剤に付着させた後、溶媒を真空中で蒸発させて除去する。

【0205】

F5. コーティングされた顆粒	a)	b)	c)		50
活性成分	0.1%	5%	15%		

ポリエチレングリコール分子量200	1.0%	2%	3%
高度に分散されたケイ酸	0.9%	1%	2%
無機基剤（例えばCaCO ₃ やSiO ₂ ）（直径0.1～1mm）	98.0%	92%	80%

【0206】

細かく粉砕した活性成分を、ミキサーの中で、ポリエチレングリコールで湿らせた基剤に一樣に付着させる。ダストではないコーティングされた顆粒がこのようにして得られる。

【0207】

F6. 押し出した顆粒	a)	b)	c)	d)	10
活性成分	0.1%	3%	5%	15%	
リグノスルホン酸ナトリウム	1.5%	2%	3%	4%	
カルボキシメチルセルロース	1.4%	2%	2%	2%	
カオリン	97.0%	93%	90%	79%	

【0208】

活性成分をアジュバントと混合してから粉砕し、得られた混合物を水で湿らせる。この混合物を押し出した後、空気流の中で乾燥させる。

【0209】

F7. ダスト	a)	b)	c)		20
活性成分	0.1%	1%	5%		
タルク	39.9%	49%	35%		
カオリン	60.0%	50%	60%		

【0210】

そのまま使用できるダストは、活性成分を基剤と混合し、その混合物を適切なミルの中で完全に粉砕することによって得られる。

【0211】

F8. 懸濁濃縮液	a)	b)	c)	d)	
活性成分	3%	10%	25%	50%	
エチレングリコール	5%	5%	5%	5%	
ノニルフェノールポリグリコールエーテル（エチレンオキシドが15モル）					30
	-	1%	2%	-	
リグノスルホン酸ナトリウム	3%	3%	4%	5%	
カルボキシメチルセルロース	1%	1%	1%	1%	
37%ホルムアミド水溶液	0.2%	0.2%	0.2%	0.2%	
シリコーン油エマルジョン	0.8%	0.8%	0.8%	0.8%	
水	87%	79%	62%	38%	

【0212】

細かく粉砕した活性物質をアジュバントと密に混合すると、懸濁濃縮液が得られる。それを水で希釈すると、望む任意の濃度の懸濁液が得られる。

【0213】

本発明は、有用な作物の間に生える草または雑草を選択的に制御するため、有用な植物そのものか、有用な植物を栽培している領域または場所を、一般式（I）の化合物で処理する方法にも関する。

【0214】

本発明の組成物を使用できる有用な作物としては、特に、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、穀物（例えばコムギ、オオムギ、イネ）、サトウキビ、テンサイ、ヒマワリ、セイヨウアブラナなどがある。作物には、従来の育種法または遺伝子工学によって除草剤またはいろいろなクラスの除草剤（例えばALS阻害剤、GS阻害剤、EPSPS阻害剤、PPO阻害剤、HPPD阻害剤）に対して寛容になるようにされた作物も含まれると考える。従来の育種法によってイミダゾリノン（例えばイマザモックス）に対して寛容になるようにされた作物の一例

10

20

30

40

50

は、クリアフィールド（登録商標）アブラナ（カノラ）である。遺伝子工学の方法によって除草剤に対して寛容になるようにされた作物の例として、ラウンドアップレディ（登録商標）およびリバティリンク（登録商標）という商品名で市販されているグリホサート耐性トウモロコシとグルホシネート耐性トウモロコシがある。制御すべき雑草は、単子葉と双子葉の雑草の両方であり、例えば、ハコベ、イヌガラシ、ヌカボ、メヒシバ、カラスミギ、アワ、カラシ、ホソムギ、ナス、ヒエ、フトイ、ミズアオイ、オモダカ、イヌムギ、ススメノテッポウ、モロコシ、ツノアイアシ、カヤツリグサ、イチビ、キングジカ、オナモミ、ハゲイトウ、アカザ、サツマイモ、シュンギク、ヤエムグラ、スマレ、クワガタソウがある。

【0215】

作物には、遺伝子工学の方法によって害虫に対して抵抗力を持つようにされた作物（例えば（アワノメイガに対する抵抗力がある）Btトウモロコシ、（ワタミハナゾウムシに対する抵抗力がある）Btワタ、（コロラドハムシに対する抵抗力がある）Btジャガイモ）も含まれると考えられる。Btトウモロコシの具体例は、NK（登録商標、シンジェンタ・シーズ社）のBt176トウモロコシ・ハイブリッドである。Bt毒素は、バシラス・チューリンゲンシスという土中細菌によって天然に形成されるタンパク質である。毒素の具体例、またはそのような毒素を合成することのできるトランスジェニック植物の具体例は、ヨーロッパ特許第451 878号、第374 753号、WO 93/07278、WO 95/34656、WO 03/052073、ヨーロッパ特許第427 529号に記載されている。殺虫剤耐性をコードして1種類以上の毒素を発現する1個以上の遺伝子を含むトランスジェニック植物の具体例は、ノックアウト（登録商標）（トウモロコシ）、イールド・ガード（登録商標）（トウモロコシ）、NuCOTIN33B（登録商標）（ワタ）、ボルガード（登録商標）（ワタ）、ニューリーフ（登録商標）（ジャガイモ）、ネイチャーガード（登録商標）、プロテックスクタ（登録商標）である。作物またはその種子材料は、両方とも、除草剤に対する耐性と同時に、昆虫に食べられることに対する抵抗力を持たせることができる（“積み重なった”トランスジェニック・イベント）。例えば種子は、殺虫Cry3タンパク質を発現する能力と同時に、グリホサートに対する寛容性を持つことができる。作物には、従来の育種法または遺伝子工学によって得られていわゆる出力形質（例えば向上した保存安定性、より大きな栄養価、向上した香り）を有する作物も含まれると考えられる。

【0216】

栽培地域には、作物がすでに生長している土地と、そのような作物を栽培しようとする土地が含まれる。

【0217】

本発明による一般式（I）の化合物は、他の一種類以上の除草剤と組み合わせて使用することもできる。特に、一般式（I）の化合物を含む以下の混合物が重要である。すなわち、一般式（I）の化合物+アセトクロール、一般式（I）の化合物+アシフルオルフェン、一般式（I）の化合物+アシフルオルフェン-ナトリウム、一般式（I）の化合物+アクロニフェン、一般式（I）の化合物+アクロレイン、一般式（I）の化合物+アラクロール、一般式（I）の化合物+アロキシジム、一般式（I）の化合物+アリアルアルコール、一般式（I）の化合物+アメトリン、一般式（I）の化合物+アミカルバゾン、一般式（I）の化合物+アミドスルフロン、一般式（I）の化合物+アミノピラリド、一般式（I）の化合物+アミトロール、一般式（I）の化合物+スルファミン酸アンモニウム、一般式（I）の化合物+アニロホス、一般式（I）の化合物+アシュラム、一般式（I）の化合物+アトラトン、一般式（I）の化合物+アトラジン、一般式（I）の化合物+アジムスルフロン、一般式（I）の化合物+BCPC、一般式（I）の化合物+ベフルブタミド、一般式（I）の化合物+ベナゾリン、一般式（I）の化合物+ベンフルラリン、一般式（I）の化合物+ベンフレセート、一般式（I）の化合物+ベンスルフロン、一般式（I）の化合物+ベンスルフロン-メチル、一般式（I）の化合物+ベンスリド、一般式（I）の化合物+ベンタゾン、一般式（I）の化合物+ベンズフェンジゾン、一般式（I）の化合物+ベンゾビシクロン、一般式（I）の化合物+ベンゾフェナップ、一般式（I）の化合物+ビフェノックス、一般式（I）の化合物+ピラナホス、一

一般式 (I) の化合物+ビスピリバック、一般式 (I) の化合物+ビスピリバック-ナトリウム、一般式 (I) の化合物+ボラックス、一般式 (I) の化合物+プロマシル、一般式 (I) の化合物+プロモブチド、一般式 (I) の化合物+プロモキシニル、一般式 (I) の化合物+ブタクロール、一般式 (I) の化合物+ブタフェナシル、一般式 (I) の化合物+ブタミホス、一般式 (I) の化合物+ブトラリン、一般式 (I) の化合物+ブトロキシジム、一般式 (I) の化合物+ブチレート、一般式 (I) の化合物+カコジル酸、一般式 (I) の化合物+塩素酸カルシウム、一般式 (I) の化合物+カフェンストロール、一般式 (I) の化合物+カルベタミド、一般式 (I) の化合物+カルフェントラゾン、一般式 (I) の化合物+カルフェントラゾン-エチル、一般式 (I) の化合物+CDEA、一般式 (I) の化合物+CEPC、一般式 (I) の化合物+クロルフルレノール、一般式 (I) の化合物+クロルフルレノール-メチル、一般式 (I) の化合物+クロリダゾン、一般式 (I) の化合物+クロリムロン、一般式 (I) の化合物+クロリムロン-エチル、一般式 (I) の化合物+クロロ酢酸、一般式 (I) の化合物+クロロトルロン、一般式 (I) の化合物+クロルプロファミ、一般式 (I) の化合物+クロルスルフロロン、一般式 (I) の化合物+クロルタール、一般式 (I) の化合物+クロルタール-ジメチル、一般式 (I) の化合物+シニドン-エチル、一般式 (I) の化合物+シンメチリン、一般式 (I) の化合物+シノスルフロロン、一般式 (I) の化合物+シサニリド、一般式 (I) の化合物+クレトジム、一般式 (I) の化合物+クロジナホップ、一般式 (I) の化合物+クロジナホップ-プロパルギル、一般式 (I) の化合物+クロマゾン、一般式 (I) の化合物+クロメプロップ、一般式 (I) の化合物+クロピラリド、一般式 (I) の化合物+クロランスラム、一般式 (I) の化合物+クロランスラム-メチル、一般式 (I) の化合物+CMA、一般式 (I) の化合物+4-CPB、一般式 (I) の化合物+CPMF、一般式 (I) の化合物+4-CPP、一般式 (I) の化合物+CPPC、一般式 (I) の化合物+クレゾール、一般式 (I) の化合物+クミルロン、一般式 (I) の化合物+シアナミド、一般式 (I) の化合物+シアナジン、一般式 (I) の化合物+シクロエート、一般式 (I) の化合物+シクロスルファミロン、一般式 (I) の化合物+シクロキシジム、一般式 (I) の化合物+シハロホップ、一般式 (I) の化合物+シハロホップ-ブチル、一般式 (I) の化合物+2,4-D、一般式 (I) の化合物+3,4-DA、一般式 (I) の化合物+ダイムロン、一般式 (I) の化合物+ダラボン、一般式 (I) の化合物+ダゾメット、一般式 (I) の化合物+2,4-DB、一般式 (I) の化合物+3,4-DB、一般式 (I) の化合物+2,4-DEB、一般式 (I) の化合物+デスメジファミ、一般式 (I) の化合物+ジカンバ、一般式 (I) の化合物+ジクロベニル、一般式 (I) の化合物+オルト-ジクロロベンゼン、一般式 (I) の化合物+パラ-ジクロロベンゼン、一般式 (I) の化合物+ジクロルプロップ、一般式 (I) の化合物+ジクロルプロップ-P、一般式 (I) の化合物+ジクロホップ、一般式 (I) の化合物+ジクロホップ-メチル、一般式 (I) の化合物+ジクロスラム、一般式 (I) の化合物+ジフェンゾクワット、一般式 (I) の化合物+ジフェンゾクワットメチルサルフェート、一般式 (I) の化合物+ジフルフェニカン、一般式 (I) の化合物+ジフルフェンゾピル、一般式 (I) の化合物+ジメフロロン、一般式 (I) の化合物+ジメピペレート、一般式 (I) の化合物+ジメタクロール、一般式 (I) の化合物+ジメタメトリン、一般式 (I) の化合物+ジメテナミド、一般式 (I) の化合物+ジメテナミド-P、一般式 (I) の化合物+ジメチピン、一般式 (I) の化合物+ジメチルアルシン酸、一般式 (I) の化合物+ジニトラミン、一般式 (I) の化合物+ジノテルブ、一般式 (I) の化合物+ジフェナミド、一般式 (I) の化合物+ジクワット、一般式 (I) の化合物+ジクワットジプロミド、一般式 (I) の化合物+ジチオピル、一般式 (I) の化合物+ジウロン、一般式 (I) の化合物+DNOC、一般式 (I) の化合物+3,4-DP、一般式 (I) の化合物+DSMA、一般式 (I) の化合物+EBEP、一般式 (I) の化合物+エンドタール、一般式 (I) の化合物+EPTC、一般式 (I) の化合物+エスプロカルブ、一般式 (I) の化合物+エタルフルラリン、一般式 (I) の化合物+エタメトスルフロロン、一般式 (I) の化合物+エタメトスルフロロン-メチル、一般式 (I) の化合物+エトフメセート、一般式 (I) の化合物+エトキシフェン、一般式 (I) の化合物+エトキシスルフロロン、一般式 (I) の化合物+エトベンザニド、一般式 (I) の化合物+フェノキサプロップ-P、一般式 (I) の化合物+フェノキサプロップ-P-エチル、一般式 (I) の化合物+フェントラザミド、一般式 (I) の化合物+硫酸第一鉄、一般式 (I) の化合物+フラムプロップ

-M、一般式 (I) の化合物+フラザスルフロソ、一般式 (I) の化合物+フロラスラム、一般式 (I) の化合物+フルアジホップ、一般式 (I) の化合物+フルアジホップ-ブチル、一般式 (I) の化合物+フルアジホップ-P、一般式 (I) の化合物+フルアジホップ-P-ブチル、一般式 (I) の化合物+フルカルバゾン、一般式 (I) の化合物+フルカルバゾン-ナトリウム、一般式 (I) の化合物+フルセトスルフロソ、一般式 (I) の化合物+フルクロラリン、一般式 (I) の化合物+フルフェナセツ、一般式 (I) の化合物+フルフェンピル、一般式 (I) の化合物+フルフェンピル-エチル、一般式 (I) の化合物+フルメツスラム、一般式 (I) の化合物+フルミクロラック、一般式 (I) の化合物+フルミクロラック-ペンチル、一般式 (I) の化合物+フルミオキサジン、一般式 (I) の化合物+フルオメツロン、一般式 (I) の化合物+フルオログリコフェン、一般式 (I) の化合物+フルオログリコフェン-エチル、一般式 (I) の化合物+フルプロパネツ、一般式 (I) の化合物+フルピルスルフロソ、一般式 (I) の化合物+フルピルスルフロソ-メチル-ナトリウム、一般式 (I) の化合物+フルレノール、一般式 (I) の化合物+フルリドン、一般式 (I) の化合物+フルクロリドン、一般式 (I) の化合物+フルロキシピル、一般式 (I) の化合物+フルルタモン、一般式 (I) の化合物+フルチアセツ、一般式 (I) の化合物+フルチアセツ-メチル、一般式 (I) の化合物+フォメサフェン、一般式 (I) の化合物+フォラムスルフロソ、一般式 (I) の化合物+フォサミン、一般式 (I) の化合物+グルホシネツ、一般式 (I) の化合物+グルホシネツ-アンモニウム、一般式 (I) の化合物+グリホサツ、一般式 (I) の化合物+ハロスルフロソ、一般式 (I) の化合物+ハロスルフロソ-メチル、一般式 (I) の化合物+ハロキシホップ、一般式 (I) の化合物+ハロキシホップ-P、一般式 (I) の化合物+HC-252、一般式 (I) の化合物+ヘキサジノン、一般式 (I) の化合物+イマザメタベンズ、一般式 (I) の化合物+イマザメタベンズ-メチル、一般式 (I) の化合物+イマザモックス、一般式 (I) の化合物+イマザピック、一般式 (I) の化合物+イマザピル、一般式 (I) の化合物+イマザキン、一般式 (I) の化合物+イマゼタピル、一般式 (I) の化合物+イマゾスルフロソ、一般式 (I) の化合物+インダノファン、一般式 (I) の化合物+ヨードメタン、一般式 (I) の化合物+ヨードスルフロソ、一般式 (I) の化合物+ヨードスルフロソ-メチル-ナトリウム、一般式 (I) の化合物+イオキシニル、一般式 (I) の化合物+イソプロツロン、一般式 (I) の化合物+イソウロン、一般式 (I) の化合物+イソキサベン、一般式 (I) の化合物+イソキサクロルトール、一般式 (I) の化合物+イソキサフルトール、一般式 (I) の化合物+カルブチレツ、一般式 (I) の化合物+ラクトフェン、一般式 (I) の化合物+レナシル、一般式 (I) の化合物+リヌロン、一般式 (I) の化合物+MAA、一般式 (I) の化合物+MAMA、一般式 (I) の化合物+MCPA、一般式 (I) の化合物+MCPA-チオエチル、一般式 (I) の化合物+MCPB、一般式 (I) の化合物+メコプロツ、一般式 (I) の化合物+メコプロツ-P、一般式 (I) の化合物+メフェナセツ、一般式 (I) の化合物+メフルイジド、一般式 (I) の化合物+メソスルフロソ、一般式 (I) の化合物+メソスルフロソ-メチル、一般式 (I) の化合物+メソトリオン、一般式 (I) の化合物+メタム、一般式 (I) の化合物+メタミホップ、一般式 (I) の化合物+メタミツロン、一般式 (I) の化合物+メタザクロール、一般式 (I) の化合物+メタベンズチアズロン、一般式 (I) の化合物+メチルアルソソ酸、一般式 (I) の化合物+メチルジムロン、一般式 (I) の化合物+メチルイソチオシアネツ、一般式 (I) の化合物+メツベンズロン、一般式 (I) の化合物+メトラクロール、一般式 (I) の化合物+S-メトラクロール、一般式 (I) の化合物+メツスラム、一般式 (I) の化合物+メツクスロン、一般式 (I) の化合物+メツリブジン、一般式 (I) の化合物+メツスルフロソ、一般式 (I) の化合物+メツスルフロソ-メチル、一般式 (I) の化合物+MK-616、一般式 (I) の化合物+モリネツ、一般式 (I) の化合物+モノリヌロン、一般式 (I) の化合物+MSMA、一般式 (I) の化合物+ナプロアニリド、一般式 (I) の化合物+ナプロパミド、一般式 (I) の化合物+ナプタラム、一般式 (I) の化合物+ネブロン、一般式 (I) の化合物+ニコスルフロソ、一般式 (I) の化合物+ノナン酸、一般式 (I) の化合物+ノルフルラゾン、一般式 (I) の化合物+オレイン酸 (脂肪酸)、一般式 (I) の化合物+オルベンカルブ、一般式 (I) の化合物+オルツスルファムロン、一般式 (I) の化合物+オリザリン、一般式 (I) の化合物+オキサジアルギル、一般式 (I) の化合物+

10

20

30

40

50

オキサジアゾン、一般式 (I) の化合物+オキサスルフロン、一般式 (I) の化合物+オキサジクロメホン、一般式 (I) の化合物+オキシフルオルフェン、一般式 (I) の化合物+パラコート、一般式 (I) の化合物+パラコートジクロリド、一般式 (I) の化合物+ペブレート、一般式 (I) の化合物+ペンジメタリン、一般式 (I) の化合物+ペノクススラム、一般式 (I) の化合物+ペンタクロロフェノール、一般式 (I) の化合物+ペンタノクロール、一般式 (I) の化合物+ペントキサゾン、一般式 (I) の化合物+ペトキサミド、一般式 (I) の化合物+石油、一般式 (I) の化合物+フェンメジファム、一般式 (I) の化合物+フェンメジファム-エチル、一般式 (I) の化合物+ピクロラム、一般式 (I) の化合物+ピコリナフェン、一般式 (I) の化合物+ピノキサデン、一般式 (I) の化合物+ピペロホス、一般式 (I) の化合物+亜ヒ酸カリウム、一般式 (I) の化合物+カリウムアジド、一般式 (I) の化合物+プレチクロール、一般式 (I) の化合物+プリミスルフロン、一般式 (I) の化合物+プリミスルフロン-メチル、一般式 (I) の化合物+プロジアミン、一般式 (I) の化合物+プロフルアゾール、一般式 (I) の化合物+プロフォキシジム、一般式 (I) の化合物+プロメトン、一般式 (I) の化合物+プロメトリン、一般式 (I) の化合物+プロパクロール、一般式 (I) の化合物+プロパニル、一般式 (I) の化合物+プロパキザホップ、一般式 (I) の化合物+プロパジン、一般式 (I) の化合物+プロファム、一般式 (I) の化合物+プロピソクロール、一般式 (I) の化合物+プロボキシカルバゾン、一般式 (I) の化合物+プロボキシカルバゾン-ナトリウム、一般式 (I) の化合物+プロピザミド、一般式 (I) の化合物+プロスルホカルブ、一般式 (I) の化合物+プロスルフロン、一般式 (I) の化合物+ピラクロニル、一般式 (I) の化合物+ピラフルフェン、一般式 (I) の化合物+ピラフルフェン-エチル、一般式 (I) の化合物+ピラゾリネート、一般式 (I) の化合物+ピラゾスルフロン、一般式 (I) の化合物+ピラゾスルフロン-エチル、一般式 (I) の化合物+ピラゾキシフェン、一般式 (I) の化合物+ピリベンゾキシム、一般式 (I) の化合物+ピリブチカルブ、一般式 (I) の化合物+ピリダフォル、一般式 (I) の化合物+ピリデート、一般式 (I) の化合物+ピリフタリド、一般式 (I) の化合物+ピリミノバック、一般式 (I) の化合物+ピリミノバック-メチル、一般式 (I) の化合物+ピリミスルファン、一般式 (I) の化合物+ピリチオバック、一般式 (I) の化合物+ピリチオバックナトリウム、一般式 (I) の化合物+キンクロラック、一般式 (I) の化合物+キンメラック、一般式 (I) の化合物+キノクラミン、一般式 (I) の化合物+キザロホップ、一般式 (I) の化合物+キザロホップ-P、一般式 (I) の化合物+リムスルフロン、一般式 (I) の化合物+セットキシジム、一般式 (I) の化合物+シデュロン、一般式 (I) の化合物+シマジン、一般式 (I) の化合物+シメトリン、一般式 (I) の化合物+SMA、一般式 (I) の化合物+亜ヒ酸ナトリウム、一般式 (I) の化合物+ナトリウムアジド、一般式 (I) の化合物+塩素酸ナトリウム、一般式 (I) の化合物+スルコトリオン、一般式 (I) の化合物+スルフェントラゾン、一般式 (I) の化合物+スルホメツロン、一般式 (I) の化合物+スルホメツロン-メチル、一般式 (I) の化合物+スルホスルフロン、一般式 (I) の化合物+硫酸、一般式 (I) の化合物+タール油、一般式 (I) の化合物+2,3,6-TBA、一般式 (I) の化合物+TCA、一般式 (I) の化合物+TCA-ナトリウム、一般式 (I) の化合物+テブチウロン、一般式 (I) の化合物+テブラロキシジム、一般式 (I) の化合物+テルバシル、一般式 (I) の化合物+テルブメトン、一般式 (I) の化合物+テルブチラジン、一般式 (I) の化合物+テルブトリン、一般式 (I) の化合物+テニルクロール、一般式 (I) の化合物+チアゾピル、一般式 (I) の化合物+チフェンスルフロン、一般式 (I) の化合物+チフェンスルフロン-メチル、一般式 (I) の化合物+チオベンカルブ、一般式 (I) の化合物+チオカルバジル、一般式 (I) の化合物+トプラメゾン、一般式 (I) の化合物+トラルコオキシジム、一般式 (I) の化合物+トリ-アラート、一般式 (I) の化合物+トリアスルフロン、一般式 (I) の化合物+トリアジフラム、一般式 (I) の化合物+トリベヌロン、一般式 (I) の化合物+トリベヌロン-メチル、一般式 (I) の化合物+トリカンバ、一般式 (I) の化合物+トリクロピル、一般式 (I) の化合物+トリエタジン、一般式 (I) の化合物+トリフロキシスルフロン、一般式 (I) の化合物+トリフロキシスルフロン-ナトリウム、一般式 (I) の化合物+トリフルラリン、一般式 (I) の化合物+トリフルスルフロン、一般式 (I) の化合物+トリフルスルフロン-メチル

10

20

30

40

50

、一般式 (I) の化合物+トリヒドロキシトリアジン、一般式 (I) の化合物+トリトスルホン、一般式 (I) の化合物+[3-[2-クロロ-4-フルオロ-5-(1-メチル-6-トリフルオロメチル-2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-3-イル)フェノキシ]-2-ピリジルオキシ]酢酸エチルエステルが重要である。

【0218】

一般式 (I) の化合物の混合パートナーは、例えば『殺虫剤マニュアル』、第12版 (BCP C)、2000年に記載されているように、エステルまたは塩の形態でもよい。

【0219】

一般式 (I) の化合物と混合パートナーの混合比は、1:100~1000:1であることが好ましい。

【0220】

混合物は、好ましいことに上記調合剤として使用することができる（その場合、“活性成分”は一般式 (I) の化合物と混合パートナーの各混合物と関係がある）。

【0221】

一般式 (I) の化合物とさらに1種類以上の除草剤の好ましい混合物として、以下のものがある。

【0222】

一般式 (I) の化合物とトリアジンの混合物（例えば、一般式 (I) の化合物+アメトリン、一般式 (I) の化合物+アトラジン、一般式 (I) の化合物+シアナジン、一般式 (I) の化合物+ジメタメトリン、一般式 (I) の化合物+メトリブジン、一般式 (I) の化合物+プロメトン、一般式 (I) の化合物+プロメトリン、一般式 (I) の化合物+プロバジン、一般式 (I) の化合物+シマジン、一般式 (I) の化合物+シメトリン、一般式 (I) の化合物+テルブメトン、一般式 (I) の化合物+テルブチルアジン、一般式 (I) の化合物+テルブトリン、一般式 (I) の化合物+トリエタジン）。特に好ましいのは、一般式 (I) の化合物と、アトラジン、メトリブジン、プロメトリン、テルブチラジンいずれかとの混合物である（すなわち一般式 (I) の化合物+アトラジン、一般式 (I) の化合物+メトリブジン、一般式 (I) の化合物+プロメトリン、一般式 (I) の化合物+テルブチルアジン）。

【0223】

一般式 (I) の化合物とイソオキサフルトールの混合物（例えば一般式 (I) の化合物+イソオキサフルトール）。

【0224】

一般式 (I) の化合物とイソオキサフルトールおよびトリアジンとの混合物。

【0225】

一般式 (I) の化合物とイソオキサフルトールおよびグリホサートとの混合物（例えば一般式 (I) の化合物+イソオキサフルトール+グリホサート）。

【0226】

一般式 (I) の化合物とイソオキサフルトールおよびグルホシネートとの混合物（例えば一般式 (I) の化合物+イソオキサフルトール+グルホシネート）。

【0227】

一般式 (I) の化合物とメソトリオンの混合物（例えば一般式 (I) の化合物+メソトリオン）。

【0228】

一般式 (I) の化合物とメソトリオンおよびトリアジンとの混合物。

【0229】

一般式 (I) の化合物とメソトリオンおよびグリホサートとの混合物（例えば一般式 (I) の化合物+メソトリオン+グリホサート）。

【0230】

一般式 (I) の化合物とメソトリオンおよびグルホシネートとの混合物（例えば一般式 (I) の化合物+メソトリオン+グルホシネート）。

【0231】

10

20

30

40

50

一般式 (I) の化合物とスルコトリオンの混合物 (例えば一般式 (I) の化合物+スルコトリオン)。

【0232】

一般式 (I) の化合物とスルコトリオンおよびトリアジンとの混合物。

【0233】

一般式 (I) の化合物とスルコトリオンおよびグリホサートとの混合物 (例えば一般式 (I) の化合物+スルコトリオン+グリホサート)。

【0234】

一般式 (I) の化合物とスルコトリオンおよびグルホシネートとの混合物 (例えば一般式 (I) の化合物+スルコトリオン+グルホシネート)。

【0235】

一般式 (I) の化合物とトリアゾリノンの混合物 (例えば一般式 (I) の化合物+アミカルバゾン)。

【0236】

一般式 (I) の化合物とALS阻害剤の混合物 (例えば一般式 (I) の化合物+クロルスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+シノスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+クロランスラム、一
般式 (I) の化合物+エタメトスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+フラザスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+フォルムスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+フルメトスラム、一般式 (I) の化合物+イマザメタベンズ、一般式 (I) の化合物+イマザモックス、一般式 (I) の化合物+イマザピック、一般式 (I) の化合物+イマザピル、一般式 (I) の化合物+イマゼタピル、一般式 (I) の化合物+ヨードスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+メトスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+ニコスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+オキサスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+プリミスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+プロスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+ピリチオバック、一般式 (I) の化合物+リムスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+スルホスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+チフェンスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+トリアスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+トリベヌロン、一般式 (I) の化合物+トリフ
ロキシスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+4-[(4,5-ジヒドロ-3-メトキシ-4-メチル-5-オ
キシ)-1H-1,2,4-トリアゾル-1-イルカルボニルスルファモイル]-5-メチルチオフエン-3-
カルボン酸 (BAY636))。特に好ましいのは、一般式 (I) の化合物と、フラザスルフロ
ン、フォルムスルフロ
ン、フルメトスラム、イマザピル、イマゼタピル、ヨードスルフロ
ン、ニコスルフロ
ン、リムスルフロ
ン、トリフロキシスルフロ
ン、4-[(4,5-ジヒドロ-3-
メトキシ-4-メチル-5-オキシ)-1H-1,2,4-トリアゾル-1-イルカルボニルスルファモイル]-
5-メチルチオフエン-3-カルボン酸 (BAY636) のいずれかとの混合物 (すなわち、一般式
(I) の化合物+フラザスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+フォルムスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+フルメトスラム、一般式 (I) の化合物+イマザピル、一般式 (I) の化合物+
イマゼタピル、一般式 (I) の化合物+ヨードスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+ニコスル
フロ
ン、一般式 (I) の化合物+リムスルフロ
ン、一般式 (I) の化合物+トリフロキシスル
フロ
ン、一般式 (I) の化合物+4-[(4,5-ジヒドロ-3-メトキシ-4-メチル-5-オキシ)-1H-1,
2,4-トリアゾル-1-イルカルボニルスルファモイル]-5-メチルチオフエン-3-カルボン酸 (BAY636)) である。

【0237】

一般式 (I) の化合物とPPO阻害剤の混合物 (例えば、一般式 (I) の化合物+フォメサフ
ェン、一般式 (I) の化合物+フルミオキサジン、一般式 (I) の化合物+スルフェントラゾ
ン、一般式 (I) の化合物+[3-[2-クロロ-4-フルオロ-5-(1-メチル-6-トリフルオロメチル
-2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-3-イル)フェノキシ]-2-ピリジルオキシ
]酢酸エチルエステル)。特に好ましいのは、一般式 (I) の化合物と、フルミオキサジン
、スルフェントラゾン、[3-[2-クロロ-4-フルオロ-5-(1-メチル-6-トリフルオロメチル-2
,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-3-イル)フェノキシ]-2-ピリジルオキシ]
酢酸エチルエステルいずれかとの混合物 (すなわち、一般式 (I) の化合物+フルミオキサ
ジン、一般式 (I) の化合物+スルフェントラゾン、一般式 (I) の化合物+[3-[2-クロロ-4

10

20

30

40

50

-フルオロ-5-(1-メチル-6-トリフルオロメチル-2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-3-イル)フェノキシ]-2-ピリジルオキシ]酢酸エチルエステル)である。

【0238】

一般式(I)の化合物とグリホサートの混合物(すなわち一般式(I)の化合物+グリホサート)。

一般式(I)の化合物とグルホシネートの混合物(すなわち一般式(I)の化合物+グルホシネート)。

一般式(I)の化合物とパラコートの混合物(すなわち一般式(I)の化合物+パラコート)。

一般式(I)の化合物とペンジメタリンまたはトリフルラリンの混合物(すなわち一般式(I)の化合物+ペンジメタリン、一般式(I)の化合物+トリフルラリン)。特に好ましいのは、一般式(I)の化合物とペンジメタリンの混合物(すなわち一般式(I)の化合物+ペンジメタリン)である。

一般式(I)の化合物とメタミトロンの混合物(すなわち一般式(I)の化合物+メタミトン)。

一般式(I)の化合物とクロマゾンの混合物(すなわち一般式(I)の化合物+クロマゾン)。

一般式(I)の化合物とメタザクロールの混合物(すなわち一般式(I)の化合物+メタザクロール)。

一般式(I)の化合物とクロジナホップまたはピノキサデンの混合物(すなわち、一般式(I)の化合物+クロジナホップ、一般式(I)の化合物+ピノキサデン)。

【0239】

本発明による一般式(I)の化合物は、毒性緩和剤と組み合わせて使用することもできる。同様に、本発明による一般式(I)の化合物とさらに1種類以上の除草剤の混合物を1種類以上の毒性緩和剤と組み合わせて使用することもできる。毒性緩和剤としては、クロキントセット-メキシル(CAS RN 99607-70-2)またはそのリチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、アルミニウム塩、鉄塩、アンモニウム塩、第四級アンモニウム塩、スルホニウム塩、ホスホニウム塩(WO 02/34048に記載されているもの)、フェンクロラゾール-エチル(CAS RN 103112-35-2)と対応する酸(CAS RN 103112-36-3)、メフェンピル-ジエチル(CAS RN 135590-91-9)と対応する二酸(CAS RN 135591-00-3)、イソオキサジフェン-エチル(CAS RN 163520-33-0)と対応する酸(CAS RN 209866-92-2)、フリラゾール(CAS RN 121776-33-8)と対応するR異性体(CAS RN 121776-57-6)、ベノキサコル(CAS RN 98730-04-2)、ジクロルミド(CAS RN 37764-25-3)、MON4660(CAS RN 71526-07-3)、オキサベトリニル(CAS RN 74782-23-3)、シオメトリニル(CAS RN 78370-21-5)と対応する(Z)異性体(CAS RN 63278-33-1)、フェンクロリム(CAS RN 3740-92-9)、N-シクロプロピル-4-(2-メトキシ-ベンゾイルスルファモイル)-ベンズアミド(CAS RN 221667-31-8)、N-イソプロピル-4-(2-メトキシ-ベンゾイルスルファモイル)-ベンズアミド(CAS RN 221668-34-4)、ナフタル酸無水物(CAS RN 81-84-5)、フルラゾール(CAS RN 72850-64-7)が可能である。

【0240】

一般式(I)の化合物と毒性緩和剤の混合比は、100:1~1:10であることが好ましく、20:1~1:1であることが特に好ましい。

【0241】

混合物は、好ましいことに上記調剤剤として使用することができる(その場合、“活性成分”は一般式(I)の化合物と毒性緩和剤の各混合物と関係がある)。

【0242】

一般式(I)の化合物と、さらに別の除草剤および毒性緩和剤の好ましい混合物として、以下のものがある。

【0243】

一般式(I)の化合物と、トリアジンと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、グリホサートと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、グルホシネートと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、イソオキサフルトールと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、イソオキサフルトールと、トリアジンと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、イソオキサフルトールと、グリホサートと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、イソオキサフルトールと、グルホシネートと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、メソトリオンと、毒性緩和剤の混合物。

10

一般式 (I) の化合物と、メソトリオンと、トリアジンと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、メソトリオンと、グリホサートと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、メソトリオンと、グルホシネートと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、スルコトリオンと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、スルコトリオンと、トリアジンと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、スルコトリオンと、グリホサートと、毒性緩和剤の混合物。

一般式 (I) の化合物と、スルコトリオンと、グルホシネートと、毒性緩和剤の混合物。

。

【0244】

以下の実施例により本発明をさらに説明するが、本発明がその実施例に限定されることはない。

20

【0245】

調製の実施例：

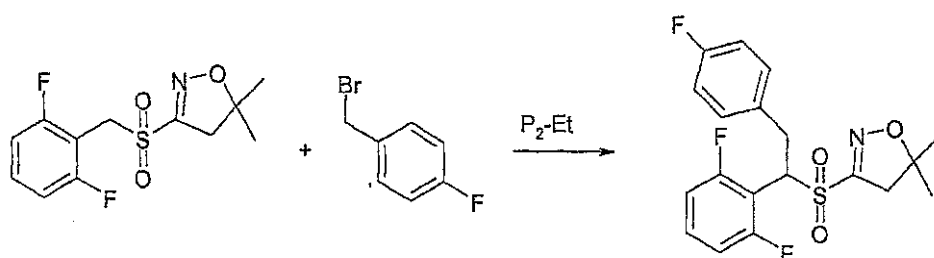
【0246】

実施例P1：3-[1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-2-(4-フルオロ-フェニル)-エタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0247】

【化23】

30



【0248】

40

ホスファゼン塩基である1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-Et) (0.61ml、1.6ミリモル)を、3-(2,6-ジフルオロ-フェニルメタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (0.3g、1.04ミリモル)をTHF (2ml)に溶かした溶液に、室温にて一滴ずつ添加した。10分後、4-フルオロベンジルプロミド (0.16ml、1.3ミリモル)を室温にて一滴ずつ添加し、得られた混合物を1時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液 (2M)を添加して反応を停止させた。この混合物を酢酸エチルで希釈し、2つの相に分離した。有機相をブラインで数回洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン)で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.05)が白色の固形物として得られた (405mg、収率98%)。

50

【0249】

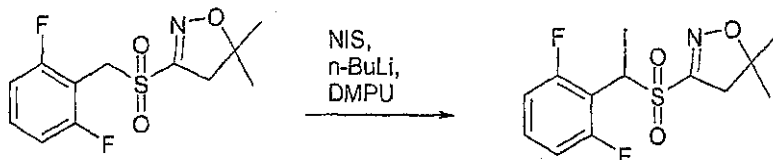
出発物質として1-プロモ-プロパ-2-イン-3-イルと2-プロモエチルメチルエーテルを用いて同じ方法を実施すると、それぞれ表27の化合物番号1.02と表27の化合物番号1.03が得られた。

【0250】

実施例P2：3-[(2,6-ジフルオロ-フェニル)-ヨード-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0251】

【化24】



10

【0252】

1,3-ジメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミドン (DMPU) (0.10ml、0.83ミリモル) と3-(2,6-ジフルオロ-フェニルメタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (0.20g、0.69ミリモル) を窒素雰囲気下でTHF (7ml) に溶かし、-78℃に冷却した。n-ブチルリチウム (ヘキサン中に2.5M) (0.33ml、0.83ミリモル) を一滴ずつ添加した。-78℃にしてから30分後、N-ヨードスクシンイミド (NIS) (187mg、0.83ミリモル) を添加した。この混合物を1時間にわたって攪拌した後、放置してゆっくりと室温まで温めた。塩化アンモニウム水溶液を添加して反応を停止させた。酢酸エチルで数回抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル/ヘキサン) で精製し、イソプロピルアルコールから再結晶させると、生成物 (表27の化合物番号1.25) が白色の固形物として得られた (110mg、収率38%)。

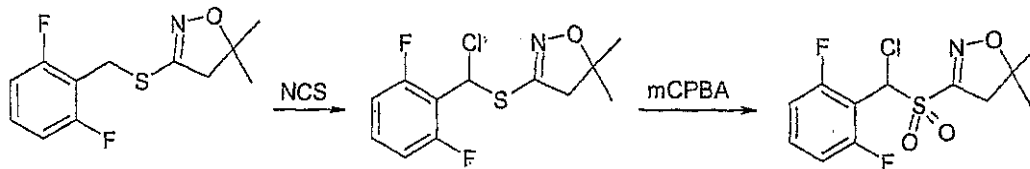
20

【0253】

実施例P3：3-[クロロ-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0254】

【化25】



40

【0255】

N-クロロスクシンイミド (NCS) (0.39g、2.93ミリモル) を、3-(2,6-ジフルオロ-フェニルメタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (0.5g、1.95ミリモル) をジクロロメタン (25ml) に溶かした溶液に45℃で添加し、得られた混合物を45℃にて2.5時間にわたって攪拌した。この溶液を0℃に冷却し、3-クロロペルオキシ安息香酸 (mCPBA) (含有率が50~60重量%) (1.68g、4.90ミリモル) を数回に分けて添加した。0℃にて30分間にわたって攪拌した後、室温にて12時間にわたって攪拌し、飽和メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液を添加して反応を停止させた。有機相を水酸化ナトリウム水溶液 (

50

2M) で数回洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。シリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.07) (158mg) と、3-[クロロ-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾールと3-[クロロ-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-メタンスルフィニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾールの1:2混合物 (364mg) が得られた。この混合物を、上記のようにしてmCPBA (1.0g、0.28ミリモル) を用いて再度酸化した。水性ワークアップとシリカゲル上でのクロマトグラフィによる精製 (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) を行なうと、より多くの生成物 (表27の化合物番号1.07) が白色の固形物として得られた (210mg、すなわち合計で368mg、収率58%)。

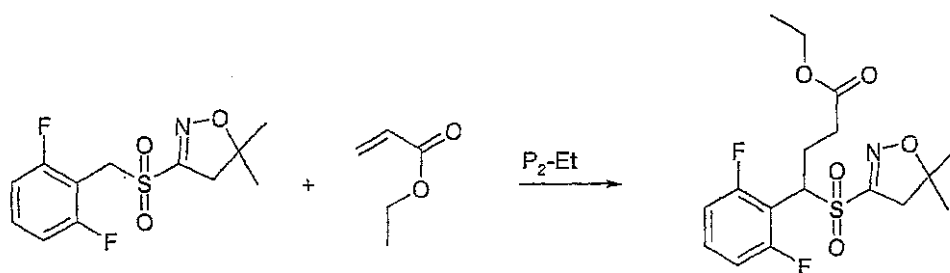
【0256】

10

実施例P4: 4-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-スルホニル)-ブチル酸エチルエステルの調製

【0257】

【化26】



20

【0258】

ホスファゼン塩基である1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-Et) (触媒量、6.1ミリモル) を1滴、3-(2,6-ジフルオロ-フェニルメタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール (300mg、1.04ミリモル) を含むTHF (8ml) に-78℃にて添加した。10分後、アクリル酸エチル (130mg、1.3ミリモル) を添加した。この混合物を-78℃にて3.5時間にわたって攪拌した後、塩酸水溶液 (2M) を添加して反応を停止させた。酢酸エチルで数回抽出し、有機相をブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.08) が無色の油として得られた (375mg、収率93%)。

30

【0259】

出発物質としてエチルビニルケトン、ジエチルビニルホスホネート、N,N-ジメチルアクリルアミド、メチルビニルスルホンを用いて同じ方法を実施すると、それぞれ、表27の化合物番号1.09、表27の化合物番号1.10、表27の化合物番号1.11、表27の化合物番号1.12が得られた。

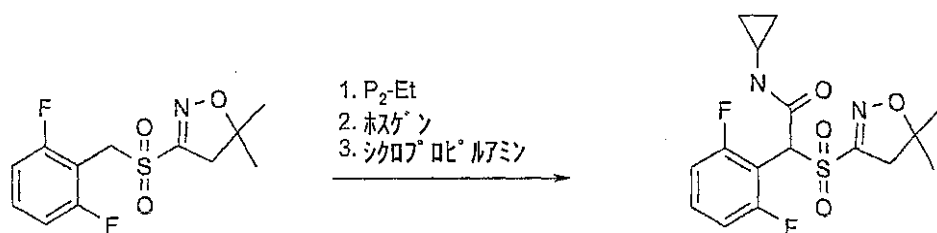
40

【0260】

実施例P5: N-シクロプロピル-2-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-2-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-スルホニル)-アセトアミドの調製

【0261】

【化 27】



10

【0262】

ホスファゼン塩基である1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-Et) (0.68ml、1.37ミリモル)を、3-(2,6-ジフルオロ-フェニルメタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール (180mg、0.62ミリモル)をTHF (5ml)に溶かした溶液に0℃にて添加した。ホスゲン (トルエン中に20重量%) (0.33ml、0.62ミリモル)とシクロプロピルアミン (0.043ml、0.69ミリモル)を添加した。得られた溶液を放置してゆっくりと室温まで温め、室温にて2時間にわたって攪拌した後、塩酸水溶液 (2M)を添加して反応を停止させた。この混合物を酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン)で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.35)が白色の固形物として得られた (460mg、収率20%)。

20

【0263】

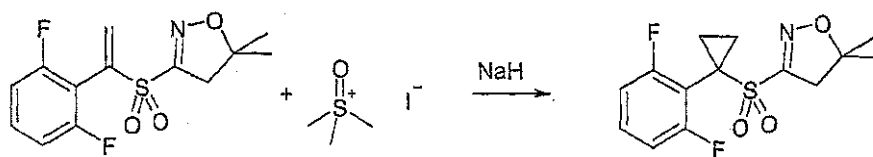
試薬としてジエチルアミンと2,2-ジフルオロエチルアミンを用いて同じ方法を実施すると、それぞれ表27の化合物番号1.36と表27の化合物番号1.56が得られた。

【0264】

実施例P6: 3-[1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-シクロプロパンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾールの調製

【0265】

【化 28】



30

【0266】

ヨウ化トリメチルスルホニウム (0.28g、1.25ml)を、水素化ナトリウム (パラフィン油中に60重量%) (0.052g、1.3ミリモル)をDMSO (4ml)に懸濁させた懸濁液に添加した。この混合物を室温にて30分間にわたって攪拌した。(実施例P12に従って調製した) 3-[1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-エタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール (純度80%) (0.3g、0.8ミリモル)をDMSO (2ml)に溶かした溶液を一滴ずつ添加した。得られた混合物を室温にて1時間にわたって攪拌した。飽和塩化アンモニウム溶液を添加して反応を停止させた後、混合物をジエチルエーテルで数回抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。シリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン)で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.01)が得られた (70mg、収率28%)。

40

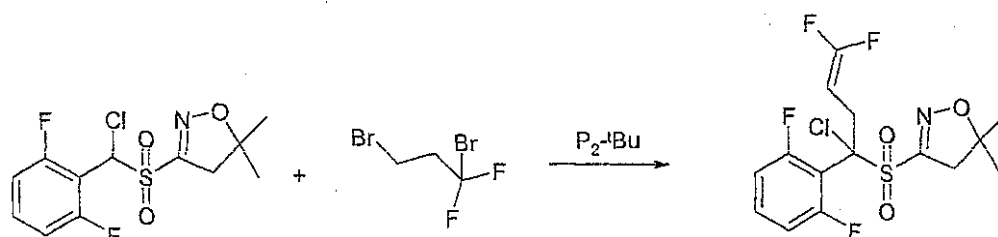
【0267】

50

実施例P7：3-[1-クロロ-1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-4,4-ジフルオロ-ブト-3-エン-1-スルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0268】

【化29】



10

【0269】

ホスファゼン塩基である1-t-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-^tBu) (THF中に2M) (0.34ml、0.68ミリモル)を、(実施例P3に従って調製した) 3-[クロロ-(2,6-ジフルオロ-フェニル)メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (0.1g、0.31ミリモル)をTHF (5ml)に溶かした溶液に一滴ずつ添加した。この溶液を室温にて10分間にわたって攪拌した。1,3-ジブromo-1,1-ジフルオロプロパン (0.09ml、0.37ミリモル)を一滴ずつ添加し、得られた混合物を2時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液 (2M)を添加して反応を停止させた。この混合物を酢酸エチルで希釈し、2つの相に分離した。有機相を飽和塩化ナトリウム水溶液で数回洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル/ヘキサン)で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.17)が白色の固形物として得られた (58mg、収率47%)。

20

【0270】

出発物質として3-(2,6-ジフルオロ-フェニルメタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールを用いて同じ方法を実施すると、表27の化合物番号1.04が得られた。

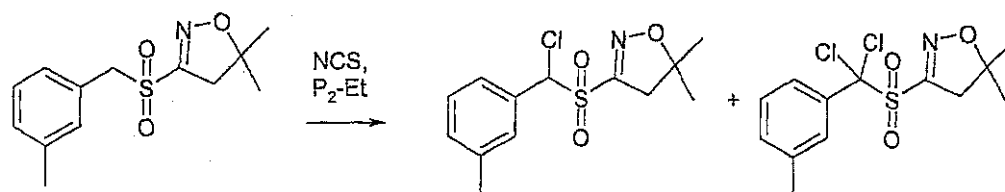
30

【0271】

実施例P8：3-[クロロ-m-トリル-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールと3-[ジクロロ-m-トリル-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0272】

【化30】



40

【0273】

ホスファゼン塩基である1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-Et) (0.34ml、0.68ミリモル)を、3-(3-メチル-フェニルメタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (0.2g、

50

0.79ミリモル)をTHF(4ml)に溶かした溶液に0℃にて一滴ずつ添加した。この溶液を室温にて10分間にわたって攪拌した。N-クロロスクシンイミド(NCS)(0.13g、0.95ミリモル)を添加し、得られた混合物を室温にて2時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液(2M)を添加して反応を停止させた。この混合物を酢酸エチルで希釈し、2つの相に分離した。有機相をブラインで数回洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ(溶離液:酢酸エチル/ヘキサン)で精製すると、白色の固形物としてのモノクロロ生成物(表27の化合物番号1.30)(76mg、収率32%)と、白色の固形物としてのジクロロ生成物(表27の化合物番号1.31)(53mg、収率20%)が得られた。

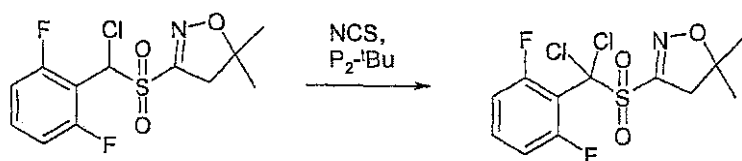
【0274】

10

実施例P9:3-[ジクロロ-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0275】

【化31】



20

【0276】

ホスファゼン塩基である1-t-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン)(P₂-^tBu)(THF中に2M)(0.38ml、0.77ミリモル)を、(実施例P3に従って調製した)3-[クロロ-(2,6-ジフルオロ-フェニル)メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール(0.2g、0.64ミリモル)をTHF(5ml)に溶かした溶液に0℃にて一滴ずつ添加した。この溶液を室温にて10分間にわたって攪拌した。N-クロロスクシンイミド(NCS)(0.10g、0.77ミリモル)を添加し、得られた混合物を室温にて1時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液(2M)を添加して反応を停止させた。この混合物を酢酸エチルで希釈し、2つの相に分離した。有機相をブラインで数回洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をエタノールから再結晶させると、生成物(表27の化合物番号1.26)が白色の固形物として得られた(110mg、収率48%)。

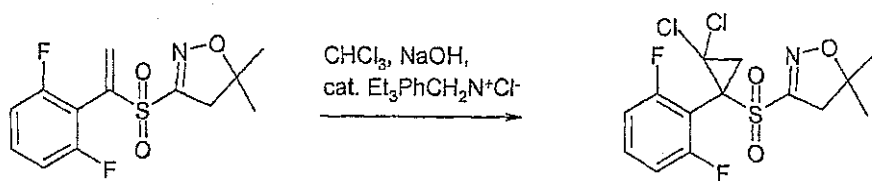
30

【0277】

実施例P10:3-[2,2-ジクロロ-1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-シクロプロパン-スルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0278】

【化32】



40

【0279】

(実施例P12に従って調製した)3-[1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-エテンスルホニル]-

50

5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール（純度80%）（0.2g、0.53ミリモル）と触媒量のトリエチルベンジルアンモニウムクロリドをクロロホルム（1ml）に溶かした。水酸化ナトリウム（0.64g、16ミリモル）を水（1ml）に溶かした溶液を一滴ずつ添加した。得られた混合物を室温にて1.5時間にわたって撹拌した後、水で希釈し、クロロホルムで数回抽出した。1つにまとめた有機相を水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ（溶離液：酢酸エチル／ヘキサン）で精製すると、生成物（表27の化合物番号1.45）が明るい茶色のゴムとして得られ、それがゆっくりと固化した（74mg、収率36%）。

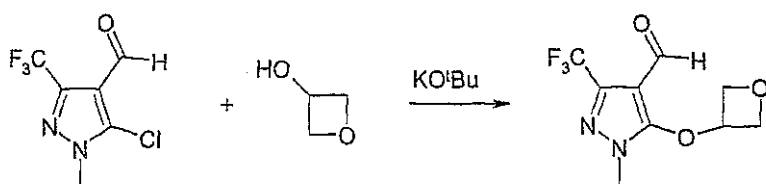
【0280】

実施例I1：1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒドの調製

10

【0281】

【化33】



20

【0282】

オキセタン-3-オール（6.12g、82.7ミリモル）をカリウムt-ブトキシド（TMF中に1M）（69.6ml、69.6ミリモル）に室温にて一滴ずつ添加した。5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒド（9.86g、46.4ミリモル）をTHF（40ml）に溶かし、上記の溶液にゆっくりと添加した。25分後、この混合物を濃縮し、残留物が酢酸エチルと水に分けた。2つの相を分離し、水相を酢酸エチルで数回抽出した。1つにまとめた有機相をブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が茶色の油として得られた（11.6g）。それをさらに精製することなく次のステップで使用した。

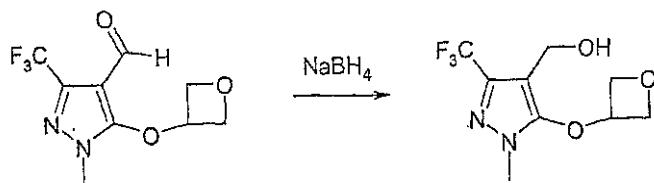
30

【0283】

実施例I2：[1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イル]-メタノールの調製

【0284】

【化34】



40

【0285】

1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒド（11.6g、46.4ミリモル）をメタノール（100ml）に溶かし、ホウ水素化ナトリウム（0.87g、23.0ミリモル）を数回に分けて0℃にて添加した。この混合物を0℃にて2時間にわたって撹拌した後に濃縮し、得られた油をジクロロメタン（100ml）に溶かした。

50

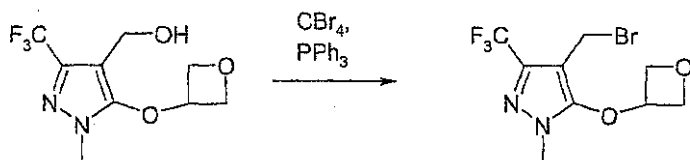
この溶液を水とブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が黄色の固形物として得られた (8.14g)。それをさらに精製することなく次のステップで使用した。

【0286】

実施例I3：4-ブロモメチル-1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの調製

【0287】

【化35】



10

【0288】

[1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イル]-メタノール (8.14g、32.3ミリモル) をジクロロメタン (100ml) に溶かし、トリフェニルホスフィン (8.96g、34.2ミリモル) と四臭化炭素 (10.31g、31.05ミリモル) を添加した。得られた溶液を2時間にわたって攪拌した後、濃縮すると、オレンジ色の油が得られた。シリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン) で精製すると、生成物がオレンジ色の油として得られた (10.1g)。それをさらに精製することなく次のステップで使用した。

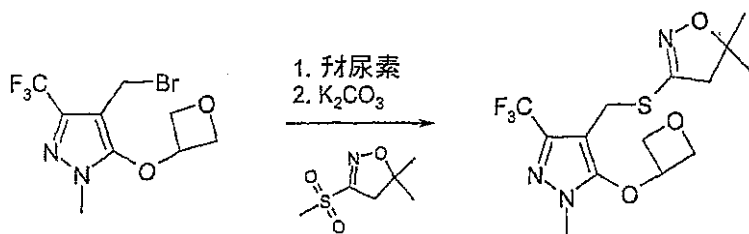
20

【0289】

実施例I4：5,5-ジメチル-3-[1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イルメチルスルファニル]-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0290】

【化36】



30

【0291】

4-ブロモメチル-1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール (10.1g、32.2ミリモル) とチオ尿素 (2.7g、35.5ミリモル) を、固体が溶けるまでエタノール (100ml) の中で室温にて攪拌した。3-メタンスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (6.28g、35.5ミリモル) と炭酸カリウム (4.91g、35.5ミリモル) を添加し、得られた混合物を還流下で2時間にわたって加熱した。この混合物を濃縮し、クロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン) で精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (2ステップで4g、収率34%)。

40

【0292】

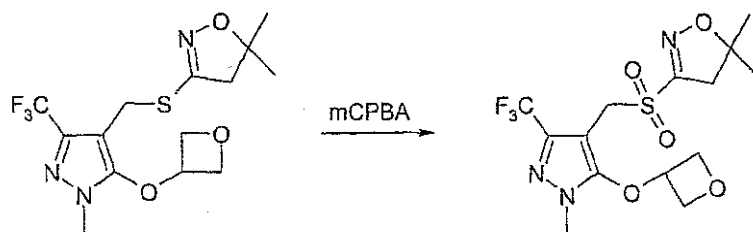
実施例I5：5,5-ジメチル-3-[1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメ

50

チル-1H-ピラゾル-4-イルメタンスルホニル]-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0293】

【化37】



10

【0294】

5,5-ジメチル-3-[1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イルメチルスルファニル]-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (2.71g、7.4ミリモル) をジクロロメタン (100ml) に溶かし、3-クロロ過安息香酸 (mCPBA) (60重量%) (5.33g、18.5ミリモル) を添加した。この溶液を室温にて18時間にわたって保管した後、40%メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液 (20ml) を添加して反応を停止させた。この混合物を水酸化ナトリウム水溶液 (2M) で希釈し、2つの相を分離し、水相をジクロロメタンで抽出した。1つにまとめた有機相を水酸化ナトリウム水溶液 (1M) とブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、緑色の油が得られた。シリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (2g、収率67%)。

20

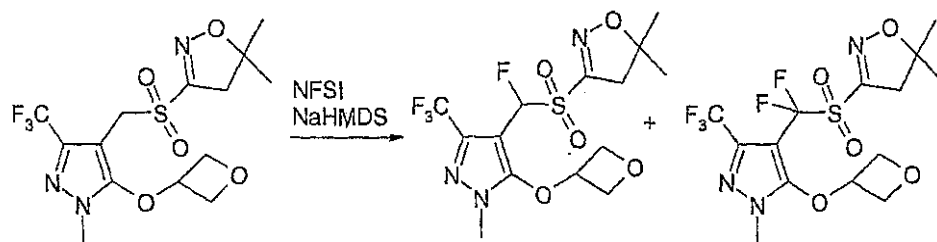
【0295】

実施例P11: 3- {フルオロ-[1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イル]メタンスルホニル} -5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールと3- {ジフルオロ-[1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イル]メタンスルホニル} -5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

30

【0296】

【化38】



40

【0297】

5,5-ジメチル-3-[1-メチル-5-(オキセタン-3-イルオキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イルメタンスルホニル]-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (390mg、1ミリモル) を窒素雰囲気下にて乾燥THF (8ml) の中で攪拌し、ナトリウムヘキサメチルジシラジド (NaHMDS) (THF中に1M) (0.9ml、0.9ミリモル) を-78℃にて一滴ずつ添加した。15分後、N-フルオロベンゼンスルホンイミド (NFSI) (310mg、1ミリモル) を添加した。15分後、追加のナトリウムヘキサメチルジシラジド (NaHMDS) (THF中に1M) (0.9ml、0.9ミリ

50

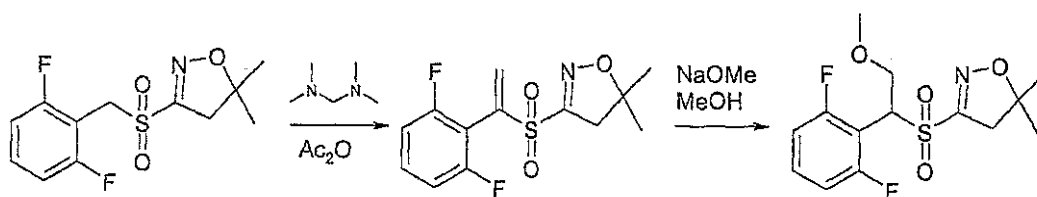
モル) を -78°C にて一滴ずつ添加した後、さらにN-フルオロベンゼンスルホンイミド (NFS I) (310mg、1ミリモル) を添加した。 -78°C にて1時間にわたって攪拌した後、飽和塩化アンモニウム水溶液 (0.5ml) を添加して反応を停止させ、得られた混合物を放置して室温まで温めた。水 (2ml) とジクロロメタン (2ml) を添加し、2つの相を分離し、水相をジクロロメタンで3回抽出した。1つにまとめた有機相をブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、白色の固形物としてのモノフルオロ生成物 (表28の化合物番号2.27) (203mg、収率50%) と、無色の油としてのジフルオロ生成物 (表28の化合物番号2.28) (28mg、収率7%) が得られた。

【0298】

実施例P12: 3-[1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-2-メトキシ-エタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0299】

【化39】



20

【0300】

3-(2,6-ジフルオロ-フェニルメタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (1.0g、3.46ミリモル) とN,N,N',N'-テトラメチルジアミノメタン (1ml、7.34ミリモル) をDMF (7ml) に室温にて溶かし、無水酢酸 (0.7ml、3.8ミリモル) を 60°C にて添加した。 80°C にて3時間にわたって攪拌した後、無水酢酸 (0.7ml、3.8ミリモル) を含むDMF (2ml) をシリンジ・ポンプを通じて2.5時間かけて添加した。この混合物を 60°C にて3時間にわたって攪拌した後、放置して冷却し、室温にて10時間にわたって攪拌した。この混合物を酢酸エチル (30ml) で希釈し、水 ($3 \times 10\text{ml}$) で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物 (1.02g、収率88%) をそれ以上精製せずに使用した。3-[1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-エタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (100mg、0.3ミリモル) を窒素雰囲気下でメタノール (4ml) に溶かし、ナトリウムメトキシド (メタノール中に0.5M) (0.7ml、0.35ミリモル) を添加した。1時間後、この混合物を濃縮し、残留物をクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.51) が得られた (48mg、収率48%)。

30

【0301】

ピラゾール、イミダゾール、インダゾール、4,5-ジヒドロ-ピラゾール、1,2,4-トリアゾール (すなわち出発物質としてのナトリウムメトキシドの代わりの物質) を用いて中性条件下で同じ方法を実施すると、それぞれ表27の化合物番号1.86、表27の化合物番号1.87、表27の化合物番号1.88、表27の化合物番号1.89、表27の化合物番号1.90が得られた。

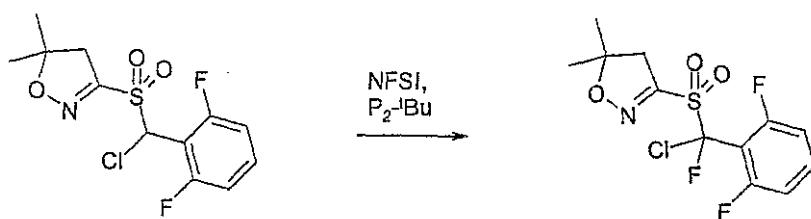
40

【0302】

実施例P13: 3-[クロロ-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-フルオロ-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0303】

【化 4 0】



10

【0304】

ホスファゼン塩基である1-*t*-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン)(P₂-^tBu)(THF中に2M)(0.38ml、0.77ミリモル)を、3-[クロロ-(2,6-ジフルオロ-フェニル)メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール(0.2g、0.64ミリモル)をTHF(2ml)に溶かした溶液に一滴ずつ添加し、この溶液を室温にて10分間にわたって攪拌した。N-フルオロベンゼンスルホンイミド(NFSI)(0.15g、0.77ミリモル)を添加し、得られた混合物を1時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液(2M)を添加して反応を停止させた。この混合物を酢酸エチルで希釈し、2つの相に分離した。有機相をブラインで数回洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ(溶離液:酢酸エチル/ヘキサン)で精製すると、生成物(表27の化合物番号1.21)が白色の固形物として得られた(44mg、収率98%)。

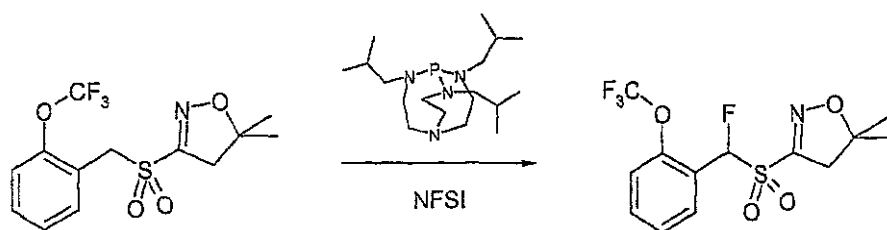
20

【0305】

実施例P14: 3-[フルオロ-(2-トリフルオロメトキシ-フェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾールの調製

【0306】

【化 4 1】



30

【0307】

5,5-ジメチル-3-(2-トリフルオロメトキシ-フェニルメタンスルホニル)-4,5-ジヒドロイソキサゾール(0.2g、0.59ミリモル)をアセトニトリル(5ml)に溶かし、2,8,9-トリイソブチル-2,5,8,9-テトラアザ-1-ホスファビシクロ[3.3.3]ウンデカン(フェルカーデ塩基)(0.44ml、1.24ミリモル)を室温にて一滴ずつ添加した。5分後、N-フルオロベンゼンスルホンイミド(NFSI)(393mg、1.24ミリモル)を一度に添加した。10分後、水(10ml)を添加して反応を停止させた。塩酸水溶液(2M)を添加してこの混合物を酸性化し、酢酸エチルで数回抽出した(3×10ml)。1つにまとめた有機相を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液と水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ(溶離液:酢酸エチル/ヘキサン)で精製すると、生成物(表27の化合物番号1.68)がむ色の油として得られた(145mg、収率69%)。

40

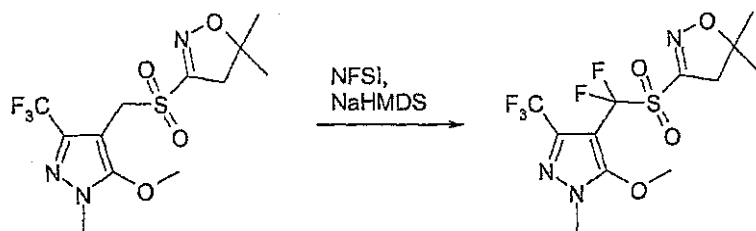
【0308】

50

実施例P15：3-[ジフルオロ-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イル)-メタン]スルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0309】

【化42】



10

【0310】

3-(5-メトキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イル)メタン]スルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (0.209mg、0.59ミリモル) を窒素雰囲気下で乾燥THF (4ml) に溶かし、ナトリウムヘキサメチルジシラジド (THF中に1M) (1.07ml、1.07ミリモル) を-78℃にて一滴ずつ添加した。10分後、N-フルオロベンゼンスルホンイミド (NFSI) (0.185mg、0.59ミリモル) を添加した。15分後、追加のナトリウムヘキサメチルジシラジド (THF中に1M) (1.07ml、1.07ミリモル) を添加し、次いで追加のN-フルオロベンゼンスルホンイミド (NFSI) (0.185mg、0.59ミリモル) を添加した。-78℃にて1時間にわたって攪拌した後、飽和塩化アンモニウム水溶液 (0.5ml) を添加して反応を停止させ、この混合物を放置して室温まで温めた。水 (2ml) とジクロロメタン (2ml) を添加し、2つの相を分離し、水相をジクロロメタンで3回抽出した。1つにまとめた有機相を炭酸水素ナトリウム水溶液とブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン) と逆相HPLC (溶離液：水／アセトニトリル) で精製すると、生成物 (表28の化合物番号2.23) が無色の油として得られた (55mg、収率24%)。

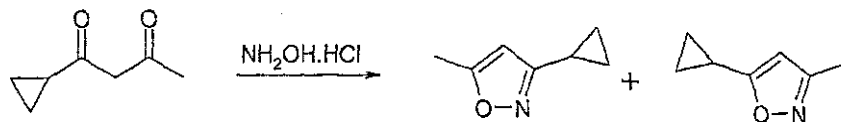
20

【0311】

実施例I6：3-シクロプロピル-5-メチル-イソオキサゾールと5-シクロプロピル-3-メチル-イソオキサゾールの調製

【0312】

【化43】



40

【0313】

(ドイツ国特許第4404059号、ヨーロッパ特許第569760号に従って調製した) 1-シクロプロピル-ブタン-1,3-ジオン (3.5g、25.4ミリモル) と、塩酸ヒドロキシルアミン (2.12g、30.5ミリモル) と、エタノール (1ml) を混合し、この混合物を密封した容器の中でマイクロ波を用いて3分間にわたって130℃に2回加熱した。この混合物を水 (50ml) で希釈し、ジエチルエーテル (3×25ml) で抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。得られた茶色の油をシリカゲルのプラグで濾過した。そのシリカゲルをジエチルエーテルで洗浄し、濾液を濃縮した。粗生成物の混合物 (5.6g) をさらに精製することなく使用した。

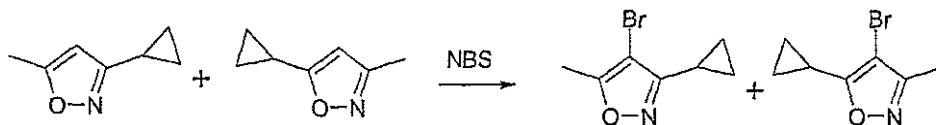
50

【0314】

実施例I7：4-ブromo-3-シクロプロピル-5-メチル-イソオキサゾールと4-ブromo-5-シクロプロピル-3-メチル-イソオキサゾールの調製

【0315】

【化44】



10

【0316】

3-シクロプロピル-5-メチル-イソオキサゾールと5-シクロプロピル-3-メチル-イソオキサゾールの混合物 (5.6g) をDMF (20ml) に溶かし、N-ブromosuccinimide (NBS) (8.66g, 48.6ミリモル) を添加した。この混合物を室温にて18時間にわたって攪拌し、水 (50ml) で希釈し、ジエチルエーテル (3×30ml) で抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗混合物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン) で精製すると、生成物の混合物がオレンジ色の油として得られた (3.0g)。それをさらに精製することなく使用した。

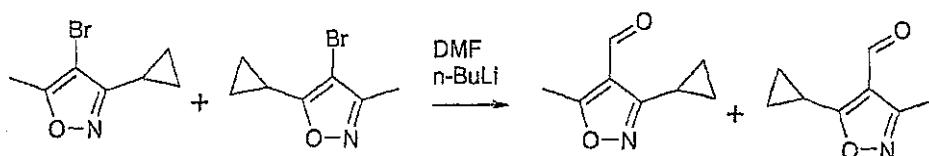
20

【0317】

実施例I8：3-シクロプロピル-4-ホルミル-5-メチル-イソオキサゾールと5-シクロプロピル-4-ホルミル-3-メチル-イソオキサゾールの調製

【0318】

【化45】



30

【0319】

4-ブromo-3-シクロプロピル-5-メチル-イソオキサゾールと4-ブromo-5-シクロプロピル-3-メチル-イソオキサゾールの混合物 (3.0g) を窒素雰囲気下でジエチルエーテル (70ml) に溶かした。n-ブチルリチウム (ヘキサン中に1.6M) (12.5ml, 20ミリモル) を-78℃にて一滴ずつ添加した後、-78℃にてDMF (1.39ml, 18ミリモル) を添加した。この混合物を-78℃にて2時間にわたって攪拌した後、放置して室温まで温めた。水 (20ml) を添加して反応を停止させ、2つの相を分離し、水相をジエチルエーテル (3×50ml) で抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗混合物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン) で精製すると、生成物の混合物がオレンジ色の油として得られた (2.4g)。それをさらに精製することなく使用した。

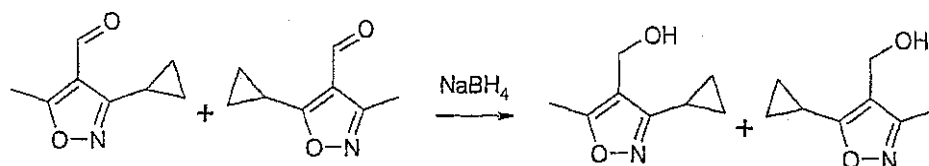
40

【0320】

実施例I9：3-シクロプロピル-4-ヒドロキシメチル-5-メチル-イソオキサゾールと5-シクロプロピル-4-ヒドロキシメチル-3-メチル-イソオキサゾールの調製

【0321】

【化 4 6】



【 0 3 2 2 】

10

3-シクロプロピル-4-ホルミル-5-メチル-イソオキサゾールと5-シクロプロピル-4-ホルミル-3-メチル-イソオキサゾールの混合物 (2.4g) をメタノール (20ml) に溶かし、ホウ水素化ナトリウム (312mg、8.2ミリモル) を0℃にて数回に分けて添加した。得られた混合物を放置して室温まで温め、室温にて2時間にわたって攪拌した。水 (20ml) を添加して反応を停止させ、この混合物を酢酸エチル (3×30ml) で抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物の混合物が無色の油として得られた (4ステップで1.95g、51%)。

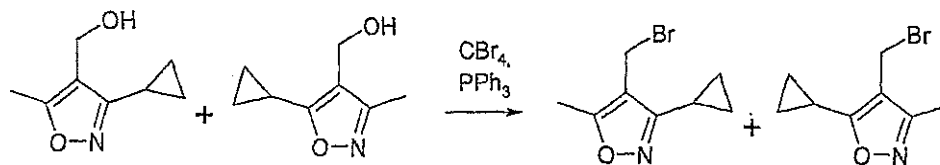
【 0 3 2 3 】

実施例I10：4-ブロモメチル-3-シクロプロピル-5-メチル-イソオキサゾールと4-ブロモメチル-5-シクロプロピル-3-メチル-イソオキサゾールの調製

20

【 0 3 2 4 】

【化 4 7】



30

【 0 3 2 5 】

3-シクロプロピル-4-ヒドロキシメチル-5-メチル-イソオキサゾールと5-シクロプロピル-4-ヒドロキシメチル-3-メチル-イソオキサゾールの混合物 (1.95g、12.7ミリモル) をジクロロメタン (20ml) に溶かし、トリフェニルホスフィン (4.47g、17ミリモル) と四臭化炭素 (4.89g、15ミリモル) を0℃にて添加した。この混合物を0℃にて2時間にわたって攪拌し、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物の混合物が得られた (706mg、収率26%)。

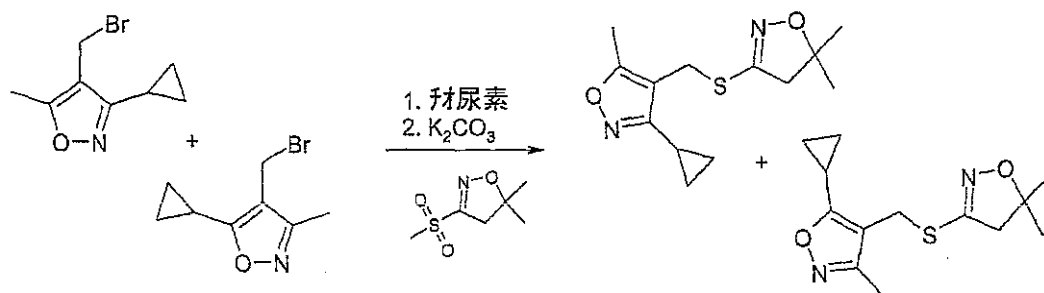
【 0 3 2 6 】

実施例I11：3-シクロプロピル-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾル-3-イルスルファニルメチル)-5-メチル-イソオキサゾールと5-シクロプロピル-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾル-3-イルスルファニルメチル)-3-メチル-イソオキサゾールの調製

40

【 0 3 2 7 】

【化 4 8】



10

【0328】

4-プロモメチル-3-シクロプロピル-5-メチル-イソオキサゾールと4-プロモメチル-5-シクロプロピル-3-メチル-イソオキサゾールの混合物 (706mg、3.3ミリモル) をエタノール (20ml) に溶かし、チオ尿素 (275mg、3.6ミリモル) を数回に分けて添加した。室温にて1時間にわたって攪拌した後、3-メチルスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (586mg、3.3ミリモル) と炭酸カリウム (454mg、3.3ミリモル) を添加し、得られた混合物を還流下で2時間にわたって加熱した。この混合物を濾過し、粗生成物をシリカゲルに吸収させ、シリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物の混合物が得られた (930mg、収率100%)。

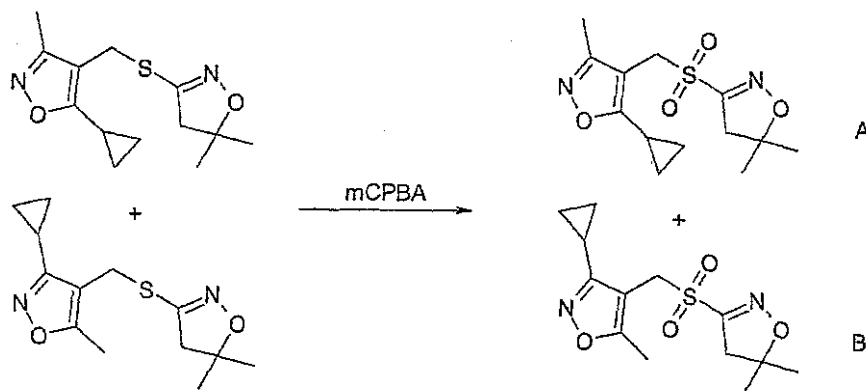
20

【0329】

実施例I12: 3-シクロプロピル-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルホニルメチル)-5-メチル-イソオキサゾールと5-シクロプロピル-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルホニルメチル)-3-メチル-イソオキサゾールの調製

【0330】

【化 4 9】



30

40

【0331】

3-シクロプロピル-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニルメチル)-5-メチルイソオキサゾールと5-シクロプロピル-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニルメチル)-3-メチルイソオキサゾールの混合物 (930mg、3.5ミリモル) をジクロロメタン (20ml) に溶かし、3-クロロペルオキシ安息香酸 (mCPBA) (60重量%) (2.21g、7.7ミリモル) を数回に分けて添加した。この溶液を室温にて10時間にわたって保管した後、10%メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液 (10ml) を添加して反応を停止させた。得られた懸濁液を水酸化ナトリウム水溶液 (1M) で希釈し、ジクロロメ

50

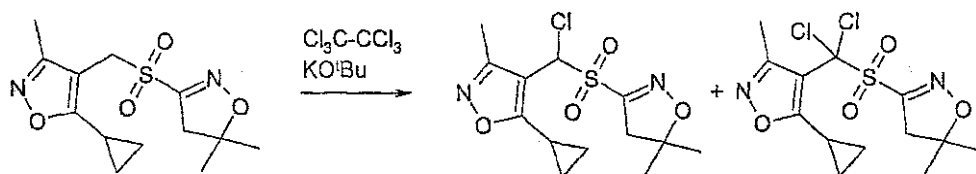
タン (2×100ml) で抽出した。1つにまとめた有機相を水酸化ナトリウム水溶液 (1M) で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上で分離用HPLC (溶離液: ヘキサン/ジクロロメタン) によって精製して分離すると、白色の固形物としての生成物A (536mg、収率51%) と白色の固形物としての生成物B (198mg、収率19%) が得られた。

【0332】

実施例P16: 4-[クロロ-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イルスルホニル)-メチル]-5-シクロプロピル-3-メチル-イソキサゾールと5-シクロプロピル-4-[ジクロロ-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-スルホニル)メチル]-3-メチル-イソキサゾールの調製

【0333】

【化50】



【0334】

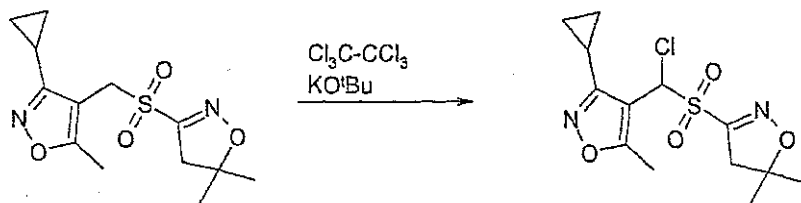
5-シクロプロピル-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イルスルホニルメチル)-3-メチルイソキサゾール (420mg、1.4ミリモル) を窒素雰囲気下でTHF (10ml) に溶かした。この溶液を-78℃に冷却し、カリウムt-ブトキシド (2.2ml、2.2ミリモル) を添加した後、ヘキサクロロエタン (491mg、2.2ミリモル) を添加した。この溶液を放置して室温まで温め、水 (50ml) で希釈し、酢酸エチル (3×30ml) で抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製・分離すると、白色の固形物としてのモノクロロ生成物 (表29の化合物番号3.05) (273mg、収率58%) と白色の固形物としてのジクロロ生成物 (表29の化合物番号3.06) (185mg、収率36%) が得られた。

【0335】

実施例P17: 4-[クロロ-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-スルホニル)-メチル]-3-シクロプロピル-5-メチル-イソキサゾールの調製

【0336】

【化51】



【0337】

3-シクロプロピル-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イルスルホニルメチル)-5-メチルイソキサゾール (108mg、0.36ミリモル) を窒素雰囲気下でTHF (5ml) に溶かした。この溶液を-78℃に冷却し、カリウムt-ブトキシド (0.4ml、0.4ミリモル)

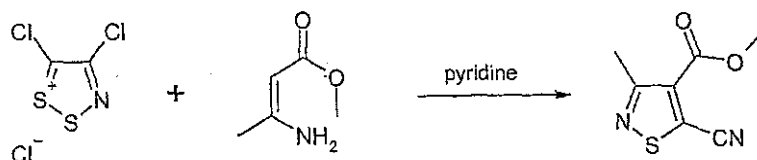
を添加した後、ヘキサクロロエタン（90mg、0.4ミリモル）を添加した。この溶液を放置して室温まで温め、水（20ml）で希釈し、酢酸エチル（3×15ml）で抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ（溶離液：酢酸エチル／ヘキサン）で精製すると、生成物（表29の化合物番号3.07）が白色の固形物として得られた（53mg、収率44%）。

【0338】

実施例I13：5-シアノ-4-メトキシカルボニル-3-メチル-イソオキサゾールの調製

【0339】

【化52】



10

【0340】

（Chem. Ber., 1985年、第118巻、1632ページに従って調製した）4,5-ジクロロ-[1,2,3]-ジチアゾル-1-イリウムクロリド（8.34g、40ミリモル）をジクロロメタン（30ml）に溶かし、3-アミノクロトン酸メチル（4.6g、40ミリモル）を室温にて一滴ずつ添加した。得られた溶液を室温にて1時間にわたって攪拌した後、ピリジン（6.47ml、80ミリモル）をゆっくりと添加した。得られた混合物を濃縮し、シリカゲル上のクロマトグラフィ（溶離液：酢酸エチル／ヘキサン）で精製すると、生成物がオレンジ色の固形物として得られた（1.14g、収率15.6%）。¹H-NMR（400MHz, CDCl₃）：2.88（3H, s, Me）、4.0（3H, s, Me）。

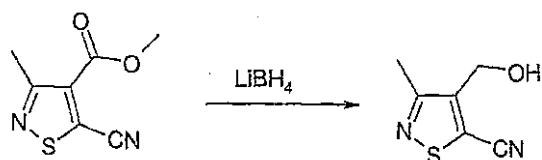
20

【0341】

実施例I14：5-シアノ-4-ヒドロキシメチル-3-メチル-イソチアゾールの調製

【0342】

【化53】



30

【0343】

5-シアノ-4-メトキシカルボニル-3-メチル-イソチアゾール（1.14g、6.3ミリモル）をジエチルエーテル（20ml）とメタノール（0.38ml、9.4ミリモル）に溶かした。ホウ水素化リチウム（204mg、9.4ミリモル）を添加し、得られた混合物を40℃にて2時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液（1M）（20ml）を添加して反応を停止させた。2つの相を分離し、水相をジエチルエーテル（2×20ml）で抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、粗生成物が得られた（1.2g）。この粗生成物は、メチルエステルと生成物の1：1混合物であった。この混合物をさらに精製することなく使用した。

40

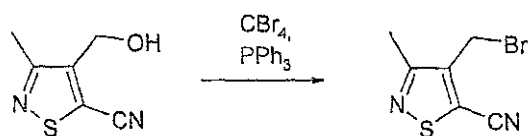
【0344】

実施例I15：4-ブロモメチル-5-シアノ-3-メチル-イソチアゾールの調製

【0345】

50

【化 5 4】



【0 3 4 6】

10

5-シアノ-4-ヒドロキシメチル-3-メチル-イソチアゾール（純度50%）（1.14g、3.7ミリモル）をジクロロメタン（10ml）に溶かし、トリフェニルホスフィン（1.07g、4.0ミリモル）と四臭化炭素（1.18g、3.6ミリモル）を0℃にて添加した。得られた混合物を0℃にて2時間にわたって攪拌し、濃縮し、粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ（溶離液：酢酸エチル／ヘキサン）で精製した。得られた無色の油（0.65g）は、メチルエステル（実施例I14を参照）と生成物の1：1混合物であった。この混合物をさらに精製することなく使用した。

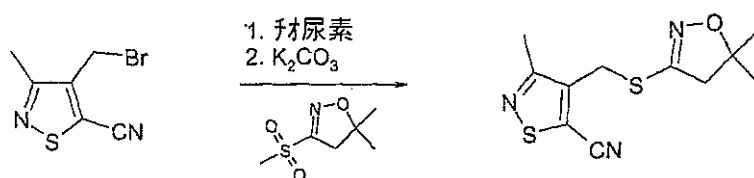
【0 3 4 7】

実施例I16：4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾル-3-イルスルファニルメチル)-3-メチル-イソチアゾール-5-カルボニトリルの調製

20

【0 3 4 8】

【化 5 5】



30

【0 3 4 9】

4-ブロモメチル-5-シアノ-3-メチル-イソチアゾール（純度50%）（0.65g、1.5ミリモル）をエタノール（30ml）に溶かし、チオ尿素（242mg、3.2ミリモル）を添加した。得られた混合物を、固体が溶けるまで室温にて攪拌した。3-メタンスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール（540mg、3.2ミリモル）と炭酸カリウム（440mg、3.2ミリモル）を添加し、得られた混合物を還流下で1時間にわたって加熱した。固形物を濾過によって除去し、濾液を濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ（溶離液：酢酸エチル／ヘキサン）で精製すると、生成物が得られた（0.25g、収率62%）。 $^1\text{H-NMR}$ （400MHz, CDCl_3 ）：1.44（6H, s, Me）、2.6（3H, s, Me）、2.8（2H, s, CH_2 ）、4.4（2H, s, CH_2 ）。

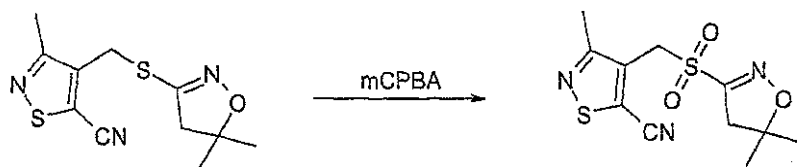
40

【0 3 5 0】

実施例I17：4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾル-3-イルスルホニルメチル)-3-メチル-イソチアゾール-5-カルボニトリルの調製

【0 3 5 1】

【化 5 6】



10

【0352】

4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニルメチル)-3-メチル-イソチアゾール-5-カルボニトリル (0.25g、1ミリモル) をジクロロメタン (25ml) に溶かし、3-クロロペルオキシ安息香酸 (mCPBA) (60重量%) (0.68g、2.4ミリモル) を数回に分けて添加した。得られた溶液を室温にて16時間にわたって保管した後、10%メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液 (20ml) を添加して反応を停止させた。得られた懸濁液を水酸化ナトリウム水溶液 (1M) で希釈し、ジクロロメタン (2×30ml) で抽出した。1つにまとめた有機相を水酸化ナトリウム水溶液 (1M) で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (0.15g、収率50.1%)。

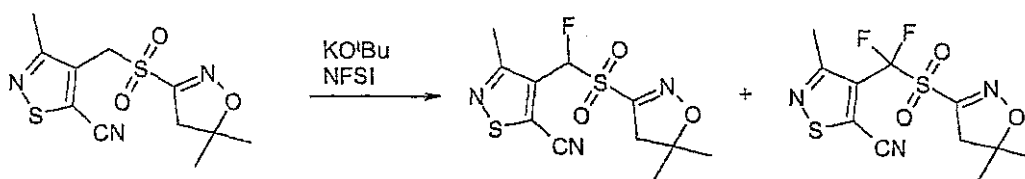
20

【0353】

実施例P18: 4-[(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)-フルオロメチル]-3-メチル-イソチアゾール-5-カルボニトリルと4-[(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)-ジフルオロメチル]-3-メチル-イソチアゾール-5-カルボニトリルの調製

【0354】

【化 5 7】



30

【0355】

4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニルメチル)-3-メチル-イソチアゾール-5-カルボニトリル (0.15g、0.57ミリモル) を窒素雰囲気下でTHF (10ml) に溶かし、ナトリウムヘキサメチルジシラジド (THF中に1M) (1.3ml、1.29ミリモル) を-78℃にてゆっくりと添加した。5分後、N-フルオロベンゼンスルホンイミド (NFSI) (0.377g、1.2ミリモル) を添加し、得られた溶液を放置して室温まで温めた。この混合物を濃縮し、粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、白色の固形物としてのモノフルオロ生成物 (表29の化合物番号3.01) (49mg、収率25.6%) と白色の固形物としてのジフルオロ生成物 (表29の化合物番号3.02) (49mg、収率27.1%) が得られた。

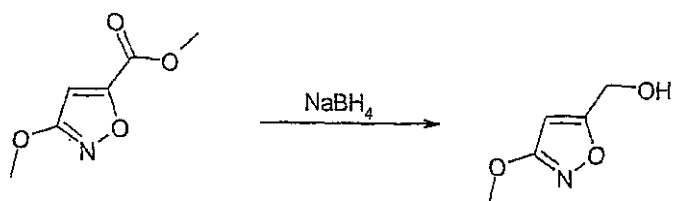
40

【0356】

実施例I18: (3-メトキシ-イソオキサゾール-5-イル)-メタノールの調製

【0357】

【化 5 8】



10

【 0 3 5 8】

(Eur. J. Org. Chem., 1998年、473ページに従って調製した) 3-メトキシ-イソオキサゾール-5-カルボン酸メチルエステル (1.0g、6.4ミリモル) をメタノール (30ml) に溶かし、ホウ水素化ナトリウム (300mg、8.0ミリモル) を数回に分けて添加した。得られた混合物を室温にて1時間にわたって攪拌し、濃縮し、残留物をジクロロメタン (30ml) に溶かした。得られた溶液を水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が濃縮溶液としてジクロロメタンの中に得られた。この溶液をさらに精製することなく使用した。

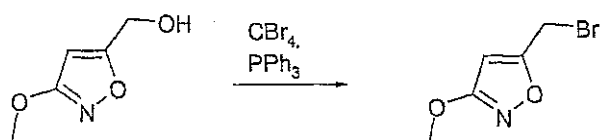
【 0 3 5 9】

実施例I19：5-ブロモメチル-3-メトキシ-イソオキサゾールの調製

20

【 0 3 6 0】

【化 5 9】



30

【 0 3 6 1】

(3-メトキシ-イソオキサゾール-5-イル)-メタノール (822mg、6.4ミリモル) をジクロロメタン (10ml) に溶かし、トリフェニルホスフィン (1.84g、7.0ミリモル) と四臭化炭素 (2g、6.11ミリモル) を 0°C にて添加した。得られた混合物を 0°C にて2時間にわたって攪拌し、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が無色の油として得られた (1.22g、収率99%)。それをさらに精製することなく次のステップで使用した。

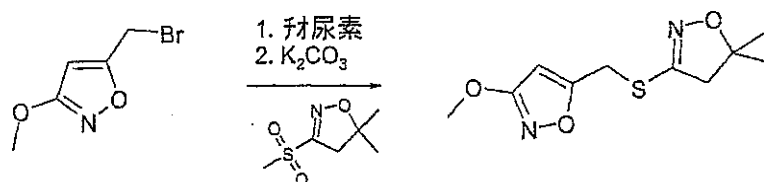
【 0 3 6 2】

実施例I20：5-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニルメチル)-3-メトキシ-イソオキサゾールの調製

40

【 0 3 6 3】

【化 60】



10

【0364】

5-ブロモメチル-3-メトキシ-イソオキサゾール (1.22g、6.35ミリモル) をエタノール (30ml) に溶かし、チオ尿素 (484mg、6.4ミリモル) を添加した。得られた混合物を、固体が溶けるまで室温にて攪拌した。3-メタンスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (1.08g、6.4ミリモル) と炭酸カリウム (880mg、6.4ミリモル) を添加し、得られた混合物を還流下で1時間にわたって加熱した。固体を濾過によって除去し、濾液を濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が無色の油として得られた (3ステップで0.69g、収率45%)。

【0365】

実施例I21: 5-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニルメチル)-3-メトキシ-イソオキサゾールの調製

20

【0366】

【化 61】



30

【0367】

5-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニルメチル)-3-メトキシ-イソオキサゾール (693mg、2.9ミリモル) をジクロロメタン (10ml) に溶かし、3-クロロペルオキシ安息香酸 (mCPBA) (60重量%) (1.81g、6.3ミリモル) を数回に分けて添加した。得られた溶液を室温にて16時間にわたって保管した後、10%メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液 (10ml) を添加して反応を停止させた。得られた懸濁液を水酸化ナトリウム水溶液 (1M) で希釈し、ジクロロメタン (2×100ml) で抽出した。1つにまとめた有機相を水酸化ナトリウム水溶液 (1M) で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (0.78g、収率99%)。

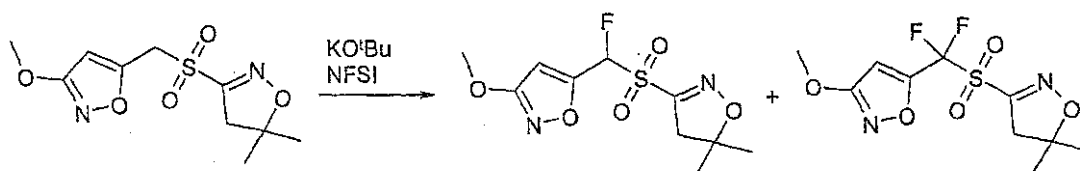
40

【0368】

実施例P19: 5-[(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)-フルオロメチル]-3-メトキシ-イソオキサゾールと5-[(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)-ジフルオロメチル]-3-メトキシ-イソオキサゾールの調製

【0369】

【化 6 2】



【 0 3 7 0 】

10

5-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-スルホニルメチル)-3-メトキシ-イソキサゾール (0.2g、0.73ミリモル) を窒素雰囲気下でTHF (10ml) に溶かし、-78℃にてカリウムt-ブトキシド (THF中に1M) (1.13ml、1.13ミリモル) をゆっくりと添加した。N-フルオロベンゼンスルホンイミド (NFSI) (0.356g、1.13ミリモル) を添加し、得られた混合物を放置して室温まで温めた。この混合物を濾過し、濾液を濃縮した。残留物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン) で精製すると、白色の固形物としてのモノフルオロ生成物 (表31の化合物番号5.03) (0.087g、収率40.8%) と白色の固形物としてのジフルオロ生成物 (表31の化合物番号5.04) (0.063g、収率27.7%) が得られた。

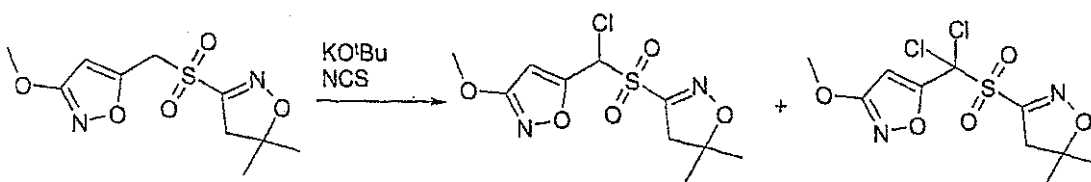
【 0 3 7 1 】

20

実施例P20：5-[クロロ-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-スルホニル)-メチル]-3-メトキシ-イソキサゾールと5-[ジクロロ-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-スルホニル)-メチル]-3-メトキシ-イソキサゾールの調製

【 0 3 7 2 】

【化 6 3】



30

【 0 3 7 3 】

5-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-スルホニルメチル)-3-メトキシ-イソキサゾール (0.269g、0.98ミリモル) を窒素雰囲気下でTHF (10ml) に溶かし、-78℃にてカリウムt-ブトキシド (THF中に1M) (1.28ml、1.28ミリモル) をゆっくりと添加した。N-クロロスクシンイミド (NCS) (0.171g、1.28ミリモル) を添加し、得られた混合物を放置して室温まで温めた。この混合物を濃縮し、シリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン) で精製すると、無色の油としてのモノクロロ生成物 (表31の化合物番号5.01) (90mg、収率31.1%) と白色の固形物としてのジクロロ生成物 (表31の化合物番号5.02) (94mg、収率27.9%) が得られた。

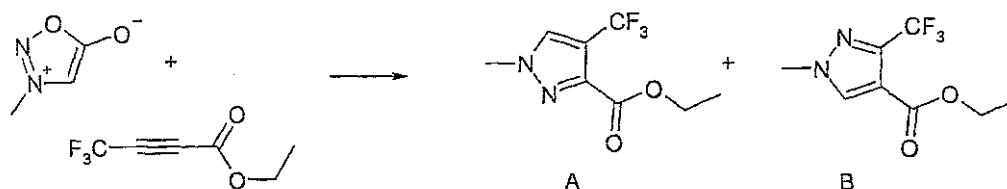
40

【 0 3 7 4 】

実施例I22：1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチルエステルと1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステルの調製

【 0 3 7 5 】

【化 6 4】



10

【0 3 7 6】

(J. Heterocycl. Chem., 1996年、第33巻、719ページに従って調製した) 5-ヒドロキシ-3-メチル-[1,2,3]-オキサジアゾリウム (3-メチルシドノン) (25.7g、256ミリモル) をキシレン (120g) に懸濁させ、100℃に加熱した。(Organic Syntheses, 1992年、第70巻、246~255ページに従って調製した) 4,4,4-トリフルオロ-2-イン酸エチルエステル (44.8g、270ミリモル) を一滴ずつゆっくりと添加した。得られた混合物を100℃にて4時間にわたって攪拌し、濃縮した。得られた粗油に酢酸エチル (10ml) を添加すると、生成物が結晶化した。結晶化した生成物を酢酸エチルとヘキサン (50ml) の1:1混合物 (50ml) で洗浄し、ヘキサン (50ml) で洗浄し、乾燥させると、生成物Aが白色の結晶として得られた (20.9g、収率36.6%)。母液を濃縮し、シリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、より多くの生成物A (14.3g、収率25.1%) と、生成物B (10.0g、収率17.5%) が得られた。

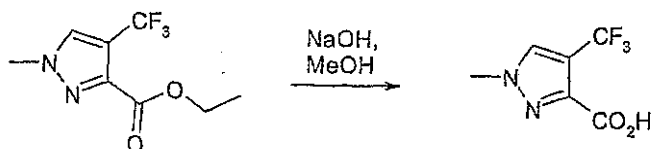
20

【0 3 7 7】

実施例I23: 1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸の調製

【0 3 7 8】

【化 6 5】



30

【0 3 7 9】

1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチルエステル (20g、90ミリモル) をメタノール (100ml) に溶かした。水酸化ナトリウムを含むメタノール (1M) (95ml、95ミリモル) を一滴ずつ添加した。得られた混合物を室温にて2時間にわたって攪拌し、室温にて16時間にわたって保管した後、濃縮した。残留物を塩酸水溶液 (2M) (55ml) と酢酸イソプロピル (300ml) に溶かした。2つの相を分離し、水相を追加の酢酸イソプロピル (100ml) で抽出した。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。すると生成物が白色の固形物として得られた (17.5g、収率100%)。融点: 174~175℃。

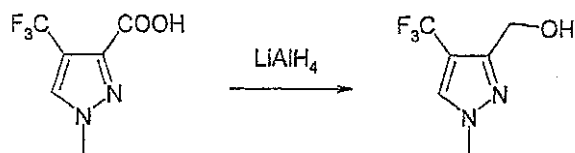
40

【0 3 8 0】

実施例I24: 3-ヒドロキシメチル-1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの調製

【0 3 8 1】

【化 6 6】



【0382】

10

水素化アルミニウムリチウム (THF中に1M) (11ml、11ミリモル) を、1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1.94g、10ミリモル) をTHF (20ml) に溶かした溶液に、窒素雰囲気下で一滴ずつ添加した。攪拌しやすくするため、追加のTHF (20ml) を添加した。室温にて5時間にわたって攪拌した後、水 (0.5ml) を添加し、15%水酸化ナトリウム水溶液 (0.5ml) を添加し、追加の水 (0.5ml) を添加して反応を停止させた。酢酸エチル (50ml) と硫酸マグネシウム (25g) を添加し、得られた混合物を室温にて18時間にわたって保管した。珪藻土 (30g) を添加し、得られた混合物を濾過し、固体を酢酸エチルで洗浄した。1つにまとめた濾液と洗浄液を濃縮すると、生成物が淡い黄色の油性固形物として得られた (1.38g、収率77%)。 $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3): 2.3 (1H, bs, OH)、3.91 (3H, s, Me)、4.75 (2H, s, CH_2)、7.62 (1H, s, CH)。

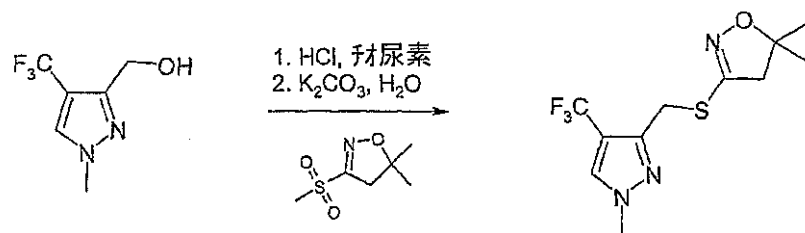
20

【0383】

実施例125: 5,5-ジメチル-3-(1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イルメチルスルファニル)-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0384】

【化 6 7】



30

【0385】

3-ヒドロキシメチル-1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール (1.34g、7.4ミリモル) とチオ尿素 (836mg、11ミリモル) を1,4-ジオキササン (5ml) と水 (2ml) に溶かした溶液に濃塩酸 (36重量%) (3.0ml、36ミリモル) を添加した。この混合物を密封した容器の中でマイクロ波を用いて10分間にわたって130℃に加熱した後、室温まで冷却し、水 (5ml) に溶かした炭酸カリウム (4.14g、30ミリモル) を添加した。3-メタンスルホン-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (2.12g、12ミリモル) と1,4-ジオキササン (5ml) を添加し、得られた混合物を密封した容器の中でマイクロ波を用いて30分間にわたって150℃に加熱した。追加の炭酸カリウム (1.38g、10ミリモル) を添加し、得られた混合物を密封した容器の中でマイクロ波を用いて20分間にわたって150℃に加熱した。この混合物を室温まで冷却し、酢酸エチル (3×50ml) で抽出し、抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。残留物をシリカゲル上で分離用HPLC (綾里駅: ジクロロメタン/酢酸エチル) を利用して精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (220mg、収率10%)。 $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3): 1.42 (6H, s, Me)、2.84 (2H, s, CH_2)、3.89 (3H, s, Me)、4.36 (2H, s, CH_2)、7.60 (1H, s, CH)。

40

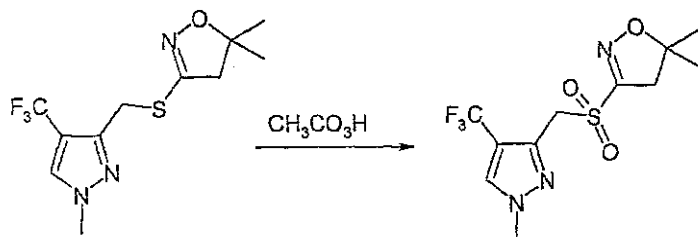
50

【0386】

実施例I26：5,5-ジメチル-3-(1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-3-イルメタンスルホニル)-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0387】

【化68】



10

【0388】

5,5-ジメチル-3-(1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-3-イルメチルスルファニル)-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (200mg、0.68ミリモル) をジクロロメタン (3ml) に溶かした溶液に過酢酸溶液 (酢酸中に40重量%) (0.3ml、1.6ミリモル) を室温にて一滴ずつ添加した。得られた溶液を還流下で3時間にわたって加熱した後、室温にて17時間にわたって保管した。10%メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液 (1.5ml) を添加して反応を停止させた。2つの相を分離し、水相をジクロロメタン (2×3ml) で抽出した。1つにまとめた有機抽出液を炭酸カリウム水溶液 (2M) (2ml) で洗浄し、洗浄液をジクロロメタン (2×3ml) で抽出した。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が白色の固形物として得られた (220mg、収率99%)。融点：125~126℃。¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : 1.52 (6H, s, Me)、3.08 (2H, s, CH₂)、3.94 (3H, s, Me)、4.72 (2H, s, CH₂)、7.70 (1H, s, CH)。

20

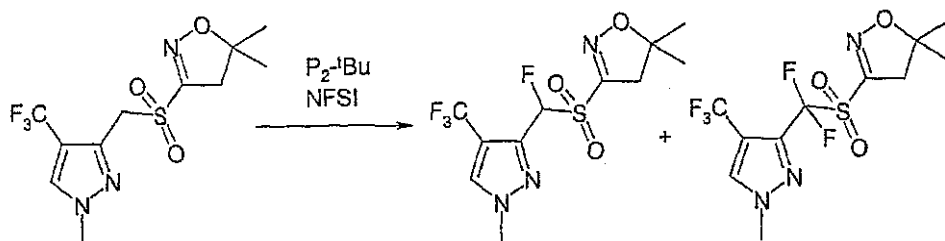
【0389】

実施例P21：3-[フルオロ-(1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-3-イル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールと3-[ジフルオロ-(1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-3-イル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

30

【0390】

【化69】



40

【0391】

ホスファゼン塩基である1-t-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-^tBu) (THF中に2M) (0.65ml、1.3ミリモル) を、5,5-ジメチル-3-(1-メチル-4-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-3-イルメタンス

50

ルホニル)-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (200mg、0.61ミリモル) をTHF (6ml) に溶かした溶液に、室温にて添加した。10分後、N-フルオロベンゼンスルホンイミド (NFSI) (410mg、1.3ミリモル) を添加した。得られた混合物を室温にて3時間にわたって攪拌した後、室温にて17時間にわたって保管した。この混合物を濃縮し、残留物を酢酸エチル (100ml) に溶かし、シリカゲルを通過させた。濾液を濃縮し、残留物をシリカゲル上で分離用HPLC (溶離液：ジクロロメタン) を利用して精製すると、白色の固形物としてのモノフルオロ生成物 (表30の化合物番号4.04) (87mg、収率41%) と、白色の固形物としてのジフルオロ生成物 (表30の化合物番号4.05) (72mg、収率33%) が得られた。

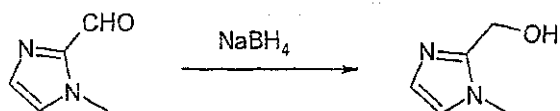
【0392】

実施例127：(1-メチル-1H-イミダゾル-2-イル)-メタノールの調製

10

【0393】

【化70】



【0394】

20

1-メチル-1H-イミダゾール-2-カルバルデヒド (1.1g、10ミリモル) をエタノール (25ml) に溶かした溶液にホウ水素化ナトリウム (380mg、10ミリモル) を添加した。得られた混合物を室温にて2時間にわたって攪拌した。メタノール (20ml) を添加して反応を停止させた。この混合物を水とジクロロメタンに分けた。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が白色の固形物として得られた (480mg、収率42%)。 $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) : 3.73 (3H, s, Me)、4.32 (1H, bs, OH)、4.67 (2H, s, CH_2)、6.84 (1H, s, CH)、6.90 (1H, s, CH)。

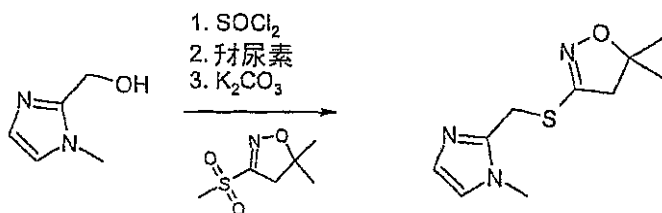
【0395】

実施例128：5,5-ジメチル-3-(1-メチル-1H-イミダゾル-2-イルメチルスルファニル)-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

30

【0396】

【化71】



40

【0397】

(1-メチル-1H-イミダゾル-2-イル)-メタノール (467mg、4.16ミリモル) をアセトニトリル (30ml) に溶かした溶液に塩化チオニル (0.909ml、12.5ミリモル) を一滴ずつ添加した。得られた混合物を室温にて3時間にわたって攪拌した後、濃縮すると、黄色いゴムが得られた。このゴムをTHFに溶かし、濃縮すると、淡い黄色の固形物が得られた。その固形物をエタノール (42ml) に溶かし、チオ尿素 (634mg、8.33ミリモル) を添加し、得られた混合物を還流下で1時間にわたって加熱した。この混合物をわずかに冷却し、この混合物に3-メタンスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (740mg、4.1

50

8ミリモル)と炭酸カリウム(1.63g、11.8ミリモル)を添加した。得られた混合物を還流下で2時間にわたって加熱した。この混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機抽出液を濃縮した。残留物をクロロホルムと研和し、沈殿物を濾過によって除去した。濾液を濃縮すると、生成物が黄色のゴムとして得られた(829mg、収率88%)。¹H-NMR(400MHz, CDCl₃): 1.4(6H, s, Me)、2.85(2H, s, CH₂)、3.7(3H, s, Me)、4.45(2H, s, CH₂)、6.82(1H, d, CH)、6.95(1H, d, CH)。

【0398】

実施例I26に記載した方法を利用して5,5-ジメチル-3-(1-メチル-1H-イミダゾル-2-イルメチルスルファニル)-4,5-ジヒドロイソキサゾールを酸化した後、実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化すると、表32の化合物番号6.01が得られた。

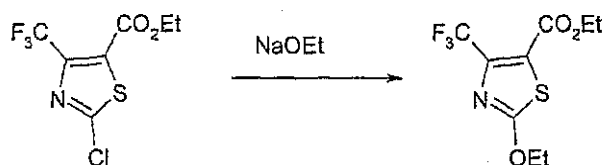
10

【0399】

実施例I29: 2-エトキシ-4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-カルボン酸エチルエステルの調製

【0400】

【化72】



20

【0401】

2-クロロ-4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-カルボン酸エチルエステル(259mg、1.0ミリモル)と、ナトリウムエトキシド(エタノール中に23重量%) (0.33ml、1.1ミリモル)と、エタノール(2ml)を還流下で2時間にわたって加熱した。得られた混合物を水と酢酸エチルに分けた。有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が黄色いゴムとして得られた(187mg、収率70%)。¹H-NMR(400MHz, CDCl₃): 1.36(3H, t, Me)、1.45(3H, t, Me)、4.35(2H, q, CH₂)、4.55(2H, q, CH₂)。

30

【0402】

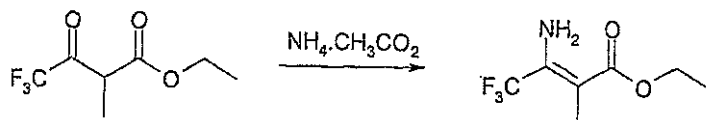
2-エトキシ-4-トリフルオロメチル-チアゾール-5-カルボン酸エチルエステルを実施例I24に記載した方法を利用して還元し、実施例I28に記載した方法を利用して誘導体化し、実施例I26に記載した方法を利用して酸化した後、実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化すると、表33の化合物番号7.01が得られた。

【0403】

実施例I30: 3-アミノ-4,4,4-トリフルオロ-2-メチル-ブト-2-エン酸エチルエステルの調製

【0404】

【化73】



40

【0405】

50

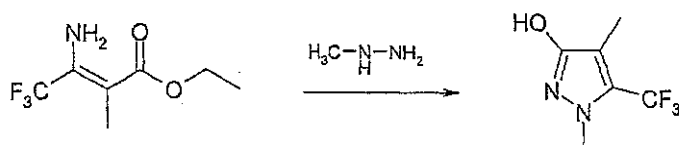
α -メチル-4,4,4-トリフルオロアセト酢酸エチル (24.5g、124ミリモル) と酢酸アンモニウム (28.6g、372ミリモル) をエタノール (50ml) と水 (2.5ml) に溶かした。この溶液を還流下で16時間にわたって加熱した後、放置して室温まで冷却し、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が淡い茶色の液体として得られた (25.5g、収率100%)。それをさらに精製することなく使用した。

【0406】

実施例I31：1,4-ジメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-3-オールの調製

【0407】

【化74】



【0408】

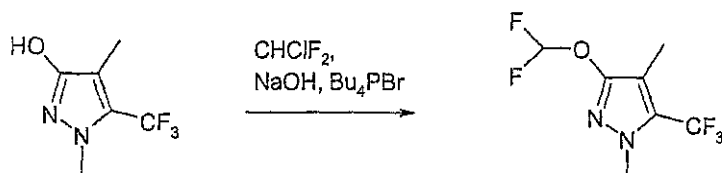
3-アミノ-4,4,4-トリフルオロ-2-メチル-ブト-2-エン酸エチルエステル (25.5g、124ミリモル) を0℃に冷却し、メチルヒドラジン (7ml、132ミリモル) を一滴ずつ添加した。得られた混合物を放置して室温まで温めた後、20時間にわたって50℃に加熱した。この混合物を放置して室温まで冷却し、16時間にわたって攪拌した。この混合物を0℃に冷却し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (50ml) を添加した。固体を濾過によって除去し、冷たい水 (0℃) で洗浄すると、生成物が白色の固形物として得られた (2ステップで8.46g、収率38%)。

【0409】

実施例I32：3-ジフルオロメトキシ-1,4-ジメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの調製

【0410】

【化75】



【0411】

-78℃に冷却した反応フラスコの中にフロン・ガス (50ml) を入れて凝縮させ、1,4-ジメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-3-オール (4.5g、25ミリモル) とテトラブチルホスホニウムブロミド (2.8g、8.25ミリモル) を含むジクロロメタン (75ml) を添加した。水酸化ナトリウム水溶液 (50重量%) (75ml) を-78℃にて一滴ずつ添加した。得られた混合物を室温まで温め、3時間にわたって攪拌した。水を添加して反応を停止させた。2つの相を分離し、水相をジクロロメタンで抽出した。1つにまとめた有機相を水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗材料をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：ジクロロメタン/ヘキサン) で精製すると、生成物が無色の液体として得られた (2.9g、収率50%)。¹⁹F-NMR (400MHz, CDCl₃) : -84.1 (2F, d, J=75Hz, CF₂)、-58.92 (3F, s, CF₃)。

10

20

30

40

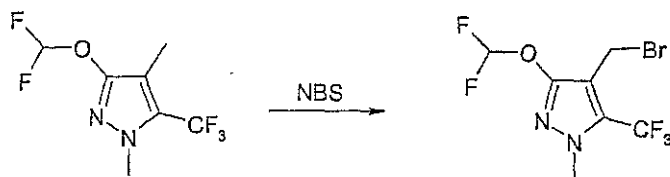
50

【0412】

実施例I33：4-ブロモメチル-3-ジフルオロメトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの調製

【0413】

【化76】



10

【0414】

3-ジフルオロメトキシ-1,4-ジメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール (2.9g、12.6ミリモル) を四塩化炭素 (50ml) に溶かし、N-ブロモスクシンイミド (NBS) (2.49g、13.9ミリモル) とAIBN (206mg、1.3ミリモル) を窒素雰囲気下で添加した。得られた混合物を還流下で加熱し、石英管に封入したハロゲン・サンランプを照射した。30分後、この混合物を放置して室温まで冷却し、濾過し、固体をジクロロメタンで洗浄した。1つにまとめた濾液と洗浄液を濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が得られた (3.3g、収率85%)。

20

【0415】

4-ブロモメチル-3-ジフルオロメトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールを実施例I4に記載した方法を利用して誘導体化し、実施例I21に記載した方法を利用して酸化した後、実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化すると、表28の化合物番号2.34が得られた。

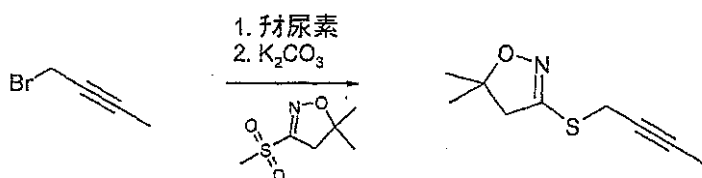
【0416】

実施例I34：3-ブト-2-イニルスルファニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

30

【0417】

【化77】



40

【0418】

1-ブロモ-2-ブチン (2.47ml、28.21ミリモル) をエタノール (69ml) に溶かした溶液にチオ尿素 (2.15g、28.21ミリモル) を添加し、得られた溶液を還流下で1時間40分にわたって加熱した。この混合物を放置して室温まで冷却し、3-メタン-スルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (5g、28.21ミリモル) と炭酸カリウム (4.28g、31.03ミリモル) を添加した。得られた混合物を還流下で2時間35分にわたって加熱した後、放置して室温まで冷却した。この混合物を水と酢酸エチルに分けた。水相を酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機相をブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。残留物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル/ヘキサン) で

50

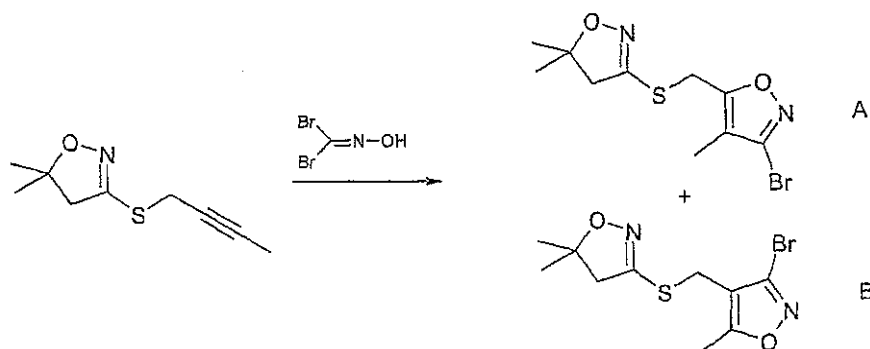
精製すると、生成物が淡い黄色の油として得られた (3.085g、収率60%)。¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : 1.42 (6H, s, Me)、1.83 (3H, t, Me)、2.81 (2H, s, CH₂)、3.77 (2H, q, CH₂)。

【0419】

実施例I35：3-ブromo-5-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニル-メチル)-4-メチル-イソオキサゾールと3-ブromo-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニル-メチル)-5-メチル-イソオキサゾールの調製

【0420】

【化78】



10

20

【0421】

(Synlett、2002年、3071ページに従って調製した) ジブromoホルムアルドキシム (944mg、4.68ミリモル) と炭酸水素ナトリウム (872mg、10.37ミリモル) を、3-ブト-2-イニルスルファニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (428mg、2.34ミリモル) を酢酸エチル (4ml) に溶かした溶液に添加し、得られた混合物を還流下で4日間にわたって加熱した。この混合物を放置して室温まで冷却した後、水と酢酸エチルに分けた。水相を酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機相をブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。残留物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が黄色い油として得られた (347mg、収率49%)。A : ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : 1.41 (6H, s, Me)、2.51 (3H, s, Me)、2.77 (2H, s, CH₂)、4.01 (2H, s, CH₂) ; B : ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : 1.42 (6H, s, Me)、2.03 (3H, s, Me)、2.79 (2H, s, CH₂)、4.32 (2H, s, CH₂)。

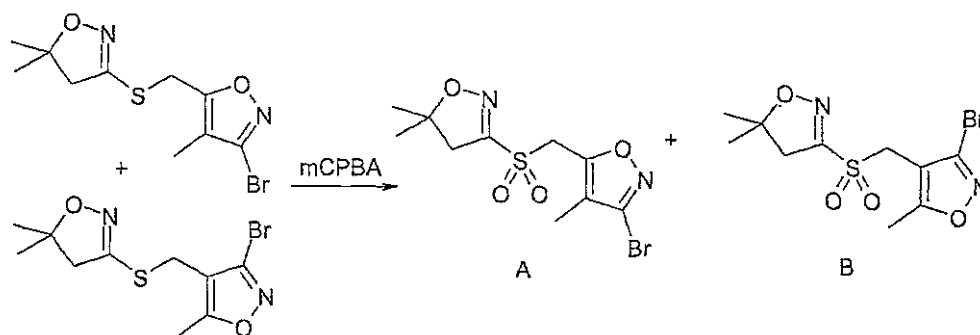
30

【0422】

実施例I36：3-ブromo-5-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル-メチル)-4-メチル-イソオキサゾールと3-ブromo-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニルメチル)-5-メチル-イソオキサゾールの調製

【0423】

【化 7 9】



10

【0424】

3-プロモ-5-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニルメチル)-4-メチルイソオキサゾールと3-プロモ-4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニルメチル)-5-メチルイソオキサゾール (310mg、1.02ミリモル) をジクロロメタン (5ml) に溶かした溶液に3-クロロペルオキシ安息香酸 (mCPBA) (70重量%) (774mg、2.24ミリモル) を0℃にて添加した。得られた混合物を放置して室温まで温めた後、室温にて24時間にわたって攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を添加して反応を停止させた。2つの相を分離し、水相をジクロロメタンで抽出した。1つにまとめた有機相を20%メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液 (10ml) で洗浄し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。残留物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン) で精製すると、生成物の混合物が白色の固形物として得られた。この固形物をシリカゲル上で分離用HPLC (溶離液：酢酸エチル／ヘキサン) によって精製して分離すると、白色の固形物としての生成物A (124mg、収率34%) と白色の固形物としての生成物B (136mg、収率39%) が得られた。A：融点98.5~100.5℃。¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : 1.51 (6H, s, Me)、2.10 (3H, s, Me)、2.99 (2H, s, CH₂)、4.76 (2H, s, CH₂) ; B：融点167~168℃。¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : 1.51 (6H, s, Me)、2.58 (3H, s, Me)、3.06 (2H, s, CH₂)、4.43 (2H, s, CH₂)。

20

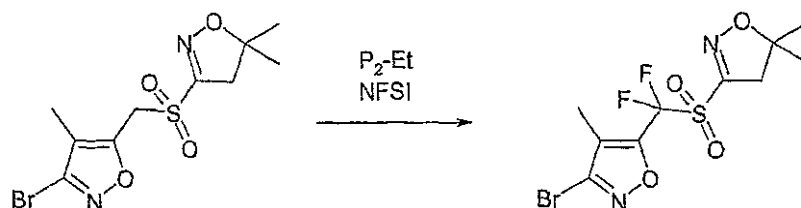
30

【0425】

実施例P22：3-プロモ-5-[(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)-ジフルオロ-メチル]-4-メチルイソオキサゾールの調製

【0426】

【化 8 0】



40

【0427】

1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ (ホスファゼン) (P₂-Et) (0.216ml、0.65ミリモル) を、3-プロモ-5-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニルメチル)-4-メチルイソオキサゾール (106mg、

50

0.31ミリモル)をTHF(3ml)に溶かした溶液に0℃にて一滴ずつ添加した。5分後、N-フルオロベンゼンスルホンイミド(NFSI)(205mg、0.65ミリモル)を添加した。得られた混合物を0℃にて20分間にわたって攪拌した後、放置して室温まで温めた。この混合物を室温にて4時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液(2M)を添加して反応を停止させ、酢酸エチルで2回抽出した。1つにまとめた有機相をブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。残留物をシリカゲル上のクロマトグラフィ(溶離液:酢酸エチル/ヘキサン)で精製すると、生成物(表31の化合物番号5.06)が白色の固形物として得られた(65mg、収率56%)。

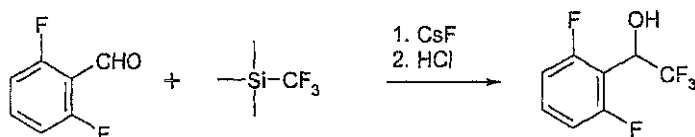
【0428】

実施例I37: 1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-2,2,2-トリフルオロエタノールの調製

10

【0429】

【化81】



20

【0430】

2,6-ジフルオロベンズアルデヒド(2ml、18.2ミリモル)とトリメチル(トリフルオロメチル)シラン(2ml、19.6ミリモル)の混合物を含むTHF(30ml)にフッ化セシウム(32mg、2.1ミリモル)を室温にて添加した。得られた懸濁液を室温にて6時間にわたって攪拌し、室温にて18時間にわたって保管した。濃塩酸(3ml)と水(7ml)の混合物を添加し、得られた溶液を室温にて4時間にわたって攪拌した。この混合物を濃縮すると、生成物が得られた(3.4g、収率87%)。それをさらに精製することなく使用した。

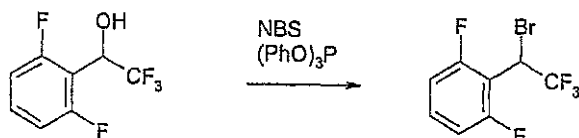
【0431】

実施例I38: 2-(1-ブロモ-2,2,2-トリフルオロエチル)-1,3-ジフルオロベンゼンの調製

【0432】

30

【化82】



【0433】

40

1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-2,2,2-トリフルオロエタノール(500mg、1.8ミリモル)と亜リン酸トリフェニル(0.75ml、2.8ミリモル)をジクロロメタン(5ml)に溶かした溶液にN-ブロモスクシンイミド(NBS)(500mg、2.9ミリモル)を室温にて添加した。得られた混合物を室温にて6時間にわたって攪拌し、室温にて48時間にわたって保管した。この混合物を濾過し、濾液を濃縮し、残留物をシリカゲルに吸収させた。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ(溶離液:酢酸エチル/ヘキサン)で精製すると、生成物が無色の油として得られた(240mg、収率48%)。それをさらに精製することなく使用した。

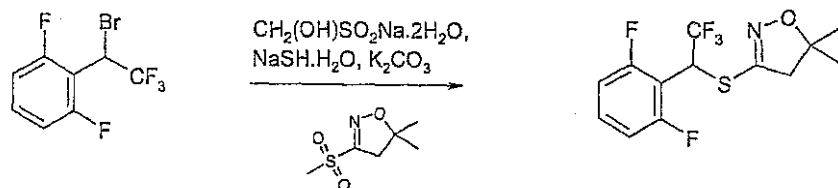
【0434】

実施例I39: 3-[1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-2,2,2-トリフルオロ-エチルスルファニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾールの調製

50

【0435】

【化83】



10

【0436】

3-メタンスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール (87mg、0.49ミリモル) と、ヒドロ硫化ナトリウム水和物 (73mg、0.99ミリモル) と、ヒドロキシメタンスルホン酸ナトリウム二水和物 (151mg、0.99ミリモル) と、炭酸カリウム (136mg、0.99ミリモル) をDMF (10ml) に0℃にて添加し、得られた混合物を0℃にて2時間にわたって攪拌した。2-(1-ブロモ-2,2,2-トリフルオロエチル)-1,3-ジフルオロベンゼン (135mg、0.49ミリモル) を添加し、得られた懸濁液を室温にて5時間にわたって攪拌した。この反応物を水と酢酸エチルに分けた。有機相を水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (55mg、収率35%)。¹H-NMR (400MHz, CDCl₃): 1.41 (3H, s, Me)、1.45 (3H, s, Me)、2.80 (1H, d, CH₂)、2.82 (1H, d, CH₂)、5.98 (1H, m, CH)、6.97 (2H, m, CH)、7.37 (1H, m, CH)。

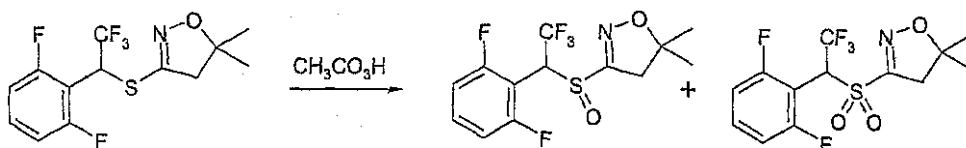
20

【0437】

実施例P23: 3-[1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-2,2,2-トリフルオロ-エタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾールの調製

【0438】

【化84】



30

【0439】

3-[1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-2,2,2-トリフルオロ-エチルスルファニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール (110mg、0.33ミリモル) と、過酢酸 (酢酸中に40重量%) (0.2ml、1.05ミリモル) と、1,2-ジクロロエタン (5ml) と、ジクロロメタン (5ml) の混合物を還流下で2時間にわたって加熱した。追加の過酢酸 (酢酸中に40重量%) (0.2ml、1.05ミリモル) を添加し、得られた混合物を、還流下で2時間にわたって加熱した。この混合物を放置して室温まで冷却し、室温にて18時間にわたって保管した。この混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液の中に注ぎ、ジクロロメタンで抽出した。1つにまとめた有機相を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。残留物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、白色の固形物としてのスルホキシドのジアステレオマー混合物 (表27の化合物番号1.140) (21.1mg、収率17.8%) と白色の固形物としてのスルホン (表27の化合物番号1.113) (66.1mg、収率56%) が得られた。

40

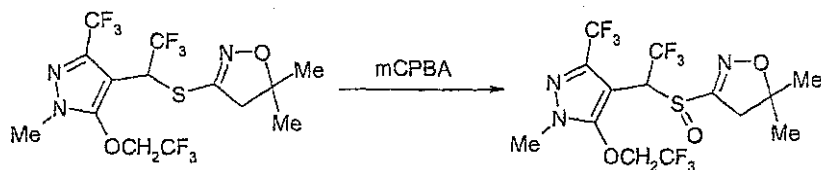
【0440】

50

実施例P24：5,5-ジメチル-3- {2,2,2-トリフルオロ-1-[1-メチル-5-(2,2,2-トリフルオロ-エトキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イル]-エタンスルフィニル} -4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0441】

【化85】



10

【0442】

5,5-ジメチル-3- {2,2,2-トリフルオロ-1-[1-メチル-5-(2,2,2-トリフルオロ-エトキシ)-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾル-4-イル]-エチルスルファニル} -4,5-ジヒドロイソオキサゾール (190mg、0.41ミリモル) をジクロロメタン (5ml) に溶かした溶液に3-クロロペルオキシ安息香酸 (mCPBA) (70重量%) (305mg、1.24ミリモル) を室温にて何回かに分けて添加した。得られた混合物を室温にて18時間にわたって攪拌した。飽和メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液を添加して反応を停止させた後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を添加した。2つの相を分離し、水相をジクロロメタンで抽出した。1つにまとめた有機相を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：ヘキサン/ジクロロメタン) で精製すると、生成物 (表28の化合物番号2.35) が無色のゴムとして得られた (105mg、収率51%)。

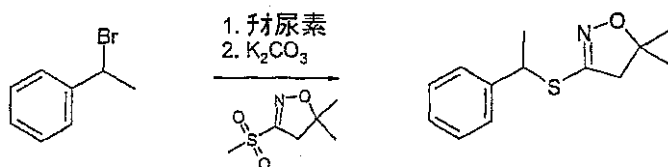
20

【0443】

実施例I40：5,5-ジメチル-3-(1-フェニル-エチルスルファニル)-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0444】

【化86】



30

【0445】

1-メチルベンジルブロミド (0.3ml、2.2ミリモル) をエタノール (10ml) に溶かした溶液にチオ尿素 (180mg、2.4ミリモル) を室温にて添加した。得られた混合物を還流下で5時間にわたって加熱した。3-メタンスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (420mg、2.4ミリモル) と炭酸カリウム (330mg、2.4ミリモル) を添加し、得られた混合物を還流下で3時間にわたって加熱した。この混合物を放置して室温まで温め、水の中に注ぎ、得られた混合物を酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機相を水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (210mg、収率43%)。それをさらに精製することなく使用した。

40

【0446】

50

実施例I41：5,5-ジメチル-3-(1-フェニル-エタンスルホニル)-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0447】

【化87】



10

【0448】

5,5-ジメチル-3- {1-フェニル-エチルスルファニル} -4,5-ジヒドロイソオキサゾール (195mg、0.83ミリモル) をジクロロメタン (15ml) に溶かした溶液に3-クロロペルオキシ安息香酸 (mCPBA) (70重量%) (615mg、2.5ミリモル) を室温にて何回かに分けて添加した。得られた懸濁液を室温にて18時間にわたって攪拌した。飽和メタ重亜硫酸ナトリウム水溶液を添加して反応を停止させた後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を添加した。2つの相を分離し、水相をジクロロメタンで抽出した。1つにまとめた有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：ヘキサン/ジクロロメタン) で精製すると、生成物が得られた (純度85~90%)。それをさらに精製することなく使用した。

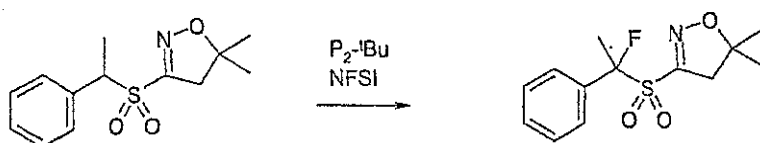
20

【0449】

実施例P25：3-(1-フルオロ-1-フェニル-エタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0450】

【化88】



30

【0451】

ホスファゼン塩基である1-*t*-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-^tBu) (THF中に2M) (0.3ml、0.6ミリモル) を、5,5-ジメチル-3-(1-フェニル-エタンスルホニル)-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (150mg、0.56ミリモル) をTHF (8ml) に溶かした溶液に、室温にて添加した。10分後、*N*-フルオロベンゼンスルホンイミド (NFSI) (190mg、0.6ミリモル) を添加した。得られた混合物を室温にて15分間にわたって攪拌した。この混合物をシリカゲルに吸収させ、シリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.138) が白色の固形物として得られた (89mg、収率56%)。

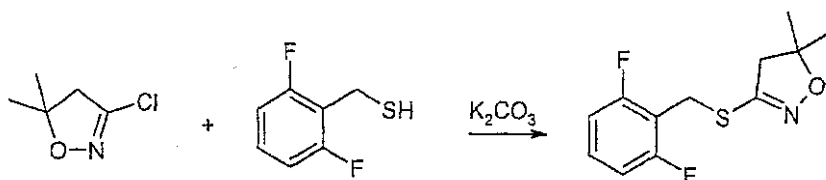
40

【0452】

実施例I42：3-(2,6-ジフルオロ-ベンジルスルファニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0453】

【化 8 9】



10

【0454】

3-クロロ-5,5-ジメチルイソオキサゾリン (0.26g、2ミリモル) を乾燥DMF (7.5ml) に溶かした溶液に2,6-ジフルオロベンジルチオール (0.33g、2ミリモル) と炭酸カリウム (1.84g、13ミリモル) を窒素雰囲気下で添加した。得られた混合物を室温にて5時間にわたって攪拌した後、室温にて1週間にわたって保管した。この混合物を濾過し、濾液を水で希釈した。水相を酢酸エチルで2回抽出した。1つにまとめた有機抽出液を水とブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (0.23g、収率45%)。

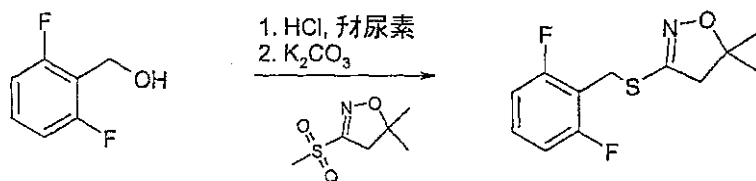
【0455】

20

実施例I43: 3-(2,6-ジフルオロ-ベンジルスルファニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0456】

【化 9 0】



30

【0457】

2,6-ジフルオロベンジルアルコール (0.2ml、1.8ミリモル) と、チオ尿素 (165mg、2.2ミリモル) と、塩酸水溶液 (2M) (2.7ml) と、1,4-ジオキサン (3ml) を混合し、密封した容器の中でその混合物にマイクロ波を照射して10分間にわたって140℃に加熱した。炭酸カリウム (1.1g、8ミリモル) と3-メタンスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (380mg、2.1ミリモル) を添加し、得られた混合物を開放した容器の中で10分間にわたって攪拌した。密封した容器の中でその混合物にマイクロ波を照射して10分間にわたって150℃に加熱した。この混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機抽出液を水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗材料をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (120mg、収率26%)。融点85~87℃。¹H-NMR (400MHz, CDCl₃): 1.43 (6H, s, Me)、2.82 (2H, s, CH₂)、4.36 (2H, s, CH₂)、6.90 (2H, d, CH)、7.26 (1H, t, CH)。

40

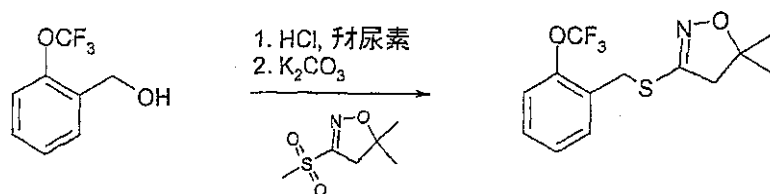
【0458】

実施例I44: 3-(2-トリフルオロメトキシ-ベンジルスルファニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0459】

50

【化 9 1】



10

【0460】

2-(トリフルオロメトキシ)ベンジルアルコール (200mg、1.04ミリモル) と、チオ尿素 (100mg、1.31ミリモル) と、塩酸水溶液 (2M) (1.6ml) と、1,4-ジオキササン (3ml) を混合し、密封した容器の中でその混合物にマイクロ波を照射して10分間にわたって140℃に加熱した。炭酸カリウム (620mg、4.5ミリモル) と3-メタンスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール (220mg、1.24ミリモル) を添加し、得られた混合物を開放した容器の中で10分間にわたって攪拌した。密封した容器の中でその混合物にマイクロ波を照射して10分間にわたって150℃に加熱した。この混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機抽出液を水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗材料をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: 酢酸エチル/ヘキサン) で精製すると、生成物が白色の固形物として得られた (50mg、収率15%)。¹H-NMR (400MHz, CDCl₃): 1.41 (6H, s, Me)、2.78 (2H, s, CH₂)、4.32 (2H, s, CH₂)、7.2~7.4 (2H, m, CH)、7.57 (1H, m, CH)。

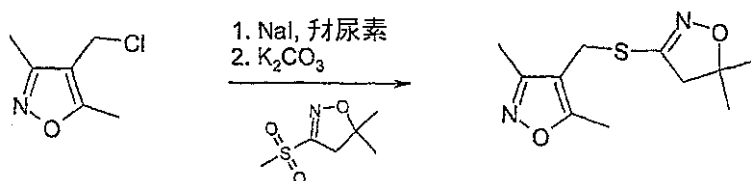
20

【0461】

実施例I45: 4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イルスルファニルメチル)-3,5-ジメチルイソキサゾールの調製

【0462】

【化 9 2】



30

【0463】

4-クロロメチル-3,5-ジメチル-イソキサゾール (3.0g、20.6ミリモル) をエタノール (20ml) に溶かし、それをチオ尿素 (1.725g、22.7ミリモル) とヨウ化ナトリウム (3.087g、20.6ミリモル) に添加した。この混合物を1時間にわたって80℃に加熱した後、冷却し、3-メチルスルホニル-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール (3.676g、20.6ミリモル) と、炭酸カリウム (3.132g、22.7ミリモル) と、エタノール (10ml) と、水 (2ml) を添加し、得られた混合物を再び2時間にわたって80℃に加熱した。この混合物を濾過し、濃縮した。粗生成物を酢酸エチルに溶かし、水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: ヘキサン/酢酸エチル) で精製すると、生成物が得られた (4.667g、収率94%)。¹H-NMR (400MHz, CDCl₃): 1.425 (6H, s, Me)、2.3 (3H, s, Me)、2.4 (3H, s, Me)、2.8 (2H, s, CH₂)、4.0 (2H, s, CH₂)。

40

【0464】

50

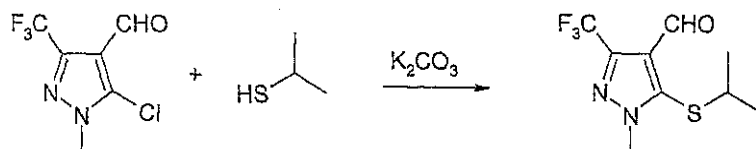
4-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イルスルファニルメチル)-3,5-ジメチル-オキサゾールを実施例I21に記載した方法を利用して酸化した後、実施例P20に記載した方法を利用して塩素化すると、表29の化合物番号3.03と表29の化合物番号3.04が得られた。

【0465】

実施例I46：5-イソプロピルスルファニル-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒドの調製

【0466】

【化93】



【0467】

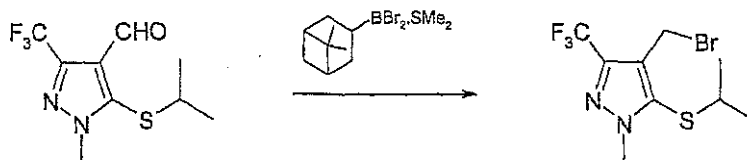
炭酸カリウム (1.68g、12ミリモル) をDMF (50ml) に懸濁させ、イソプロピルチオール (1ml、11ミリモル) を添加した。得られた懸濁液を室温にて15分間にわたって攪拌した後、5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒド (2.12g、10ミリモル) をDMF (5ml) に溶かした溶液を添加した。この反応物を室温にて16時間にわたって攪拌した。この反応物を塩化アンモニウム水溶液とジエチルエーテルに分け、2つの相を分離した。有機相を水とブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が得られた (2.584g、収率100%)。それをさらに精製することなく使用した。¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) : 1.29 (3H, s, Me)、1.31 (3H, s, Me)、3.52 (1H, 七重項, CH)、4.02 (3H, s, Me)、10.03 (1H, s, CH)。

【0468】

実施例I47：4-ブロモメチル-5-イソプロピルスルファニル-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールの調製

【0469】

【化94】



【0470】

5-イソプロピルスルファニル-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒド (2.5g、10ミリモル) をジクロロメタン (10ml) とヘキサン (10ml) に溶かし、ジクロロメタン (5ml) に (J. Org. Chem., 1980年、第45巻、384~389ページに従って調製した) イソピノカンフェニル-ホウ素ジプロミドジメチルスルフィド錯体を溶かした溶液をゆっくりと添加した。得られた反応物を室温にて2時間にわたって攪拌した後、室温にて18時間にわたって保管した。この反応物を還流下で2時間にわたって加熱した後、濃縮した。残留物を水とジクロロメタンに分け、2つの相を分離した。有機相を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカの表面に吸収させ、クロマトグラフィーによって精製すると、生成物が流動性のある油として得られた (2.5g、収率79%)。¹H

-NMR (400MHz, CDCl_3) : 1.29 (3H, s, Me)、1.31 (3H, s, Me)、3.42 (1H, 七重項, CH)、4.00 (3H, s, Me)、4.54 (2H, s, CH)。

【0471】

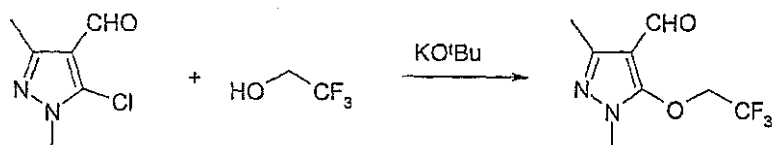
4-プロモメチル-5-イソプロピルスルファニル-1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールを実施例I4に記載した方法を利用して誘導体化し、実施例I26に記載した方法を利用して酸化した後、実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化すると、表28の化合物番号2.36が得られた。

【0472】

実施例I48：1,3-ジメチル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒドの調製

【0473】

【化95】



【0474】

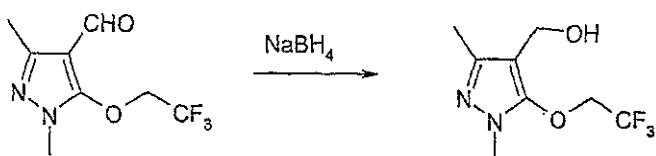
2,2,2-トリフルオロエタノール (7.11ml、97.6ミリモル) を 0°C にてカリウムt-ブトキシド (THF中に1M) (97.6ml、97.6ミリモル) に一滴ずつ添加した。この溶液に、5-クロロ1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒド (10.3g、65.1ミリモル) をTHF (28ml) に溶かした溶液を 0°C にてゆっくりと添加した。得られた溶液を放置して室温まで温めた後、室温にて3時間にわたって攪拌した。この混合物をジクロロメタンで希釈し、水とブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が黄色い油として得られた (15.82g、収率109%)。それをさらに精製することなく使用した。 ^1H -NMR (400MHz, CDCl_3) : 2.42 (s, 3H, Me)、3.65 (s, 3H, Me)、4.93 (q, 2H, CH_2)、9.72 (s, 1H, CH)。

【0475】

実施例I49：[1,3-ジメチル-5-(2,2,2-トリフルオロ-エトキシ)-1H-ピラゾール-4-イル]-メタノールの調製

【0476】

【化96】



【0477】

1,3-ジメチル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-1H-ピラゾール-4-カルバルデヒド (14.45g、65ミリモル) をメタノール (130ml) に溶かした。ホウ水素化ナトリウム (1.23g、32.5ミリモル) を 0°C にて数回に分けて添加した。得られた混合物を放置して室温まで温めた後、室温にて2時間にわたって攪拌した。この混合物を濃縮し、残留物をジクロロメタンに溶かした。得られた溶液を水とブラインで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮すると、生成物が白色の固形物として得られた (14.6g、収率100%)。それをさら

に精製することなく使用した。 $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3) : 2.20 (s, 3H, Me)、3.64 (s, 3H, Me)、4.49 (s, 2H, CH_2)、4.64 (q, 2H, CH_2)。

【0478】

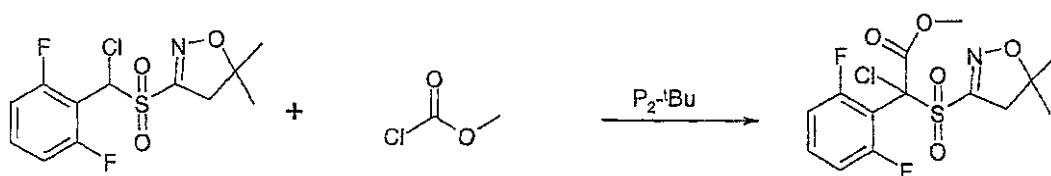
[1,3-ジメチル-5-(2,2,2-トリフルオロ-エトキシ)-1H-ピラゾル-4-イル]-メタノールを実施例I25に記載した方法を利用して誘導体化し、実施例I21に記載した方法を利用して酸化した後、実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化すると、表28の化合物番号2.24が得られ、実施例P20に記載した方法を利用して塩素化すると表28の化合物番号2.31が得られた。

【0479】

実施例P26：クロロ-(2,6-ジフルオロフェニル)-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール-3-スルホニル)-酢酸メチルエステルの調製

【0480】

【化97】



20

【0481】

窒素雰囲気下で3-[クロロ-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (200mg、0.62ミリモル) を乾燥THF (5ml) に溶かした。得られた溶液を0℃に冷却した後、0℃にて1-*t*-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) ($\text{P}_2\text{-}^t\text{Bu}$) (THF中に2M) (0.37ml、0.74ミリモル) を添加し、次いでクロロギ酸メチル (0.06ml、0.74ミリモル) を添加した。得られた混合物を放置して室温まで温め、室温にて2時間にわたって撹拌した。塩酸水溶液 (2M) を添加して反応を停止させ、この混合物を酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液：ヘキサン/酢酸エチル) で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.14) が得られた。

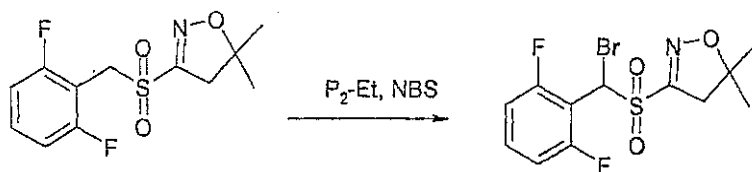
30

【0482】

実施例P27：3-[ブromo-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0483】

【化98】



40

【0484】

窒素雰囲気下で3-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (75mg、0.26ミリモル) を乾燥THF (5ml) に溶かした。得られた溶液を0℃に冷却した後、0℃にて1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラ

50

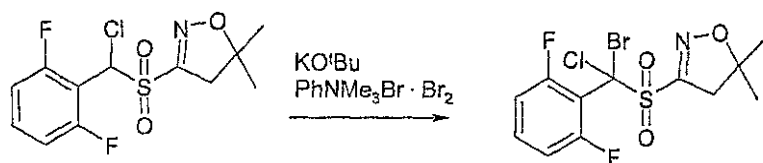
ムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-Et) (0.1ml、0.3ミリモル) を添加し、次いでN-ブロモスクシンイミド (NBS) (0.05g、0.286ミリモル) を添加した。得られた混合物を放置して室温まで温め、室温にて2時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液 (2M) を添加して反応を停止させ、この混合物を酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: ヘキサン/酢酸エチル) で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.19) が得られた (30mg、収率31%)。

【0485】

実施例P28: 3-[プロモ-クロロ-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0486】

【化99】



【0487】

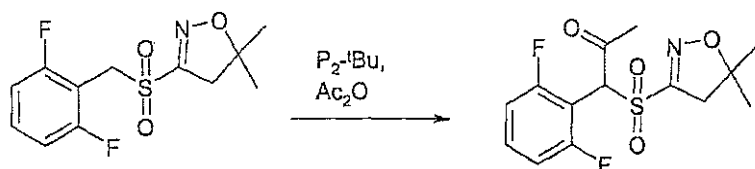
窒素雰囲気下で3-[クロロ-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (6.387g、19.7ミリモル) を乾燥THF (200ml) に溶かし、得られた溶液を-78℃に冷却した。カリウムt-ブトキシド (THF中に1.0M) (20.7ml、20.7ミリモル) を添加するとオレンジ色の溶液が形成された。フェニルトリメチルアミノトリプロミド (PTT) (7.785g、20.7ミリモル) を添加するとより淡いネバネバした沈殿物が形成された。この混合物を放置して室温まで温めた。この混合物を砂で濾過した後、酢酸エチルで洗浄し、1つにまとめた有機分画を濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: ヘキサン/酢酸エチル) で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.53) が淡い黄色の固形物として得られた (7.225g、収率91%)。

【0488】

実施例P29: 1-(2,6-ジフルオロフェニル)-1-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)-プロパン-2-オンの調製

【0489】

【化100】



【0490】

窒素雰囲気下で3-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-イソオキサゾール (200mg、0.69ミリモル) を乾燥THF (5ml) に溶かした。得られた溶液を0℃に冷却した後、0℃にて1-t-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-tBu) (THF中に2M) (0.41ml、0.83ミリモル) を添加し、次いで無水酢酸 (0.08ml、0.83ミリモル) を添加した。得られた混合物を放置して室温まで温め、室温にて2時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液 (2M

10

20

30

40

50

）を添加して反応を停止させ、この混合物を酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ（溶離液：ヘキサン／酢酸エチル）で精製すると、生成物（表27の化合物番号1.27）が白色の固形物として得られた（57mg、収率25％）。

【0491】

試薬として塩化シクロプロパンカルボニル、塩化ジフルオロアセチル、塩化メトキシアセチル、塩化クロロアセチルを用いて同じ方法を実施すると、それぞれ、表27の化合物番号1.54、表27の化合物番号1.57、表27の化合物番号1.59、表27の化合物番号1.60が得られた。

【0492】

実施例P30：酢酸1-[クロロ-2,6-ジフルオロ-フェニル-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)-メチル]-ビニルエステルの調製

【0493】

【化101】



【0494】

窒素雰囲気下で3-[クロロ-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール（250mg、0.77ミリモル）を乾燥THF（10ml）に溶かし、得られた溶液を-78℃に冷却した。カリウムt-ブトキシド（THF中に1.0M）（0.85ml、0.85ミリモル）を添加すると黄色の溶液が形成され、次いで塩化アセチル（0.06ml、0.85ミリモル）を添加すると色が消えた。この混合物を放置して室温まで温めた。塩酸水溶液（2M）を添加して反応を停止させ、酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ（溶離液：ヘキサン／酢酸エチル）で精製すると、生成物（表27の化合物番号1.58）が白色の固形物として得られた（72mg、収率23％）。

【0495】

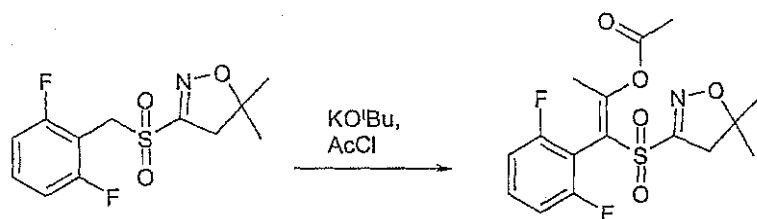
出発物質として3-[フルオロ-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールを用いて同じ方法を実施すると、表27の化合物番号1.62が得られた。

【0496】

実施例P31：酢酸2-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-2-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)-1-メチル-ビニルエステルの調製

【0497】

【化 1 0 2】



10

【0 4 9 8】

窒素雰囲気下で3-(2,6-ジフルオロフェニル-メタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール (250mg、0.865ミリモル) を乾燥THF (10ml) に溶かし、得られた溶液を-78℃に冷却した。カリウムt-ブトキシド (THF中に1.0M) (0.95ml、0.95ミリモル) を添加すると黄色の溶液が形成され、次いで塩化アセチル (0.7ml、0.95ミリモル) を添加すると色が消えた。この混合物を放置して室温まで温めた。塩酸水溶液 (2M) を添加して反応を停止させ、酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: ヘキサン/酢酸エチル) で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.98) が白色の固形物として得られた (110mg、収率34%)。

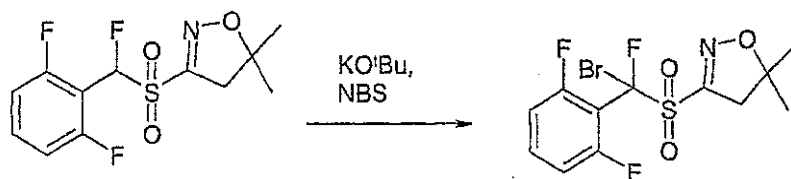
20

【0 4 9 9】

実施例P32: 3-[ブromo-(2,6-ジフルオロフェニル)-フルオロ-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾールの調製

【0 5 0 0】

【化 1 0 3】



30

【0 5 0 1】

窒素雰囲気下で3-[フルオロ-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル]-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール (200mg、0.65ミリモル) を乾燥THF (10ml) に溶かし、得られた溶液を-78℃に冷却した。カリウムt-ブトキシド (THF中に1.0M) (0.71ml、0.71ミリモル) を添加すると黄色の溶液が形成され、次いでN-ブロモスクシンイミド (NBS) (127mg、0.71ミリモル) を添加すると色が茶色になった。この混合物を放置して室温まで温めた。塩酸水溶液 (2M) を添加して反応を停止させ、酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: ヘキサン/酢酸エチル) で精製し、次いでHPLC (溶離液: ヘキサン/酢酸エチル) で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.63) が淡い黄色の固形物として得られた (154mg、収率62%)。

40

【0 5 0 2】

試薬としてN-ヨードスクシンイミドを用いて同じ方法を実施すると、表27の化合物番号1.61が得られた。

【0 5 0 3】

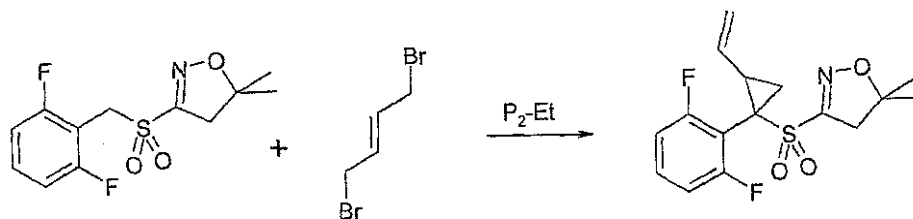
実施例P33: 3-[1-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-ビニルシクロプロパン-スルホニル]-5,5

50

-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾールの調製

【0504】

【化104】



10

【0505】

窒素雰囲気下で1-エチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-Et) (0.52ml、1.56ミリモル)を、3-(2,6-ジフルオロフェニル)メタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (200mg、0.7ミリモル)をTHF (5ml)に溶かした溶液に0℃にて添加した。10分後、1,4-ジブromo-2-ブテン (166mg、0.78ミリモル)を添加し、得られた混合物を室温にて1時間にわたって攪拌した。この混合物を塩酸水溶液 (2M)に注ぎ、酢酸エチルで数回抽出した。1つにまとめた有機相を水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: ヘキサン/酢酸エチル)で精製すると、生成物 (表27の化合物番号1.46)が白色の固形物として得られた (145mg、収率61%)。

20

【0506】

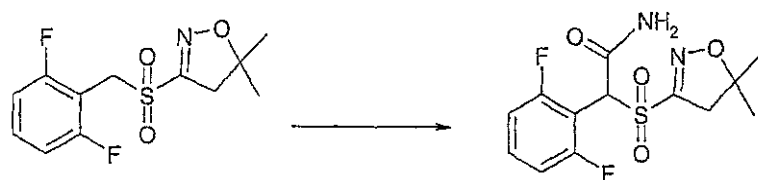
試薬として1,4-ジブromo-2-メチル-2-ブテンを用いて同じ方法を実施すると、表27の化合物番号1.47が得られた。

【0507】

実施例P34: 2-(2,6-ジフルオロフェニル)-2-(5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-スルホニル)-アセトアミドの調製

【0508】

【化105】



30

【0509】

窒素雰囲気下で3-(2,6-ジフルオロフェニル)-メタンスルホニル)-5,5-ジメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール (200mg、0.69ミリモル)を乾燥THF (5ml)に溶かした。この溶液を0℃に冷却した後、0℃にてホスファゼン塩基である1-t-ブチル-2,2,4,4,4-ペンタキス(ジメチルアミノ)-2-ラムダ⁵-5,4-ラムダ⁵-5-カテナジ(ホスファゼン) (P₂-^tBu) (THF中に2M) (0.41ml、0.83ミリモル)を添加し、次いでイソシアン酸トリメチルシリル (0.11ml、0.83ミリモル)を添加した。得られた混合物を放置して室温まで温め、室温にて2時間にわたって攪拌した。塩酸水溶液 (2M)を添加して反応を停止させ、この混合物を酢酸エチルで抽出した。1つにまとめた有機抽出液を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のクロマトグラフィ (溶離液: ヘキサン/酢酸エチル)で

40

50

精製すると、生成物（表27の化合物番号1.23）が淡い黄色の固形物として得られた（64mg、収率28%）。

【0510】

試薬として4-フルオロフェニルイソシアネートを用いて同じ方法を実施すると、表27の化合物番号1.22が得られた。

【0511】

以下の化合物、すなわち8-クロロメチル-6-フルオロ-4H-ベンゾ-1,3-ジオキシン、3-クロロメチル-5-メチル-イソオキサゾール、（J. Heterocycl. Chem.、1972年、第9巻(1)、119～122ページに従って調製される）5-クロロ-2-ニトロベンジルブロミド、2,3-ジフルオロベンジルブロミド、2,4-ジフルオロベンジルブロミド、2,5-ジフルオロベンジルブロミド、3,5-ジフルオロベンジルブロミド、（J. Med. Chem.、1983年、第26巻(9)、1282～1293ページに従って調製される）2-フルオロ-4-(エトキシカルボニル)ベンジルブロミド、（J. Med. Chem.、1990年、第33巻(9)、2437～2451ページに従って調製される）2-フルオロ-4-(メトキシ-カルボニル)ベンジルブロミド、2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド、2-フェニルベンジルブロミド、2-(トリフルオロメチルチオ)ベンジルブロミドは、市販されているか、公知の文献の方法で調製することができ、例えば実施例I4または実施例I45に記載した方法を利用して誘導体化し、例えば実施例I21または実施例I26に記載した方法を利用して酸化した後、例えば実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化した。

10

【0512】

以下の化合物、すなわち2,2-ジフルオロ-ベンゾ-1,3-ジオキソール-4-カルバルデヒドと、（J. Am. Chem. Soc.、1957年、第79巻、741ページに従って調製される）2-(メチルスルホニルオキシ)ベンズアルデヒドは、市販されているか、公知の文献の方法で調製することができ、例えば実施例I2に記載した方法を利用して還元し、実施例I3に記載した方法を利用して臭素化し、例えば実施例I4に記載した方法を利用して誘導体化し、例えば実施例I21に記載した方法を利用して酸化した後、例えば実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化した。

20

【0513】

以下の化合物、すなわち（ヨーロッパ特許第434620号に従って調製される）4-エチル-2-メトキシメチル-チアゾール-5-カルボン酸は、市販されているか、公知の文献の方法で調製することができ、例えば実施例I24に記載した方法を利用して還元し、実施例I28に記載した方法を利用して誘導体化し、例えば実施例I26に記載した方法を利用して酸化した後、例えば実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化した。

30

【0514】

以下の化合物、すなわち1-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸は、市販されているか、公知の文献の方法で調製することができ、例えば実施例I24に記載した方法を利用して還元し、実施例I25に記載した方法を利用して誘導体化し、例えば実施例I26に記載した方法を利用して酸化した後、例えば実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化した。

【0515】

以下の化合物、すなわち（WO 00/015615とWO 01/094339に従って調製される）2-クロロ-ニコチン酸エチルエステルと2-メチル-6-トリフルオロメチルニコチン酸エチルエステルは、市販されているか、公知の文献の方法で調製することができ、例えば実施例I24に記載した方法を利用して還元し、実施例I25に記載した方法を利用して誘導体化し、例えば実施例I26に記載した方法を利用して酸化した後、例えば実施例P21に記載した方法を利用してフッ素化した。

40

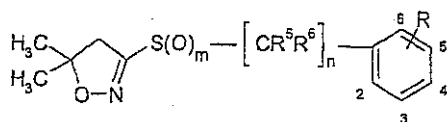
【0516】

以下の表に記載する化合物は、同様の方法で調製することができる。

【0517】

【表 3 4】

表27：式1. 3の化合物



No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.01	2	-CH ₂ CH ₂ -		1	2,6-F		1.4-1.45 (2H, m, CH ₂), 1.5 (6H, s, Me), 2.08-2.1 (2H, m, CH ₂), 3.0 (2H, s, CH ₂), 6.9-7.0 (2H, m, CH), 7.32-7.4 (1H, m, CH).
1.02	2	H	-CH ₂ C≡CH	1	2,6-F	105-107	1.44 (3H, s, Me), 1.48 (3H, s, Me), 1.97 (1H, dd, CH), 2.87 (1H, d, CH ₂), 3.03 (1H, d, CH ₂), 3.28-3.47 (2H, m, CH ₂), 5.17 (1H, dd, CH), 6.98 (2H, m, CH), 7.52 (1H, m, CH).
1.03	2	H	-C ₂ H ₄ OC(=O)H ₃	1	2,6-F		1.44 (3H, s, Me), 1.48 (3H, s, Me), 2.62 (1H, m, CH ₂), 2.74 (1H, m, CH ₂), 2.84 (1H, d, CH ₂), 3.03 (1H, d, CH ₂), 3.21-3.28 (4H, m, CH ₂ + Me), 3.58 (1H, m, CH ₂), 5.17 (1H, dd, CH), 6.98 (2H, m, CH), 7.49 (1H, m, CH).
1.04	2	H	-CH ₂ CH=CF ₂	1	2,6-F	83	1.43 (3H, s, Me), 1.49 (3H, s, Me), 2.85 (1H, d, CH ₂), 3.30 (1H, d, CH ₂), 3.25 (2H, m, CH ₂), 4.11 (1H, m, CH), 4.99 (1H, dd, CH), 6.98 (2H, m, CH), 7.40 (1H, m, CH). ¹⁹ F-NMR (400 MHz, CDCl ₃): -87 (1F, m), -84 (2F, m).
1.05	2	H	-CH ₂ -4F-C ₆ H ₄	1	2,6-F	95	1.42 (3H, s, Me), 1.49 (3H, s, Me), 2.84 (1H, d, CH ₂), 3.03 (1H, d, CH ₂), 3.71 (2H, m, CH ₂), 5.28 (1H, dd, CH), 6.89 (4H, m, CH), 7.11 (2H, m, CH), 7.31 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 3 5】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.06	2	H	F	1	2,6-F	112	1.56 (3H, s, Me), 1.57 (3H, s, Me), 3.35 (1H, d, CH ₂), 3.45 (1H, d, CH ₂), 6.68 (0.5H, s, CHF), 6.80 (0.5H, s, CHF), 7.03 (2H, m, CH), 7.51 (1H, m, CH). ¹⁹ F-NMR (400 MHz, CDCl ₃): -182 (1F, m), -109 (2F, m).
1.07	2	H	Cl	1	2,6-F	128	1.54 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.35 (1H, d, CH ₂), 3.45 (1H, d, CH ₂), 6.4 (1H, s, CH), 7.0 (2H, m, CH), 7.5 (1H, m, CH).
1.08	2	H	-C ₂ H ₄ (CO)OC C ₂ H ₅	1	2,6-F		1.23 (3H, t, Me), 1.45 (3H, s, Me), 1.49 (3H, s, Me), 2.32 (1H, m, CH ₂), 2.49 (1H, m, CH ₂), 2.73 (2H, m, CH ₂), 2.89 (1H, d, CH ₂), 3.06 (1H, d, CH ₂), 4.11 (2H, q, OCH ₂), 5.13 (1H, dd, CH), 6.98 (2H, m, CH), 7.39 (1H, m, CH).
1.09	2	H	-C ₂ H ₄ CO C ₂ H ₅	1	2,6-F		1.02 (3H, t, Me), 1.46 (3H, s, Me), 1.48 (3H, s, Me), 2.30-2.55 (3H, m, CH ₂), 2.62 (2H, m, CH ₂), 2.72 (1H, m, CH ₂), 2.90 (1H, d, CH ₂), 3.07 (1H, d, CH ₂), 5.15 (1H, dd, CH), 6.98 (2H, m, CH), 7.38 (1H, m, CH).
1.10	2	H	-C ₂ H ₄ - P(O)(O C ₂ H ₅) ₂	1	2,6-F		1.31 (6H, m, Me), 1.44 (3H, s, Me), 1.49 (3H, s, Me), 1.78 (2H, m, CH ₂), 2.73 (2H, m, CH ₂), 2.87 (1H, d, CH ₂), 3.03 (1H, d, CH ₂), 4.09 (4H, m, OCH ₂), 5.11 (1H, dd, CH), 6.99 (2H, m, CH), 7.40 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 3 6】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.11	2	H	-C ₂ H ₄ CON(C H ₃) ₂	1	2,6-F		1.46 (3H, s, Me), 1.48 (3H, s, Me), 2.37 (1H, m, CH ₂), 2.56-2.87 (3H, m, CH ₂), 2.91 (6H, s, Me), 2.93 (1H, d, CH ₂), 3.06 (1H, d, CH ₂), 5.19 (1H, dd, CH), 6.97 (2H, m, CH), 7.37 (1H, m, CH).
1.12	2	H	-C ₂ H ₄ SO ₂ CH ₃	1	2,6-F	146	1.46 (3H, s, Me), 1.50 (3H, s, Me), 2.85-3.20 (6H, m, CH ₂), 2.96 (3H, s, Me), 5.12 (1H, dd, CH), 7.02 (2H, m, CH), 7.43 (1H, m, CH).
1.13	2	=CH-N(CH ₃) ₂		1	2,6-F		1.45 (6H, s, Me), 2.5-3.2 (6H, bs, Me), 3.0 (2H, s, CH ₂), 6.9 (2H, m, CH), 7.35 (1H, m, CH), 7.6 (1H, s, CH).
1.14	2	-(CO) OCH ₃	-Cl	1	2,6-F		1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.6 (3H, m, Me), 3.15-3.25 (2H, q, CH ₂), 7.0 (2H, m, CH), 7.45 (1H, m, CH).
1.15	2	-CH ₃	Cl	1	2,6-F	109	1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.6 (3H, m, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 7.0 (2H, m, CH), 7.43 (1H, m, CH).
1.16	2	-C ₂ H ₅	Cl	1	2,6-F	107	1.2 (3H, t, Me), 1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 1.4-1.5 (1H, m, CH ₂), 3.2 (2H, s, CH ₂), 3.33-3.4 (1H, m, CH ₂), 7.0 (2H, m, CH), 7.43 (1H, m, CH).
1.17	2	-CH ₂ C H=CF 2	Cl	1	2,6-F	113	1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.2-3.25 (3H, m, CH ₂ + CH), 4.0 (1H, dd, CH ₂), 4.2-4.3 (1H, dt, CH ₂), 7.0 (2H, m, CH), 7.48 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 3 7】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.18	2	-CH ₂ - 4F- C ₆ H ₄	Cl	1	2,6-F	121	1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.3 (1H, d, CH ₂), 3.8 (1H, m, CH ₂), 4.7 (1H, m, CH ₂), 6.9-7.0 (4H, m, CH), 7.3 (2H, m, CH), 7.4 (1H, m, CH).
1.19	2	H	Br	1	2,6-F	135	1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 6.48 (1H, s, CH), 7.0 (2H, m, CH), 7.48 (1H, m, CH).
1.20	2	F	F	1	2,6-F	124	1.57 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 7.06 (2H, m, CH), 7.58 (1H, m, CH). ¹⁹ F-NMR (400 MHz, CDCl ₃): -107 (2F, m), -96 (2F, m).
1.21	2	F	Cl	1	2,6-F	129	1.53 (3H, s, Me), 1.57 (3H, s, Me), 3.19 (2H, m, CH ₂), 7.03 (2H, m, CH), 7.53 (1H, m, CH). ¹⁹ F-NMR (400 MHz, CDCl ₃): -105 (1F, m), -103 (2F, m).
1.22	2	H	- CONH- 4F-C ₆ H ₄	1	2,6-F		1.49 (3H, s, Me), 1.51 (3H, s, Me), 3.0 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 5.88 (1H, s, CH), 7.03 (4H, m, CH), 7.45 (3H, m, CH), 8.6 (1H, s, NH).
1.23	2	H	- CONH ₂	1	2,6-F	175	1.49 (3H, s, Me), 1.51 (3H, s, Me), 2.95 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 5.75 (1H, s, CH), 5.9 (1H, bs, NH ₂), 6.83 (1H, bs, NH ₂), 7.05 (2H, m, CH), 7.5 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 3 8】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.24	1	H	Cl	1	2,6-F		ジ アステロアイソマ- A: 1.55 (6H, s, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.3 (1H, d, CH ₂), 5.9 (1H, s, CH), 7.0-7.05 (2H, m, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH). ジ アステロアイソマ- B: 1.3 (3H, s, Me), 1.45 (3H, s, Me), 2.9 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 6.03 (1H, s, CH), 7.0-7.05 (2H, m, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH).
1.25	2	H	I	1	2,6-F	156	1.43 (3H, s, Me), 1.5 (3H, s, Me), 2.9 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 6.7 (1H, s, CH), 7.0 (2H, m, CH), 7.43 (1H, m, CH).
1.26	2	Cl	Cl	1	2,6-F	126	1.56 (6H, s, Me), 3.30 (2H, s, CH ₂), 7.03 (2H, m, CH), 7.51 (1H, m, CH).
1.27	2	H	-COCH ₃	1	2,6-F	116	1.52 (3H, s, Me), 1.54 (3H, s, Me), 2.28 (3H, s, Me), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.4 (1H, d, CH ₂), 5.85 (1H, s, CH), 7.1 (2H, m, CH), 7.5 (1H, t, CH).
1.28	2	H	-CH ₂ - 4F-C ₆ H ₄	1	3- CH ₃	111	1.20 (3H, s, Me), 1.35 (3H, s, Me), 2.10 (1H, d, CH ₂), 2.32 (3H, s, Me), 2.80 (1H, d, CH ₂), 3.38 (1H, dd, CH ₂), 3.75 (1H, dd, CH ₂), 4.55 (1H, dd, CH), 6.85 (2H, m, CH), 6.95 (2H, m, CH), 7.15 (3H, m, CH), 7.25 (1H, m, CH).
1.29	2	H	-CH ₂ - CH=CF 2	1	3- CH ₃	94	1.22 (3H, s, Me), 1.37 (3H, s, Me), 2.15 (1H, d, CH ₂), 2.40 (3H, s, Me), 2.75 (1H, d, CH ₂), 2.90 (1H, m, CH ₂), 3.15 (1H, m, CH ₂), 4.10 (1H, m, CH), 4.40 (1H, dd, CH), 7.15-7.35 (4H, m, CH).

10

20

30

40

【表 3 9】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.30	2	H	Cl	1	3- CH ₃	102	1.42 (3H, s, Me), 1.50 (3H, s, Me), 2.40 (3H, s, Me), 2.80 (1H, d, CH ₂), 3.05 (1H, d, CH ₂), 5.95 (1H, s, CH), 7.30-7.45 (4H, m, CH).
1.31	2	Cl	Cl	1	3- CH ₃	89	1.50 (6H, s, Me), 2.45 (3H, s, Me), 2.95 (2H, s, CH ₂), 7.30-7.40 (2H, m, CH), 7.70-7.75 (2H, m, CH).
1.32	2	H	Cl	1	2- F,6- Cl	128	1.54 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 6.8 (1H, s, CH), 7.13 (1H, m, CH), 7.33 (1H, d, CH), 7.4 (1H, m, CH).
1.33	1	H	Cl ジ アステロ アイソマ A	1	2- F,6- Cl	100	1.58 (6H, s, Me), 3.05 (1H, d, CH ₂), 3.3 (1H, d, CH ₂), 6.2 (1H, s, CH), 7.13 (1H, m, CH), 7.3 (1H, d, CH), 7.4 (1H, m, CH).
1.34	1	H	Cl ジ アステロ アイソマ B	1	2- F,6- Cl	100	1.23 (3H, s, Me), 1.425 (3H, s, Me), 2.9 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 6.23 (1H, s, CH), 7.1 (1H, m, CH), 7.3 (1H, m, CH), 7.4 (1H, m, CH).
1.35	2	H	- CONH ^c Pr	1	2,6-F	150	0.6 (2H, m, CH ₂), 0.8 (2H, m, CH ₂), 1.5 (6H, s, Me), 2.75-2.8 (1H, m, CH), 3.0 & 3.2 (2H, q, CH ₂), 5.7 (1H, s, CH), 6.8 (1H, bs, NH), 7.0 (2H, t, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH).
1.36	2	H	- CON(C ₂ H ₅) ₂	1	2,6-F	144	0.8 (3H, t, Me), 1.1 (3H, t, Me), 1.5 (6H, s, Me), 3.0-3.05 (2H, m, CH ₂), 3.3 (1H, m, CH ₂), 3.4-3.45 (3H, m, CH ₂), 5.9 (1H, s, CH), 7.0-7.05 (2H, t, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 4 0】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.37	2	-CH ₃	Br	1	2,6-F		1.5 (6H, s, Me), 2.825 (3H, m, Me), 3.0 & 3.225 (2H, bq, CH ₂), 7.0 (2H, m, CH), 7.45 (1H, m, CH).
1.38	2	H	-CH(OH)CH ₂ C H ₂ CH ₃	1	2,6-F		0.85 (3H, t, Me), 1.25-1.45 (4H, m, CH ₂), 1.48 (3H, s, Me), 1.52 (3H, s, Me), 3.03 (1H, d, CH ₂), 3.07 (1H, d, CH ₂), 3.24 (1H, bs, OH), 4.92 (1H, bm, CH), 5.05 (1H, d, CH), 7.0 (2H, m, CH) 7.4 (1H, m, CH).
1.39	2	H	- SO ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	1	2,6-F		1.50 (3H, s, Me), 1.54 (3H, s, Me), 3.23 (1H, d, CH ₂), 3.26 (1H, d, CH ₂), 4.5 (1H, d, CH ₂), 5.0 (1H, d, CH ₂), 6.2 (1H, m, CH), 6.98 (1H, m, CH), 7.05 (1H, m, CH), 7.46 (6H, m, CH).
1.40	2	H	- SO ₂ CH ₃	1	2,6-F		1.58 (3H, s, Me), 1.62 (3H, s, Me), 3.22 (1H, d, CH ₂), 3.26 (1H, d, CH ₂), 3.28 (3H, s, Me), 6.38 (1H, s, CH), 7.1 (2H, m, CH), 7.55 (1H, m, CH).
1.41	2	H	-CH(OH)CH ₂ C H ₃	1	2,6-F		0.95 (3H, t, Me), 1.35 (2H, m, CH ₂), 1.46 (3H, s, Me), 1.48 (3H, s, Me), 3.03 (1H, d, CH ₂), 3.06 (1H, d, CH ₂), 3.22 (1H, bs, OH), 4.88 (1H, bm, CH), 5.05 (1H, d, CH), 7.0 (2H, m, CH), 7.4 (1H, m, CH).
1.42	2	H	-CH(OS O ₂ CH ₃)CH 2CH ₂ CH 3	1	2,6-F		0.85 (3H, t, Me), 1.25 (1H, m, CH ₂), 1.45 (1H, m, CH ₂), 1.49 (3H, s, Me), 1.51 (3H, s, Me), 1.6 (1H, m, CH ₂), 2.05 (1H, m, CH ₂), 2.98 (1H, d, CH ₂), 3.01 (1H, d, CH ₂), 3.2 (3H, s, Me), 5.4 (1H, d, CH), 5.8 (1H, m, CH), 7.05 (2H, t, CH), 7.48 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 4 1】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.43	2	$\text{=CHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$		1	2,6-F		0.92 (3H, t, Me), 1.5 (6H, s, Me), 1.55 (2H, q, CH ₂), 2.1 (2H, q, CH ₂), 3.0 (2H, s, CH ₂), 7.0 (2H, t, CH), 7.4 (1H, m, CH), 7.42 (1H, m, CH).
1.44	2	F	- (CO)OC H ₂ CH ₃	1	2- NO ₂ , 5-Cl		1.3 (3H, t, Me), 1.53 (3H, s, Me), 1.57 (3H, s, Me), 3.17 (1H, d, CH ₂), 3.28 (1H, d, CH ₂), 4.32-4.42 (2H, m, CH ₂), 7.65 (1H, dd, CH), 7.98 (1H, d, CH), 8.2 (1H, d, CH).
1.45	2	$\text{-CCl}_2\text{CH}_2\text{-}$		1	2,6-F		1.45 (3H, s, Me), 1.50 (3H, s, Me), 2.45 (1H, d, CH ₂), 2.95 (1H, d, CH ₂), 3.05 (1H, d, CH ₂), 3.18 (1H, d, CH ₂), 6.95-7.05 (2H, m, CH), 7.45-7.5 (1H, m, CH).
1.46	2	$\text{-CH}_2\text{CH}(\text{CH=CH}_2\text{)-}$		1	2,6-F	117	1.50 (6H, s, Me), 1.55 (1H, m, CH ₂), 2.30 (1H, dd, CH), 2.90 (1H, d, CH ₂), 3.05 (1H, d, CH ₂), 3.05 (1H, m, CH ₂), 5.1 (1H, dd, CH ₂), 5.3-5.35 (2H, m, CH ₂), 6.90-7.00 (2H, m, CH), 7.35-7.45 (1H, m, CH).
1.47	2	$\text{-CH}_2\text{CH}\{\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2\}\text{-}$		1	2,6-F	99	1.48 (3H, s, Me), 1.50 (3H, s, Me), 1.75 (1H, m, CH ₂), 1.8 (3H, s, Me), 2.25 (1H, dd, CH), 2.90 (1H, m, CH ₂), 2.90 (1H, d, CH ₂), 3.05 (1H, d, CH ₂), 4.25 (1H, s, CH ₂), 4.75 (1H, s, CH ₂), 6.90-7.00 (2H, m, CH), 7.30-7.40 (1H, m, CH).
1.48	2	$\text{-CH(NO}_2\text{)CH}_2\text{-}$		1	2,6-F		1.45 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.30 (1H, dd, CH ₂), 3.0 (1H, d, CH ₂), 3.18 (1H, d, CH ₂), 3.3 (1H, dd, CH ₂), 4.65 (1H, dd, CH(NO ₂)), 7.0 (2H, m, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 4 2】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.49	2	$\begin{array}{c} - \\ \text{CCl}\{(\text{CO})\text{OCH}_3\} \\ \text{CH}_2- \end{array}$		1	2,6-F		1.45 (3H, s, Me), 1.50 (3H, s, Me), 2.8 (1H, d, CH ₂), 2.95 (1H, d, CH ₂), 3.00 (1H, d, CH ₂), 3.05 (1H, d, CH ₂), 3.65 (3H, s, Me), 6.95-7.05 (2H, m, CH), 7.45-7.5 (1H, m, CH).
1.50	2	Br	Br	1	2,6-F	118	1.55 (6H, s, Me), 3.35 (2H, s, CH ₂), 6.95-7.05 (2H, m, CH), 7.45-7.55 (1H, m, CH).
1.51	2	H	$\begin{array}{c} - \\ \text{CH}_2\text{OC} \\ \text{H}_3 \end{array}$	1	2,6-F	102	1.50 (6H, s, Me), 3.05 (1H, d, CH ₂), 3.10 (1H, d, CH ₂), 3.4 (3H, s, Me), 4.05 (1H, dd, CH ₂), 4.5 (1H, m, CH ₂), 5.2 (1H, m, CH), 6.95-7.05 (2H, m, CH), 7.45-7.5 (1H, m, CH).
1.52	2	-CH(COPh)CH ₂ -		1	2,6-F	191	1.45 (3H, s, Me), 1.47 (3H, s, Me), 2.3 (1H, dd, CH ₂), 2.45 (1H, dd, CH ₂), 2.85 (1H, d, CH ₂), 2.95 (1H, d, CH ₂), 4.15 (1H, dd, CH), 6.7-6.8 (1H, m, CH), 6.95-7.05 (1H, m, CH), 7.3-7.4 (1H, m, CH), 7.5-7.55 (2H, m, CH), 7.6-7.65 (1H, m, CH), 8.0-8.1 (2H, d, CH).
1.53	2	Cl	Br	1	2,6-F	119	1.55 (3H, s, Me), 1.57 (3H, s, Me), 3.3 (1H, d, CH ₂), 3.35 (1H, d, CH ₂), 7.0-7.08 (2H, m, CH), 7.45-7.55 (1H, m, CH).
1.54	2	H	-CO ^c Pr	1	2,6-F	134	0.95-1.05 (2H, m, CH ₂), 1.2-1.25 (2H, m, CH ₂), 1.5 (6H, s, Me), 1.8-1.9 (1H, m, CH), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.4 (1H, d, CH ₂), 6.0 (1H, s, CH), 7.0-7.1 (2H, m, CH), 7.45-7.55 (1H, m, CH).
1.55	2	F	-CH ₃	1	2,6-F	121	1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.35 (3H, dt, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.22 (1H, d, CH ₂), 6.95-7.0 (2H, m, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 4 3】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.56	2	H	- CONH CH ₂ CH F ₂	1	2,6-F	142	1.5 (3H, s, Me), 1.52 (3H, s, Me), 3.0 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.6-3.8 (2H, m, CH ₂), 5.1 (1H, bs, NH), 5.8 (1H, s, CH), 5.9 (1H, t, CH), 7.0-7.1 (2H, m, CH), 7.42-7.52 (1H, m, CH).
1.57	2	H	- COCHF 2	1	2,6-F		Enol form: 1.3 (6H, s, Me), 2.9 (2H, s, CH ₂), 5.5 (1H, t, CHF ₂), 6.8 (2H, t, CH), 7.2 (1H, m, CH).
1.58	2	Cl	- C{O(C O)CH ₃ } =CH ₂	1	2,6-F		1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.1 (3H, s, Me), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.3 (1H, d, CH ₂), 5.6 (1H, d, CH ₂), 6.02 (1H, d, CH ₂), 7.0 (2H, m, CH), 7.48 (1H, m, CH).
1.59	2	H	- COCH ₂ OCH ₃	1	2,6-F		1.52 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 3.28 (3H, s, Me), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.35 (1H, d, CH ₂), 4.1 (2H, s, CH ₂), 6.1 (1H, s, CH), 7.05 (2H, t, CH), 7.5 (1H, m, CH).
1.60	2	H	- COCH ₂ Cl	1	2,6-F		Enol form: 1.52 (6H, s, Me), 3.14 (2H, s, CH ₂), 3.15 (1H, bs, OH), 3.99 (2H, s, CH ₂), 6.98 (2H, m, CH), 7.35 (1H, m, CH).
1.61	2	F	I	1	2,6-F		1.5 (3H, s, Me), 1.52 (3H, s, Me), 3.06 (1H, d, CH ₂), 3.16 (1H, d, CH ₂), 7.0 (2H, m, CH), 7.5 (1H, m, CH).
1.62	2	F	- C{O(C O)CH ₃ } =CH ₂	1	2,6-F		1.495 (3H, s, Me), 1.505 (s, 3H, Me), 2.14 (3H, s, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 5.59 (1H, m, CH ₂), 5.79 (1H, m, CH ₂), 7.0 (2H, m, CH), 7.48 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 4 4】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.63	2	F	Br	1	2,6-F		1.52 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.12 (1H, d, CH ₂), 3.21 (1H, d, CH ₂), 7.02 (2H, m, CH), 7.52 (1H, m, CH).
1.64	2	H	- CH ₂ SO ₂ CH ₃	1	2,6-F		1.45 (3H, s, Me), 1.50 (3H, s, Me), 2.9 (1H, d, CH ₂), 2.95 (3H, s, Me), 3.05 (1H, d, CH ₂), 4.05-4.2 (2H, m, CH ₂), 5.4-5.5 (1H, m, CH), 7.0-7.05 (2H, m, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH).
1.65	2	F	F	1	2- CF ₃		1.575 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 7.75 (2H, m, CH), 7.925 (2H, m, CH).
1.66	2	F	F	1	2- OCH F ₂		1.55 (6H, s, Me), 3.19 (2H, s, CH ₂), 6.5 (1H, m, CH), 7.35 (1H, d, CH), 7.4 (1H, m, CH), 7.65 (1H, m, CH), 7.7 (1H, d, CH).
1.67	2	F	F	1	2- OCF 3		1.55 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 7.45 (2H, m, CH), 7.7 (1H, m, CH), 7.75 (1H, d, CH).
1.68	2	H	F	1	2- OCF 3		1.52 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.17 (1H, d, CH ₂), 6.82 (1H, d, CH), 7.35-7.45 (2H, m, CH), 7.55-7.62 (1H, m, CH), 7.78 (1H, d, CH).
1.69	2	F	F	1	2- SOC F ₃		1.6 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 7.85 (2H, m, CH), 7.975 (1H, m, CH), 8.45 (1H, d, CH).
1.70	2	F	F	1	2- SCF ₃		1.6 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 7.85 (2H, m, CH), 7.975 (1H, m, CH), 8.45 (1H, d, CH).

10

20

30

40

【表 4 5】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.71	2	F	Cl	1	2-CN		1.55 (3H, s, Me), 1.6 (3H, s, Me), 3.21 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 7.725 (1H, m, CH), 7.8 (1H, m, CH), 7.9 (1H, d, CH), 7.965 (1H, d, CH).
1.72	2	F	F	1	2-CN		1.6 (6H, s, Me), 3.3 (2H, s, CH ₂), 7.825 (2H, m, CH), 7.925 (2H, m, CH).
1.73	2	F	Cl	1	2-F		1.55 (3H, s, Me), 1.6 (3H, s, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 7.25 (1H, m, CH), 7.325 (1H, m, CH), 7.6 (1H, m, CH), 7.725 (1H, m, CH).
1.74	2	F	Cl	1	2-CH ₃		1.525 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.675 (3H, d, Me), 2.925 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 7.325 (1H, d, CH), 7.375 (1H, m, CH), 7.475 (1H, m, CH), 7.75 (1H, d, CH).
1.75	2	F	Cl	1	H		1.525 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.9 (1H, d, CH ₂), 3.15 (1H, d, CH ₂), 7.55-7.65 (3H, m, CH), 7.8 (2H, d, CH).
1.76	2	F	F	1	3,5-OCH ₃		1.575 (6H, s, Me), 3.125 (2H, s, CH ₂), 3.85 (6H, s, Me), 6.7 (1H, s, CH), 6.8 (2H, s, CH).
1.77	2	F	F	1	H		1.525 (6H, s, Me), 3.125 (2H, s, CH ₂), 7.55 (2H, m, CH), 7.65 (1H, m, CH), 7.7 (2H, m, CH).
1.78	2	H	Br	1	2-OCH F ₂		1.4 (3H, s, Me), 1.5 (3H, s, Me), 2.85 (1H, d, CH ₂), 3.15 (1H, d, CH ₂), 6.55 (1H, t, CH), 6.55 (1H, s, CH), 7.2 (1H, d, CH), 7.3-7.4 (1H, m, CH), 7.45-7.5 (1H, m, CH), 7.95 (1H, d, CH).

10

20

30

40

【表 4 6】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.79	2	H	Br	1	2- CF ₃		1.42 (3H, s, Me), 1.5 (3H, s, Me), 2.9 (1H, d, CH ₂), 3.15 (1H, d, CH ₂), 6.45 (1H, s, CH), 7.55-7.6 (1H, m, CH), 7.7-7.75 (2H, m, CH), 8.22 (1H, d, CH).
1.80	2	H	Br	1	2- F,6- CF ₃		1.55 (3H, s, Me), 1.57 (3H, s, Me), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 6.7 (1H, s, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH), 7.58-7.65 (2H, m, CH).
1.81	2	H	Br	1	H		1.32 (3H, s, Me), 1.45 (3H, s, Me), 2.5 (1H, d, CH ₂), 3.0 (1H, d, CH ₂), 6.05 (1H, s, CH), 7.4-7.5 (3H, m, CH), 7.6-7.65 (2H, m, CH).
1.82	2	H	Br	1	2-F		1.4 (3H, s, Me), 1.5 (3H, s, Me), 2.8 (1H, d, CH ₂), 3.1 (1H, d, CH ₂), 6.42 (1H, s, CH), 7.1 (1H, t, CH), 7.27 (1H, m, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH), 7.85 (1H, m, CH).
1.83	2	H	Br	1	2-CN		1.45 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.02 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 6.4 (1H, s, CH), 7.55-7.6 (1H, m, CH), 7.7-7.8 (2H, m, CH), 8.1 (1H, d, CH).
1.84	2	H	Br	1	3,5- OCH 3		1.35 (3H, s, Me), 1.45 (3H, s, Me), 2.5 (1H, d, CH ₂), 3.0 (1H, d, CH ₂), 3.8 (6H, s, Me), 5.9 (1H, s, CH), 6.5 (1H, s, CH), 7.73 (2H, s, CH).
1.85	2	H	-SCF ₃	1	2,6-F		1.49 (3H, s, Me), 1.52 (3H, s, Me), 3.01 (1H, d, CH ₂), 3.18 (1H, d, CH ₂), 6.04 (1H, s, CH), 7.04 (2H, m, CH), 7.49 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 4 7】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.86	2	H	-CH ₂ (1- ヒラリル)	1	2,6-F		1.43 (3H, s, Me), 1.47 (3H, s, Me), 2.9 (1H, d, CH ₂), 2.95 (1H, d, CH ₂), 4.95 (1H, dd, CH ₂), 5.30 (1H, dd, CH ₂), 5.72 (1H, dd, CH), 6.15 (1H, t, CH), 6.95-7.0 (2H, m, CH), 7.35-7.4 (1H, m, CH), 7.45 (1H, d, CH), 7.5 (1H, d, CH).
1.87	2	H	-CH ₂ (1- イミダゾリル)	1	2,6-F		1.45 (3H, s, Me), 1.5 (3H, s, Me), 2.9 (1H, d, CH ₂), 3.0 (1H, d, CH ₂), 2.98 (1H, d, CH ₂), 4.90 (1H, dd, CH ₂), 5.05 (1H, dd, CH), 5.55 (1H, dd, CH), 6.9 (1H, s, CH), 6.95-7.05 (2H, m, CH), 7.35-7.45 (1H, m, CH), 7.5 (1H, s, CH).
1.88	2	H	-CH ₂ (1- インダゾリル)	1	2,6-F		1.25 (3H, s, Me), 1.3 (3H, s, Me), 2.8 (1H, d, CH ₂), 2.85 (1H, d, CH ₂), 5.20 (1H, dd, CH ₂), 5.58 (1H, dd, CH ₂), 5.95 (1H, dd, CH), 6.95-7.0 (2H, m, CH), 7.0-7.1 (1H, m, CH), 7.25-7.3 (1H, m, CH), 7.30-7.40 (1H, m, CH), 7.6-7.7 (2H, m, CH), 8.0 (1H, s, CH).
1.89	2	H	- CH ₂ (4,5- ジヒドロ ピラゾル -1-イル)	1	2,6-F		1.43 (3H, s, Me), 1.46 (3H, s, Me), 2.55-2.7 (2H, m, CH ₂), 2.9 (1H, dd, CH ₂), 3.05 (1H, d, CH ₂), 3.10 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, dd, CH ₂), 3.62 (1H, dd, CH ₂), 4.2 (1H, dd, CH ₂), 5.53 (1H, dd, CH), 6.83 (1H, s, CH), 6.95-7.0 (2H, m, CH), 7.30-7.40 (1H, m, CH).
1.90	2	H	- CH ₂ (1,2, 4- トリazol -1-イル)	1	2,6-F		1.45 (3H, s, Me), 1.48 (3H, s, Me), 2.90 (1H, d, CH ₂), 2.98 (1H, d, CH ₂), 5.10 (1H, dd, CH ₂), 5.33 (1H, dd, CH ₂), 5.72 (1H, dd, CH), 6.95-7.2 (2H, m, CH), 7.35-7.45 (1H, m, CH), 7.9 (1H, s, CH), 8.15 (1H, s, CH).

10

20

30

40

【表 4 8】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.91	2	H	Cl	1	2- F,6- CF ₃		1.55 (3H, s, Me), 1.56 (3H, s, Me), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 6.61 (1H, s, CH), 7.45 (1H, m, CH), 7.625 (2H, m, CH).
1.92	2	F	F	1	2- CH ₃		1.6 (6H, s, Me), 2.65 (3H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 7.35-7.4 (2H, m, CH), 7.5-7.55 (1H, m, CH), 7.65 (1H, d, CH).
1.93	2	H	F	1	2- CH ₃		1.58 (3H, s, Me), 1.60 (3H, s, Me), 2.55 (3H, s, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 6.73 (1H, d, CH), 7.32 (1H, m, CH), 7.4 (1H, m, CH), 7.45 (1H, m, CH), 7.66 (1H, d, CH).
1.94	2	F	F	1	2-F		1.55 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 7.2-7.25 (1H, m, CH), 7.3-7.35 (1H, m, CH), 7.6-7.7 (2H, m, CH).
1.95	2	F	Cl	1	2- CF ₃		1.5 (3H, s, Me), 1.58 (3H, s, Me), 3.08 (1H, d, CH ₂), 3.18 (1H, d, CH ₂), 7.65-7.75 (2H, d, CH), 7.9 (1H, d, CH), 8.1 (1H, d, CH).
1.96	2	F	Cl	1	3,5- OCH 3		1.45 (3H, s, Me), 1.5 (3H, s, Me), 2.8 (1H, d, CH ₂), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.8 (6H, s, Me), 6.6 (1H, s, CH), 6.82 (2H, s, CH).
1.97	2	F	Cl	1	2- SOC F ₃		1.6 (3H, s, Me), 1.61 (3H, s, Me), 3.16 (1H, d, CH ₂), 3.3 (1H, d, CH ₂), 7.87 (1H, m, CH), 7.94 (1H, m, CH), 7.95 (1H, m, CH), 8.49 (1H, d, CH).

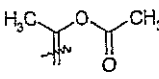
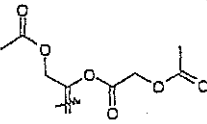
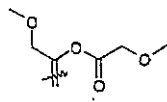
10

20

30

40

【表 4 9】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.98	2			1	2,6-F		1.5 (6H, s, Me), 2.1 (3H, s, Me), 2.3 (3H, s, Me), 3.05 (2H, s, CH ₂), 7.0-7.05 (2H, m, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH).
1.99	2			1	2,6-F		1.55 (6H, s, Me), 2.05 (3H, s, Me), 2.2 (3H, s, Me), 3.05 (2H, s, CH ₂), 4.7 (2H, s, CH ₂), 4.88 (2H, s, CH ₂), 7.0-7.05 (2H, m, CH), 7.4-7.5 (1H, m, CH).
1.100	2			1	2,6-F		1.5 (6H, s, Me), 3.05 (2H, s, CH ₂), 3.25 (3H, s, Me), 3.55 (3H, s, Me), 4.15 (2H, s, CH ₂), 4.35 (2H, s, CH ₂), 7.0-7.05 (2H, m, CH), 7.45-7.5 (1H, m, CH).
1.101	2	H	Br	1	2-OCH ₃		1.32 (3H, s, Me), 1.43 (3H, s, Me), 2.52 (1H, d, CH ₂), 3.04 (1H, d, CH ₂), 3.88 (3H, s, Me), 6.73 (1H, s, CH), 6.91 (1H, d, CH), 7.07 (1H, t, CH), 7.42 (1H, m, CH), 7.85 (1H, m, CH).
1.102	2	H	Br	1	2,6-F,3-CH ₃		1.50 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 2.28 (3H, s, Me), 3.08 (1H, d, CH ₂), 3.21 (1H, d, CH ₂), 6.47 (1H, s, CH), 6.92 (1H, m, CH), 7.29 (1H, m, CH).
1.103	2	H	Br	1	2,3-OCH ₂ OC H ₂ -, 5-F		1.43 (3H, s, Me), 1.49 (3H, s, Me), 2.83 (1H, d, CH ₂), 3.14 (1H, d, CH ₂), 4.88 (2H, m, CH ₂), 5.29 (2H, m, CH ₂), 6.55 (1H, s, CH), 6.81 (1H, m, CH), 7.45 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 5 0】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.104	2	H	F	1	2-OCH ₃		1.51 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 3.10 (2H, s, CH ₂), 3.90 (3H, s, Me), 6.97 (1H, d, CH), 6.99 (1H, d, CH), 7.08 (1H, t, CH), 7.49 (1H, t, CH), 7.62 (1H, d, CH).
1.105	2	H	F	1	2,6-F,3-CH ₃		1.54 (3H, s, Me), 1.56 (3H, s, Me), 2.28 (3H, s, Me), 3.21 (2H, s, CH ₂), 6.72 (1H, d, CH), 6.93 (1H, m, CH), 7.34 (1H, m, CH).
1.106	2	H	F	1	2,3-OCH ₂ OC H ₂ -, 5-F		1.53 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.14 (2H, dd, CH ₂), 4.90 (2H, dd, CH ₂), 5.29 (2H, m, CH ₂), 6.85 (1H, d, CH), 6.87 (1H, m, CH), 7.24 (1H, m, CH).
1.107	2	F	F	1	2-OCH ₃		1.54 (6H, s, Me), 3.14 (2H, s, CH ₂), 3.90 (3H, s, Me), 7.06 (2H, m, CH), 7.56 (2H, m, CH).
1.108	2	F	F	1	2,6-F,3-CH ₃		1.56 (6H, s, Me), 2.29 (3H, s, Me), 3.19 (2H, s, CH ₂), 6.95 (1H, m, CH), 7.42 (1H, m, CH).
1.109	2	F	F	1	2,3-OCH ₂ OC H ₂ -, 5-F		1.55 (6H, s, Me), 3.16 (2H, s, CH ₂), 4.93 (2H, s, CH ₂), 5.27 (2H, s, CH ₂), 6.95 (1H, m, CH), 7.19 (1H, m, CH).
1.110	2	H	F	1	2-O(S O ₂)C H ₃		1.52 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 3.09 (1H, d, CH ₂), 3.16 (1H, d, CH ₂), 3.30 (3H, s, Me), 6.83 (1H, d, CH), 7.46 (1H, m, CH), 7.59 (2H, d, CH), 7.75 (1H, d, CH).

10

20

30

40

【表 5 1】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.111	2	F	F	1	2- O(S O ₂)C H ₃		1.55 (6H, s, Me), 3.12 (2H, s, CH ₂), 3.31 (3H, s, Me), 7.46 (1H, m, CH), 7.69 (2H, m, CH), 7.72 (1H, d, CH).
1.112	2	H	F	1	- OCH 2C≡C H		1.50 (3H, s, Me), 1.52 (3H, s, Me), 2.55 (1H, t, CH), 3.09 (2H, s, CH ₂), 4.76 (1H, dd, CH ₂), 4.82 (1H, dd, CH ₂), 6.96 (1H, d, CH), 7.13 (2H, m, CH), 7.50 (1H, t, CH), 7.63 (1H, d, CH).
1.113	2	H	CF ₃	1	2,6-F		1.52 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 3.05-3.25 (2H, m, CH ₂), 5.9-6.1 (1H, m, CH), 6.95-7.15 (2H, m, CH), 7.4-7.6 (1H, m, CH).
1.114	2	F	F	1	2,5-F	77-79	1.57 (6H, s, Me), 3.19 (2H, s, CH ₂), 7.1-7.25 (1H, m, CH), 7.3-7.45 (2H, m, CH).
1.115	2	F	F	1	3,5-F	108-110	1.61 (6H, s, Me), 3.21 (2H, s, CH ₂), 7.1-7.2 (1H, m, CH), 7.25-7.4 (2H, m, CH).
1.116	2	F	F	1	2,3-F	106	1.57 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 7.28 (1H, m, CH), 7.4-7.5 (2H, m, CH).
1.117	2	F	F	1	2-phenyl	89	1.52 (3H, s, Me), 1.61 (3H, s, Me), 3.03 (2H, s, CH ₂), 7.35-7.45 (6H, m, CH), 7.58 (1H, t, CH), 7.65 (1H, t, CH), 7.85 (1H, d, CH).
1.118	2	F	F	1	2,4-F	92	1.55 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 6.98 (1H, t, CH), 7.06 (1H, t, CH), 7.65 (1H, q, CH).
1.119	2	F	F	1	2-F, 4-CO ₂ CH ₃	90-95	1.56 (6H, s, Me), 3.19 (2H, s, CH ₂), 3.97 (3H, s, Me), 7.7-7.8 (1H, m, CH), 7.85-7.93 (1H, m, CH), 7.95-8.05 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 5 2】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.120	2	F	F	1	2-F, 4- CO ₂ CH ₂ CH ₃	99- 101	1.41 (3H, t, Me), 1.56 (6H, s, Me), 3.19 (2H, s, CH ₂), 4.41 (2H, q, CH ₂), 7.72 (1H, m, CH), 7.85 (1H, m, CH), 7.99 (1H, m, CH).
1.121	2	H	Cl	1	2F, 4- CO ₂ CH ₃	148- 151	1.50 (3H, s, Me), 1.54 (3H, s, Me), 3.08 (1H, d, CH ₂), 3.14 (1H, d, CH ₂), 3.95 (3H, s, Me), 6.43 (1H, s, CH), 7.81 (1H, m, CH), 7.89 (1H, m, CH), 7.95 (1H, m, CH).
1.122	2	H	Cl	1	2F, 4- CO ₂ CH ₂ CH ₃	112- 114	1.41 (3H, t, Me), 1.50 (3H, m, Me), 1.54 (3H, m, Me), 3.08 (1H, m, CH ₂), 3.14 (1H, m, CH ₂), 4.41 (2H, q, CH ₂), 6.43 (1H, s, CH), 7.81 (1H, m, CH), 7.89 (1H, m, CH), 7.95 (1H, m, CH).
1.123	2	H	Cl	1	3,5-F	154- 156	1.49 (3H, m, Me), 1.53 (3H, m, Me), 3.05 (1H, m, CH ₂), 3.10 (1H, m, CH ₂), 5.96 (1H, s, CH), 6.96 (1H, m, CH), 7.19 (2H, m, CH).
1.124	2	H	Cl	1	2,5-F	132- 134	1.50 (3H, m, Me), 1.54 (3H, m, Me), 3.08 (1H, m, CH ₂), 3.13 (1H, m, CH ₂), 6.37 (1H, s, CH), 7.17 (2H, m, CH), 7.51 (1H, m, CH).
1.125	2	F	Cl	1	3,5-F	109- 111	1.54 (6H, m, Me), 3.07 (1H, m, CH ₂), 3.16 (1H, m, CH ₂), 7.04 (1H, m, CH), 7.2-7.35 (2H, m, CH).
1.126	2	F	Cl	1	2,5-F	103- 105	1.50 (3H, m, Me), 1.60 (3H, m, Me), 3.05-3.3 (2H, m, CH ₂), 7.18 (1H, m, CH), 7.28 (1H, m, CH), 7.41 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 5 3】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.127	2	F	Cl	1	2-F, 4- CO ₂ CH ₃	125- 127	1.50-1.60 (6H, m, Me), 3.05-3.3 (2H, m, CH ₂), 3.96 (3H, s, Me), 7.76 (1H, m, CH), 7.86 (1H, m, CH), 7.96 (1H, m, CH).
1.128	2	F	Cl	1	2-F, 4- CO ₂ CH ₂ CH ₃	91-93	1.41 (3H, t, Me), 1.50-1.75 (6H, m, Me), 3.05-3.3 (2H, m, CH ₂), 4.41 (2H, q, CH ₂), 7.78 (1H, m, CH), 7.86 (1H, m, CH), 7.94 (1H, m, CH).
1.129	2	H	Cl	1	2-phenyl		1.4 (3H, s, Me), 1.45 (3H, s, Me), 2.82 (1H, d, CH ₂), 3.05 (1H, d, CH ₂), 6.18 (1H, s, CH), 7.3-7.5 (8H, m, CH), 8.0 (1H, m, CH).
1.130	2	H	Cl	1	2,4-F		1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.07 (1H, d, CH ₂), 3.15 (1H, d, CH ₂), 6.32 (1H, s, CH), 6.9 (1H, dt, CH), 7.02 (1H, t, CH), 7.8 (1H, q, CH).
1.131	2	H	Cl	1	2,3-F		1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 6.43 (1H, s, CH), 7.25-7.4 (2H, m, CH), 7.6 (1H, t, CH).
1.132	2	H	Br	1	2,3-F	115- 116	1.55 (3H, s, Me), 1.60 (3H, s, Me), 2.97 (1H, d, CH ₂), 3.1 (1H, d, CH ₂), 6.47 (1H, s, CH), 7.2-7.4 (2H, m, CH), 7.7 (1H, t, CH).
1.133	2	F	Cl	1	2,4-F	102- 103	1.52 (3H, s, Me), 1.57 (3H, s, Me), 3.12 (1H, d, CH ₂), 3.22 (1H, d, CH ₂), 6.95 (1H, dt, CH), 7.05 (1H, t, CH), 7.7 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 5 4】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.134	2	H	Br	1	3,5-F	155-157	1.43 (3H, s, Me), 1.51 (3H, s, Me), 2.88 (1H, d, CH ₂), 3.10 (1H, d, CH ₂), 6.00 (s, 1H, CH), 6.93 (1H, m, CH), 7.1-7.3 (2H, m, CH).
1.135	2	H	Br	1	2,5-F	135-138	1.44 (3H, m, Me), 1.51 (3H, m, Me), 2.85-3.0 (1H, m, CH ₂), 3.1-3.25 (1H, m, CH ₂), 6.93 (1H, s, CH), 7.05-7.2 (2H, m, CH), 7.57 (1H, m, CH).
1.136	2	H	Br	1	2-F, 4-CO ₂ CH ₃	162-167	1.44 (3H, s, Me), 1.51 (3H, s, Me), 2.94 (1H, d, CH ₂), 3.12 (1H, d, CH ₂), 3.95 (3H, s, Me), 6.45 (1H, s, CH), 7.77 (1H, m, CH), 7.94 (2H, m, CH).
1.137	2	H	Br	1	2F, 4-CO ₂ CH ₂ CH ₃	127-129	1.40 (3H, t, Me), 1.44 (3H, m, Me), 1.51 (3H, m, Me), 2.95 (1H, d, CH ₂), 3.12 (1H, d, CH ₂), 4.40 (2H, q, CH ₂), 6.45 (1H, s, CH), 7.77 (1H, m, CH), 7.94 (2H, m, CH).
1.138	2	Me	F	1	H	91-93	1.37 (3H, s, Me), 1.40 (3H, s, Me), 2.2 (3H, d, Me), 2.52 (2H, d, CH ₂), 2.92 (2H, d, CH ₂), 7.45-7.55 (3H, m, CH), 7.6-7.7 (2H, m, CH).
1.139	1	H	CF ₃	1	2,6-F		1.50 (3H, s, Me), 1.52 (3H, s, Me), 2.90 (1H, d, CH ₂), 3.16 (1H, d, CH ₂), 3.56 (1H, m, CH), 7.06 (2H, m, CH), 7.48 (1H, m, CH).
1.140	1	H と CF ₃ の混合物	CF ₃ と H の混合物	1	2,6-F		1.07 (2H, s, Me), 1.4-1.7 (4H, m, Me), 2.7-2.9 (1H, m, CH ₂), 3.1-3.3 (1H, m, CH ₂), 5.02 (0.5H, m, CH), 5.36 (0.5H, m, CH), 7.02 (2H, m, CH), 7.45 (1H, m, CH).

10

20

30

40

【表 5 5】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.141	2	H	Cl	1	2- OCH 3	126- 127	1.41 (3H, s, Me), 1.48 (3H, s, Me), 2.76 (1H, d, CH ₂), 3.08 (1H, d, CH ₂), 3.89 (3H, s, Me), 6.70 (1H, s, CH), 6.95 (1H, d, CH), 7.08 (1H, t, CH), 7.44 (1H, t, CH), 7.77 (1H, d, CH).
1.142	2	F	Cl	1	2- OCH 3		1.50 (3H, s, Me), 1.51 (3H, s, Me), 3.01 (1H, d, CH ₂), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.91 (3H, s, Me), 7.05 (2H, m, CH), 7.52 (1H, t, CH), 7.61 (1H, d, CH).
1.143	2	H	Cl	1	2- OCF 3		1.48 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 3.00 (1H, d, CH ₂), 3.14 (1H, d, CH ₂), 6.45 (1H, s, CH), 7.35 (1H, d, CH), 7.44 (1H, t, CH), 7.55 (1H, t, CH), 7.93 (1H, d, CH).
1.144	2	F	Cl	1	2- OCF 3		1.52 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.10 (1H, d, CH ₂), 3.21 (1H, d, CH ₂), 7.43 (2H, m, CH), 7.63 (1H, t, CH), 7.84 (1H, d, CH).
1.145	2	H	Cl	1	2,6- F, 3- CH ₃		1.53 (3H, s, Me), 1.54 (3H, s, Me), 2.28 (3H, s, Me), 3.19 (2H, q, CH ₂), 6.42 (1H, s, CH), 6.92 (1H, t, CH), 7.31 (1H, q, CH).
1.146	2	F	Cl	1	2,6- F, 3- CH ₃	103- 104	1.53 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.28 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.23 (1H, d, CH ₂), 6.93 (1H, t, CH), 7.38 (1H, m, CH).
1.147	2	H	Cl	1	2,3- OCH 2OC H ₂ -, 5-F	136- 137	1.49 (3H, s, Me), 1.52 (3H, s, Me), 2.98 (1H, d, CH ₂), 3.15 (1H, d, CH ₂), 4.89 (2H, s, CH ₂), 5.30 (2H, s, CH ₂), 6.52 (1H, s, CH), 6.83 (1H, dd, CH), 7.38 (1H, dd, CH).

10

20

30

40

【表 5 6】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
1.148	2	Cl	F	1	2,3-F		1.57 (6H, s, Me), 3.12 (1H, d, CH ₂), 3.22 (1H, d, CH ₂), 7.28 (1H, m, CH), 7.38-7.5 (2H, m, CH).
1.149	2	Cl	F	1	2-phenyl		1.42 (3H, s, Me), 1.48 (3H, s, Me), 2.88 (1H, dd, CH ₂), 3.05 (1H, dd, CH ₂), 7.20-7.45 (6H, m, CH), 7.50 (2H, m, CH), 7.90 (1H, d, CH).
1.150	2	H	Br	1	2,4-F	86-88	1.45 (3H, s, Me), 1.52 (3H, s, Me), 2.90 (2H, dd, CH ₂), 6.38 (1H, s, CH), 6.90 (1H, dt, CH), 7.05 (1H, t, CH), 7.88 (1H, q, CH).
1.151	2	H	Br	1	2-phenyl	120-122	1.34 (3H, s, Me), 1.43 (3H, s, Me), 2.62 (1H, d, CH ₂), 3.00 (1H, d, CH ₂), 6.2 (1H, s, CH), 7.3-7.5 (8H, m, CH), 8.1 (1H, m, CH).
1.152	2	F	F	1	2,3-OCF ₂ O-		1.57 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 7.26 (1H, m, CH), 7.4 (2H, m, CH).

【0518】

キー：

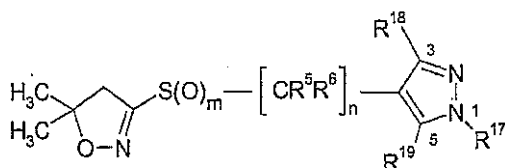
Me=メチル；s=単項；m=多重項；d=二重項；dd=二重の二重項；t=三重項；q=四重項；dt=二重の三重項；bs=広い単項；bm=広い多重項；bq=広い四重項。

【0519】

表28：一般式 (I.4) の化合物

【0520】

【化106】



【0521】

【表 5 7】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
2.01	2	F	F	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃	103	1.5 (6H, s, Me), 3.15 (2H, s, CH ₂), 3.85 (3H, s, Me), 4.68 (2H, q, CH ₂).
2.02	2	H	F	1	CH ₃	CF ₃	Cl	116	1.55 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 4.0 (3H, s, Me), 6.55 (1H, d, CH).
2.03	2	F	F	1	CH ₃	CF ₃	Cl		1.55 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 4.0 (3H, s, Me).
2.04	2	H	Cl	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.52 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.85 (3H, s, Me), 4.7-4.82 (2H, m, CH ₂), 6.2 (1H, s, CH).
2.05	2	H	Cl	1	CH ₃	CF ₃	Cl	98	1.55 (3H, s, Me), 1.56 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 3.95 (3H, s, Me), 6.2 (1H, s, CH).
2.06	2	H	- COC HF ₂	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.4 (3H, s, Me), 1.45 (3H, s, Me), 2.95 (1H, d, CH ₂), 3.05 (1H, d, CH ₂), 3.75 (3H, s, Me), 4.7 (2H, q, CH ₂), 5.95 (1H, t, CH).
2.07	2	H	- CO ^c Pr	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.02 (2H, m, CH ₂), 1.2 (2H, m, CH ₂), 1.49 (3H, s, Me), 1.51 (3H, s, Me), 1.87 (1H, m, CH), 3.14 (1H, d, CH ₂), 3.31 (1H, d, CH ₂), 3.87 (3H, s, Me), 4.54 (1H, m, CH ₂), 4.68 (1H, m, CH ₂), 5.9 (1H, s, CH).

10

20

30

40

【表 5 8】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
2.08	2	H	- COC H ₃	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃		外-イタノル互変異 性体の混合物1:1. 外ノ信号 : 1.45 (3H, s, Me), 1.5 (3H, s, Me), 1.9 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 3.8 (3H, s, Me), 4.5-4.75 (2H, m, CH ₂), 5.7 (1H, s, CH). 内ノ信号 : 1.53 (6H, s, Me), 2.25 (3H, s, Me), 3.0 (3H, s, CH ₂ + OH), 3.85 (3H, s, Me), 4.7-4.75 (2H, m, CH ₂).
2.09	2	Br	Br	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.57 (6H, s, Me), 3.4 (2H, s, CH ₂), 3.88 (3H, s, Me), 4.7 (2H, q, CH ₂).
2.10	2	H	Br	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.5 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.18 (1H, d, CH ₂), 3.83 (3H, s, Me), 4.7-4.9 (2H, m, CH ₂), 6.22 (1H, s, CH).
2.11	2	F	F	1	CH ₃	CF ₃	- OCHF ₂		1.55 (6H, s, Me), 3.18 (2H, s, CH ₂), 3.9 (3H, s, Me), 6.8 (1H, dd, CH).
2.12	2	F	Cl	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃	107- 109	1.5 (3H, s, Me), 1.53 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.85 (3H, s, Me), 4.52-4.62 (1H, m, CH ₂), 4.8-4.9 (1H, m, CH ₂).
2.13	2	Cl	Cl	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.55 (6H, s, Me), 3.3 (2H, s, CH ₂), 3.85 (3H, s, Me), 4.7 (2H, q, CH ₂).

10

20

30

40

【表 5 9】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
2.14	2	F	Cl	1	CH ₃	CF ₃	- OCHF ₂		1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.9 (3H, s, Me), 6.9 (1H, t, CH).
2.15	2	Cl	Cl	1	CH ₃	CF ₃	- OCHF ₂		1.55 (6H, s, Me), 3.3 (2H, s, CH ₂), 3.9 (3H, s, Me), 6.95 (1H, t, CH).
2.16	2	H	Cl	1	CH ₃	CF ₃	- OCHF ₂		1.55 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 3.9 (3H, s, Me), 6.2 (1H, s, CH), 6.95 (1H, dd, CH).
2.17	2	F	F	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CH ₃	97- 98	1.48 (3H, t, Me), 1.55 (6H, s, Me), 3.16 (2H, s, CH ₂), 3.81 (3H, s, Me), 4.36 (2H, q, CH ₂).
2.18	2	Cl	Cl	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CH ₃	98- 100	1.50 (3H, t, Me), 1.55 (6H, s, Me), 3.28 (2H, s, CH ₂), 3.82 (3H, s, Me), 4.32 (2H, q, CH ₂).
2.19	2	H	Cl	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CH ₃		1.53 (3H, t, Me), 1.55 (6H, s, Me), 3.15 (2H, dd, CH ₂), 3.80 (3H, s, Me), 4.36 (2H, q, CH ₂), 6.15 (1H, s, CH).
2.20	2	F	Cl	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CH ₃	94- 95	1.50 (3H, t, Me), 1.53 (6H, s, Me), 3.17 (2H, d, CH ₂), 3.82 (3H, s, Me), 4.29 (1H, m, CH), 4.38 (1H, m, CH).
2.21	2	F	F	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CHF ₂	82- 84	1.56 (6H, s, Me), 3.16 (2H, s, CH ₂), 3.85 (3H, s, Me), 4.50 (2H, dt, CH ₂), 6.10 (1H, tt, CH).

10

20

30

40

【表 6 0】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
2.22	2	H	F	1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.53 (3H, s, Me), 1.54 (3H, s, Me), 3.12 (1H, d, CH ₂), 3.18 (1H, d, CH ₂), 3.83 (3H, s, Me), 4.5-4.6 (1H, m, CH ₂), 4.8-4.9 (1H, m, CH ₂), 6.6 (1H, d, CH).
2.23	2	F	F	1	CH ₃	CF ₃	-OCH ₃		1.55 (6H, s, Me), 3.16 (2H, s, CH ₂), 3.82 (3H, s, Me), 4.11 (3H, s, Me).
2.24	2	H	F	1	CH ₃	CH ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.54 (3H, s, Me), 1.56 (3H, s, Me), 2.31 (3H, s, Me), 3.16 (2H, dd, CH ₂), 3.70 (3H, s, Me), 4.45-4.55 (1H, m, CH ₂), 4.65-4.75 (1H, m, CH ₂), 6.32 (1H, d, CH).
2.25	2	H	F	1	CH ₃	CF ₃	- OCHF ₂		1.55 (6H, s, Me) 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 3.9 (3H, s, Me), 6.55 (1H, d, CH), 6.8 (1H, t, CH).
2.26	2	H	Cl	1	CH ₃	CF ₃	-OCH ₃		1.52 (6H, s, Me), 3.17 (2H, dd, CH ₂), 3.82 (3H, s, Me), 4.11 (3H, s, Me), 6.14 (1H, s, CH).
2.27	2	H	F	1	CH ₃	CF ₃		105- 107	1.54 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.14 (2H, q, CH ₂), 3.82 (3H, s, Me), 4.73-4.78 (2H, m, CH ₂), 4.84-4.98 (2H, m, CH ₂), 5.42-5.51 (1H, m, CH), 6.50 (1H, d, CH).

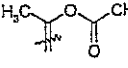
10

20

30

40

【表 6 1】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
2.28	2	F	F	1	CH ₃	CF ₃			1.55 (6H, s, Me), 3.14 (2H, s, CH ₂), 3.81 (3H, s, Me), 4.82-4.88 (2H, m, CH ₂), 4.92-4.98 (2H, m, CH ₂), 5.36-5.44 (1H, m, CH).
2.29	2	H	Cl	1	CH ₃	CF ₃			1.53 (3H, s, Me), 1.54 (3H, s, Me), 3.14 (2H, s, CH ₂), 3.78 (3H, s, Me), 4.84-4.98 (4H, m, CH ₂), 5.40-5.46 (1H, m, CH), 6.12 (1H, s, CH).
2.30	2	Cl	Cl	1	CH ₃	CF ₃			1.55 (6H, s, Me), 3.26 (2H, s, CH ₂), 3.74 (3H, s, Me), 4.95 (4H, d, CH ₂), 5.24-5.31 (1H, m, CH).
2.31	2	H	Cl	1	CH ₃	CH ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.53 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.36 (3H, s, Me), 3.17 (2H, q, CH ₂), 3.70 (3H, s, Me), 4.53-4.71 (2H, m, CH ₂), 5.93 (1H, s, CH).
2.32	2			1	CH ₃	CF ₃	- OCH ₂ CF ₃		1.50 (6H, s, Me), 2.1 (3H, s, Me), 2.3 (3H, s, Me), 2.97 (1H, d, CH ₂), 3.05 (1H, d, CH ₂), 3.8 (3H, s, Me), 4.7 (1H, m, CH ₂), 4.79 (1H, m, CH ₂).
2.33	2	F	F	1	CH ₃	CF ₃	H	102-104	1.55 (6H, s, Me), 3.17 (2H, s, CH ₂), 4.03 (3H, s, Me), 7.94 (1H, s, CH).
2.34	2	F	F	1	CH ₃	- OC HF ₂	CF ₃		1.57 (6H, s, Me), 3.18 (2H, s, CH ₂), 4.0 (3H, s, Me), 6.93 (1H, t, J = 75 Hz, CH).

10

20

30

40

【表 6 2】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
2.35	1	H	CF ₃	1	CH ₃	CF ₃	OCH ₂ CF ₃		1.49 (6H, s, Me), 2.7- 2.9 (1H, m, CH ₂), 2.9- 3.2 (1H, m, CH ₂), 3.88 (3H, s, Me), 4.48 (1H, m, CH ₂), 4.71 (1H, m, CH ₂), 5.16 (1H, m, CH).
2.36	2	F	F	1	CH ₃	CF ₃	SO ₂ ⁱ Pr		1.40 (3H, s, Me), 1.42 (3H, s, Me), 1.56 (6H, s, Me), 3.2 (2H, s, CH ₂), 3.70 (1H, heptet, CH) 4.32 (3H, s, Me).

10

20

【0 5 2 2】

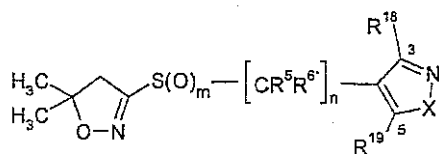
キー：

Me=メチル；s=単項；m=多重項；d=二重項；dd=二重の二重項；t=三重項；tt=三重の三重項；q=四重項；dt=二重の三重項。

【0 5 2 3】

【表 6 3】

表29：式1.5の化合物



30

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	X	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
3.01	2	H	F	1	S	CH ₃	CN		1.58 (3H, s, Me), 1.6 (3H, s, Me), 2.7 (3H, s, Me), 3.21 (1H, d, CH ₂), 3.29 (1H, d, CH ₂), 6.65 (1H, d, CH).
3.02	2	F	F	1	S	CH ₃	CN		1.6 (6H, s, Me), 2.78 (3H, s, Me), 3.24 (2H, s, CH ₂).

40

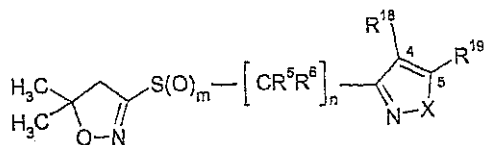
【表 6 4】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	X	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
3.03	2	H	Cl	1	O	CH ₃	CH ₃	137	1.51 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.4 (3H, s, Me), 2.57 (3H, s, Me), 3.075 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 5.9 (1H, s, CH).
3.04	2	Cl	Cl	1	O	CH ₃	CH ₃	108	1.575 (6H, s, Me), 2.5 (3H, s, Me), 2.7 (3H, s, Me), 3.25 (2H, s, CH ₂).
3.05	2	H	Cl	1	O	CH ₃	^c Pr	125	1.175 (2H, m, CH ₂), 1.225 (2H, m, CH ₂), 1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.23 (1H, m, CH), 2.4 (3H, s, Me), 3.025 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 6.0 (1H, s, CH).
3.06	2	Cl	Cl	1	O	CH ₃	^c Pr	72	1.15 (2H, m, CH ₂), 1.3 (2H, m, CH ₂), 1.575 (6H, s, Me), 2.475 (3H, s, Me), 2.6 (1H, m, CH), 3.235 (2H, s, CH ₂).
3.07	2	H	Cl	1	O	^c Pr	CH ₃	159	1.025 (2H, m, CH ₂), 1.075 (2H, m, CH ₂), 1.5 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 1.91 (1H, m, CH), 2.58 (3H, s, Me), 3.06 (1H, d, CH ₂), 3.2 (1H, d, CH ₂), 6.025 (1H, s, CH).

キー：

Me=メチル；s=単項；m=多重項；d=二重項

表30：式1. 6の化合物



10

20

30

40

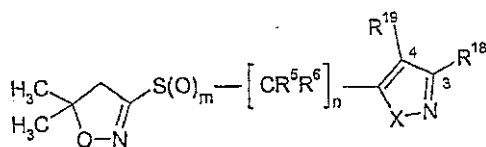
【表 6 5】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	X	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
4.01	2	F	Cl	1	O	H	CH ₃		1.535 (3H, s, Me), 1.54 (3H, s, Me), 2.51 (3H, s, Me), 3.11 (1H, d, CH ₂), 3.19 (1H, d, CH ₂), 6.4 (1H, s, CH).
4.02	2	H	F	1	O	H	CH ₃	106	1.54 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 2.5 (3H, s, Me), 3.11 (1H, d, CH ₂), 3.175 (1H, d, CH), 6.4 (1H, s, CH), 6.52 (1H, d, CH).
4.03	2	F	F	1	O	H	CH ₃	91	1.55 (6H, s, Me), 2.55 (3H, s, Me), 3.15 (2H, s, CH ₂), 6.4 (1H, s, CH).
4.04	2	H	F	1	N- CH ₃	CF ₃	H	117- 118	1.55 (3H, s, Me), 1.56 (3H, s, Me), 3.17 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 4.01 (3H, s, Me), 6.51 (1H, d, J = 44 Hz, CH), 7.77 (1H, s, CH).
4.05	2	F	F	1	N- CH ₃	CF ₃	H	101- 103	1.56 (6H, s, Me), 3.19 (2H, s, CH ₂), 4.03 (3H, s, Me), 7.81 (1H, s, CH).

キー：

Me=メチル；s=単項；d=二重項

表31：式1.7の化合物



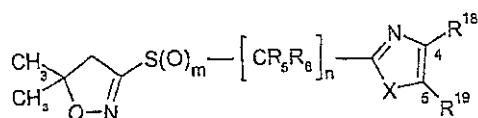
【表 6 6】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	X	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
5.01	2	H	Cl	1	O	OCH ₃	H		1.53 (3H, s, Me), 1.54 (3H, s, Me), 3.06 (1H, d, CH ₂), 3.13 (1H, d, CH ₂), 4.0 (3H, s, Me), 6.04 (1H, s, CH), 6.39 (1H, s, CH).
5.02	2	Cl	Cl	1	O	OCH ₃	H	118	1.55 (6H, s, Me), 3.11 (2H, s, CH ₂), 4.01 (3H, s, Me), 6.49 (1H, s, CH).
5.03	2	H	F	1	O	OCH ₃	H	99	1.545 (3H, s, Me), 1.55 (3H, s, Me), 3.1 (1H, d, CH ₂), 3.175 (1H, d, CH ₂), 4.02 (3H, s, Me), 6.41 (1H, d, CH), 6.43 (1H, s, CH).
5.04	2	F	F	1	O	OCH ₃	H		1.57 (6H, s, Me), 3.14 (2H, s, CH ₂), 4.05 (3H, s, Me), 6.55 (1H, s, CH).
5.05	2	F	Cl	1	O	OCH ₃	H		1.55 (3H, s, Me), 1.56 (3H, s, Me), 3.09 (1H, d, CH ₂), 3.175 (1H, d, CH ₂), 4.01 (3H, s, Me), 6.49 (1H, s, CH).
5.06	2	F	F	1	O	Br	CH ₃	70-75	3.14 (2H, s, CH ₂), 2.23 (3H, t, J = 1.9 Hz, Me), 1.57 (6H, s, Me).

キー：

Me=メチル；s=単項；d=二重項

表32：式1. 8の化合物



【表 6 7】

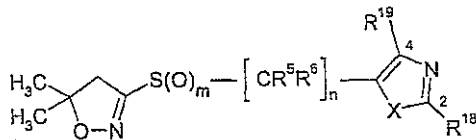
No.	m	R ⁵	R ⁶	n	X	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
6.01	2	F	F	1	N- CH ₃	H	H		1.54 (6H, s, Me), 3.14 (2H, s, CH ₂), 3.94 (3H, m, Me), 7.13 (1H, d, CH), 7.28 (1H, d, CH).

10

キー：

Me=メチル；s=単項；m=多重項；d=二重項

表33：式1. 9の化合物



No.	m	R ⁵	R ⁶	n	X	R ¹⁸	R ¹⁹	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
7.01	2	F	F	1	S	CF ₃	-OC ₂ H ₅	95- 97	1.47 (3H, t, Me), 1.55 (6H, s, Me), 3.16 (2H, s, CH ₂), 4.59 (2H, q, CH ₂).
7.02	2	F	F	1	S	C ₂ H ₅	-CH ₂ OCH ₃		1.35 (3H, t, Me), 1.60 (6H, s, Me), 2.98 (2H, q, CH ₂), 3.20 (2H, s, CH ₂), 3.58 (3H, s, Me), 4.77 (2H, s, CH ₂).

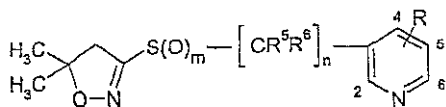
20

30

キー：

Me=メチル；s=単項；t=三重項；q=四重項

表34：式1. 10の化合物



40

【表 6 8】

No.	m	R ⁵	R ⁶	n	R	M.p. [°C]	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃)
8.01	2	H	Cl	1	2-Cl		1.54 (6H, s, Me), 3.06 (1H, d, CH ₂), 3.18 (1H, d, CH ₂), 6.64 (1H, s, CH), 7.42 (1H, dd, CH), 8.24 (1H, dd, CH), 8.52 (1H, dd, CH).
8.02	2	H	F	1	2-Cl		1.56 (3H, s, Me), 1.57 (3H, s, Me), 3.16 (1H, d, CH ₂), 3.20 (1H, d, CH ₂), 6.98 (1H, s, CH), 7.43 (1H, dd, CH), 8.08 (1H, dd, CH), 8.57 (1H, dd, CH).
8.03	2	Cl	F	1	2-Cl		1.54 (3H, s, Me), 1.57 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.25 (1H, d, CH ₂), 7.43 (1H, dd, CH), 8.20 (1H, dd, CH), 8.58 (1H, dd, CH).
8.04	2	F	F	1	2-Cl		1.58 (6H, s, Me), 3.21 (2H, s, CH ₂), 7.46 (1H, dd, CH), 8.07 (1H, dd, CH), 8.64 (1H, dd, CH).
8.05	2	H	F	1	2-Me, 6-CF ₃		1.56 (3H, s, Me), 1.58 (3H, s, Me), 2.82 (3H, s, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.22 (1H, d, CH ₂), 6.78 (1H, d, CH), 7.68 (1H, d, CH), 8.10 (1H, d, CH).
8.06	2	H	Cl	1	2-Me, 6-CF ₃		1.52 (3H, s, Me), 1.57 (3H, s, Me), 2.82 (3H, s, Me), 3.12 (1H, d, CH ₂), 3.20 (1H, d, CH ₂), 6.40 (1H, s, CH), 7.67 (1H, d, CH), 8.26 (1H, d, CH).
8.07	2	F	F	1	2-Me, 6-CF ₃		1.59 (6H, s, Me), 2.92 (3H, t, Me), 3.21 (2H, s, CH ₂), 7.68 (1H, d, CH), 8.10 (1H, d, CH).
8.08	2	Cl	F	1	2-Me, 6-CF ₃		1.57 (3H, s, Me), 1.58 (3H, s, Me), 2.93 (3H, d, Me), 3.15 (1H, d, CH ₂), 3.26 (1H, d, CH ₂), 7.67 (1H, d, CH), 8.21 (1H, d, CH).

【0 5 2 4】

キー：

Me=メチル；s=単項；d=二重項；dd=二重の二重項。

【0 5 2 5】

生物での実施例

【0526】

実施例B1：除草作用

【0527】

試験用の単子葉植物と双子葉植物を種子トレイの中に入れた標準的な土に播いた。種を播いた直後（発芽前）、または8～9日間にわたって栽培した後（発芽後）、水溶液の形態にした試験用化合物をスプレーで施用した。この水溶液は、0.6mlのアセトンと45mlの調合溶液の中に本発明の活性成分が含まれた調合剤をもとにしており、調合溶液は、10.6%のEmulsogen EL（CAS RN 61791-12-6）と、42.2%のN-メチルピロリドンと、42.2%のジプロピレングリコールモノメチルエーテル（CAS RN 34590-94-8）と、0.2%のX-77（CAS RN 11097-66-8）とを含んでいる。次に、試験用植物を温室の中で最適な条件下で生長させた。試験期間の3週間が過ぎた後（発芽後の期間）または4週間が過ぎた後（発芽前からの期間）、試験結果を評価した（10=完全にダメージを受けた植物、0=まったくダメージを受けていない植物）。

【0528】

【表69】

表B1a：発芽後の施用

Comp. No.	[g/ha]	ネコジャラシ	ヌカヒ	メシバ	シダ	アブチン	アマランス
1.02	250	7	10	6	5	0	9
1.03	250	-	9	6	5	0	9
1.07	250	7	7	5	2	5	3
1.14	250	3	0	3	3	4	-
1.19	250	5	5	6	2	6	5
1.20	250	6	0	6	5	7	3
1.21	250	7	9	7	5	7	-
1.24	250	6	6	6	-	-	-
1.25	250	3	3	4	4	5	-
1.26	250	5	3	4	-	4	-
1.27	250	3	5	2	4	4	-

【表 7 0】

Comp. No.	[g/ha]	ネコジヤラン	ヌカキ	メシハ	シダ	アブチロソ	アマランサス
1.31	250	0	7	1	7	3	-
1.34	250	6	8	5	3	3	5
1.53	250	7	7	7	2	5	7
1.55	250	7	5	6	3	5	3
1.61	250	6	4	7	3	3	0
1.62	250	6	8	7	5	4	2
1.63	250	7	7	7	4	4	3
1.65	250	5	7	8	2	2	0
1.66	250	7	5	8	5	8	5
1.67	250	5	3	-	4	4	3
1.69	250	7	5	8	5	4	3
1.70	250	7	5	8	5	5	2
1.71	250	3	0	8	2	0	5
1.72	250	8	7	7	0	3	8
1.74	250	3	5	8	3	0	0
1.75	250	5	5	8	4	5	3
1.76	250	5	5	-	5	5	3
1.77	250	6	5	8	3	5	0
1.80	250	7	5	8	5	4	0
1.83	250	7	7	9	3	5	5
1.92	250	7	5	8	7	5	3
1.93	250	3	8	7	2	3	7
1.94	250	8	7	8	0	5	7
1.95	250	3	7	8	2	0	0
1.96	250	3	5	8	2	5	0
1.97	250	7	5	8	0	4	5
1.102	250	4	5	8	2	0	0
1.104	250	7	7	8	2	3	0
1.105	250	4	5	8	7	2	5
1.107	250	5	7	8	5	4	0

10

20

30

40

【表 7 1】

Comp. No.	[g/ha]	ネジヤラシ	ヌカヒ	ヒシバ	シダ	アブチロシ	アマランサス
1.108	250	5	5	8	8	7	8
1.109	250	3	5	6	2	6	5
1.113	250	7	3	8	4	2	0
1.114	250	8	3	8	2	3	3
1.115	250	7	8	8	0	2	5
1.116	250	7	7	8	0	5	5
1.117	250	6	5	7	6	4	7
1.118	250	7	5	8	3	5	3
1.119	250	7	7	3	4	3	5
1.120	250	4	3	8	0	7	0
1.125	250	5	7	8	3	0	0
1.126	250	5	5	8	5	3	0
1.128	250	3	7	4	0	2	5
1.132	250	5	8	8	0	3	3
1.133	250	5	7	8	4	0	5
1.142	250	5	7	8	3	0	0
1.143	250	6	7	7	2	3	7
1.144	250	7	7	8	5	3	3
1.146	250	6	5	8	2	5	3
1.147	250	0	8	7	0	2	3
1.148	250	8	8	8	2	0	7
1.149	250	3	5	5	5	4	4
2.01	250	5	5	7	6	8	5
2.03	250	7	7	7	6	7	0
2.04	250	6	8	4	6	7	4
2.05	250	0	7	3	3	4	0
2.09	250	7	8	8	2	7	7
2.10	250	5	7	6	4	6	8
2.11	250	7	7	7	7	7	5
2.12	250	7	7	6	6	6	0

10

20

30

40

【表 7 2】

Comp. No.	[g/ha]	ネコジヤラン	ヌカヒ	ヒシバ	シダ	アブチロン	アマランサス
2.13	250	8	7	5	7	6	7
2.14	250	4	7	7	7	7	8
2.15	250	4	2	6	4	4	0
2.16	250	8	0	4	7	7	8
8.01	250	0	3	0	3	3	0
8.02	250	3	3	6	3	2	0
8.03	250	4	6	7	0	4	0
8.04	250	2	3	50	0	3	50

10

表 B1b : 発芽前の施用

Comp. No.	[g/ha]	ネコジヤラン	ヌカヒ	ヒシバ	シダ	アマランサス
1.01	250	8	8	7	0	2
1.02	250	3	6	-	0	-
1.04	250	2	5	7	0	0
1.06	250	9	10	5	7	10
1.07	250	10	10	10	7	8
1.14	250	9	9	9	6	8
1.15	250	8	10	9	0	10
1.16	250	4	5	4	0	0
1.19	250	10	10	10	6	10
1.20	250	10	10	10	9	10
1.21	250	10	10	10	9	10
1.23	250	7	10	4	0	7
1.24	250	7	10	8	4	8
1.25	250	10	10	10	3	10
1.26	250	10	10	9	4	10
1.27	250	5	9	4	2	7
1.29	250	7	7	3	0	2

20

30

40

【表 7 3】

Comp. No.	[g/ha]	ネコシ ャラシ	ヌカヒ	ヒシバ	シダ	アマランサス
1.30	250	9	10	9	2	0
1.31	250	7	9	9	0	0
1.33	250	7	10	8	0	0
1.34	250	10	10	9	7	9
1.37	250	9	9	9	5	0
1.39	250	3	7	7	0	3
1.46	250	3	5	6	0	3
1.50	250	10	10	9	7	10
1.51	250	8	9	9	0	8
1.53	250	10	10	10	5	9
1.54	250	8	8	8	0	0
1.55	250	10	10	10	5	9
1.57	250	8	10	8	6	9
1.58	250	7	9	8	3	5
1.60	250	9	10	9	0	7
1.61	250	10	10	10	7	10
1.62	250	10	10	9	8	10
1.63	250	10	10	10	8	10
1.65	250	10	10	10	8	10
1.66	250	10	10	10	9	10
1.67	250	10	10	10	9	10
1.69	250	10	10	10	4	5
1.70	250	10	10	10	8	10
1.71	250	9	10	9	5	10
1.72	250	10	10	10	6	10
1.73	250	10	10	10	8	10
1.74	250	9	10	9	7	5
1.75	250	10	10	10	7	10
1.76	250	8	10	9	3	9
1.77	250	10	10	10	7	10

10

20

30

40

【表 7 4】

Comp. No.	[g/ha]	ネコジ ャラシ	ヌカヒ	ヒシハ	シダ	アマランサス
1.78	250	10	10	10	2	10
1.79	250	10	10	10	6	8
1.80	250	10	10	10	9	10
1.81	250	5	8	6	0	9
1.82	250	9	10	9	0	10
1.83	250	9	10	9	0	9
1.84	250	9	10	9	0	10
1.87	250	7	5	7	0	3
1.90	250	0	0	4	5	4
1.91	250	9	-	10	10	3
1.92	250	10	10	10	8	10
1.93	250	10	10	10	6	8
1.94	250	10	10	10	8	10
1.95	250	10	10	10	7	7
1.96	250	10	10	10	4	9
1.97	250	9	10	10	0	8
1.98	250	9	9	8	4	7
1.101	250	8	8	8	0	9
1.102	250	9	10	10	2	8
1.103	250	5	9	9	0	3
1.104	250	8	10	9	3	0
1.105	250	10	10	8	7	10
1.106	250	6	8	7	0	3
1.107	250	10	9	7	0	9
1.108	250	10	10	10	9	10
1.109	250	9	10	10	0	10
1.113	250	10	10	9	0	8
1.114	250	10	10	10	9	10
1.115	250	10	10	10	8	10
1.116	250	10	10	10	7	10

10

20

30

40

【表 7 5】

Comp. No.	[g/ha]	ネコジ ャラシ	ヌカキヒ	メシハ	シダ	アマランサス
1.117	250	8	10	10	4	9
1.118	250	10	10	10	8	10
1.120	250	0	8	6	5	8
1.125	250	10	10	10	7	10
1.126	250	10	10	10	8	10
1.132	250	10	10	10	4	10
1.133	250	10	10	10	6	10
1.134	250	9	10	10	0	5
1.135	250	9	10	10	0	7
1.139	250	7	0	8	0	0
1.141	250	9	9	9	0	5
1.143	250	10	10	10	7	7
1.144	250	10	10	10	8	10
1.145	250	10	10	10	7	10
1.146	250	10	10	10	5	8
1.147	250	9	10	10	0	5
1.148	250	10	10	10	6	10
1.150	250	9	10	10	0	6
1.151	250	7	8	0	4	5
2.01	250	10	10	10	9	10
2.03	250	10	10	10	8	10
2.04	250	10	10	10	8	10
2.05	250	10	10	9	8	5
2.06	250	7	8	8	3	7
2.08	250	-	9	2	2	4
2.09	250	10	10	10	8	10
2.10	250	10	10	10	8	10
2.11	250	10	10	10	9	10
2.12	250	10	10	10	8	10
2.13	250	10	10	10	7	10

10

20

30

40

【表 7 6】

Comp. No.	[g/ha]	ネコジヤラン	ヌカヒ	ヒシバ	シダ	アマランサス
2.14	250	10	10	10	9	10
2.15	250	10	10	10	8	10
2.16	250	10	10	10	7	10
2.17	250	8	8	8	5	10
2.21	250	10	10	10	8	10
2.23	250	9	8	7	3	8
2.24	250	10	-	10	5	10
2.32	250	4	7	4	0	7
2.35	250	5	9	10	0	10
3.01	250	7	10	8	0	7
3.02	250	10	10	10	0	7
3.03	250	10	10	9	0	7
3.04	250	9	10	9	0	3
3.07	250	8	-	9	2	4
4.01	250	8	8	8	8	8
4.02	250	7	10	8	0	10
4.03	250	10	-	10	7	9
5.01	250	8	-	8	2	0
5.03	250	9	-	-	2	10
8.01	250	5	8	8	0	5
8.02	250	8	10	9	0	7
8.03	250	8	10	10	6	8
8.04	250	10	10	10	3	10

10

20

30

【0529】

実施例B2：除草作用

【0530】

試験用の単子葉植物と双子葉植物を種子トレイの中に入れた殺菌した標準的な土に播いた。それぞれのトレイは96個のセルを有する。人工気象室の中で制御条件（19/24℃で散布した後；17/23℃で栽培；13時間照明；湿度50～60％）のもとで1日後（発芽前）または8～9日間にわたって栽培した後（発芽後）、1000mg/リットルの活性成分を含むスプレー水溶液で植物を処理した（散布率：500g/リットル；溶媒として10％のDMSOを含む）。人工気象室の中で植物を9～13日間にわたって生長させた後、試験結果を評価した（10=完全にダメージを受けた植物、0=まったくダメージを受けていない植物）。

【0531】

40

【表 7 7】

表 B 2a : 発芽後の施用

Comp. No.	[g/ha]	アグロリス	ホア	ネコジヤシ	アマゾンサス
1.06	1000	8	8	7	8
1.07	1000	8	8	7	7
1.32	1000	8	8	6	6
1.34	1000	8	8	8	5

10

表 B 2b : 発芽前の施用

Comp. No.	[g/ha]	メシバ	アグロリス	ホア	ネコジヤシ
1.01	1000	9	10	10	9
1.02	1000	9	8	5	9
1.06	1000	10	10	10	10
1.07	1000	10	10	10	10
1.08	1000	8	7	9	3
1.14	1000	9	10	10	10
1.15	1000	9	2	10	9
1.19	1000	9	10	10	9
1.20	1000	10	10	10	10
1.21	1000	10	10	10	9
1.23	1000	8	10	10	8
1.24	1000	10	10	10	9
1.25	1000	9	10	10	8
1.26	1000	10	10	10	9

20

30

【表 7 8】

Comp. No.	[g/ha]	メシバ	アグロリス	ホア	ネジヤラシ
1.27	1000	9	10	9	9
1.29	1000	9	10	8	4
1.30	1000	10	10	10	10
1.31	1000	9	9	9	10
1.37	1000	9	10	10	9
1.39	1000	5	10	10	3
1.45	1000	8	7	10	6
1.48	1000	9	10	10	8
1.59	1000	8	9	10	9
1.100	1000	7	5	9	3
2.02	1000	9	10	10	10

10

20

【0 5 3 2】

実施例E1：トウモロコシに対する発芽前の安全性試験

【0 5 3 3】

試験用植物を温室条件下で種子トレイの中に入れた標準的な土に播いた。栽培用の土として標準的な土を用いた。発芽前の段階で、除草剤そのものと、除草剤と毒性緩和剤の混合物の両方を、土の表面に散布した。25%の湿潤化可能な粉末（WO 97/34485の実施例F3、b）、または懸濁濃縮液（WO 97/34485の実施例F8）から調製した試験物質の水性懸濁液を散布し、畑の場合に換算して200リットル/haになるようにした。14日後に試験結果を評価した（100%=完全に枯れた植物、0%=植物に対する生長阻害作用なし）。

30

【0 5 3 4】

【表 7 9】

表E1：トウモロコシ（マリスタ）に対して発芽前に使用したときの毒性緩和剤の作用

化合物1. 07 湿潤化可能な粉末25 % AW/W 400 200 (g/ha)	化合物1. 07 湿潤化可能な粉末25 % AW/W 400 200 (g/ha) ベノキサコール 湿潤化可能な粉末25 % AW/W 100 50 (g/ha)	化合物1. 07 湿潤化可能な粉末25 % AW/W 400 200 (g/ha) ジクロルミド EC 250 GA/L 100 50 (g/ha)	化合物1. 07 湿潤化可能な粉末25 % AW/W 400 200 (g/ha) フリラゾール 湿潤化可能な粉末5% AW/W 100 50 (g/ha)
27.5 20 (%)	5 0 (%)	0 0 (%)	0 0 (%)

40

【0 5 3 5】

【表 8 0】

化合物2. 04 湿潤化可能な粉末25% AW/W 200 100 (g/ha)	化合物2. 04 湿潤化可能な粉末25% AW/W 200 100 (g/ha) ベノキサコール 湿潤化可能な粉末25% AW/W 50 25 (g/ha)	化合物2. 04 湿潤化可能な粉末25% AW/W 200 100 (g/ha) ジクロルミド EC 250 GA/L 50 25 (g/ha)	化合物2. 04 湿潤化可能な粉末25% AW/W 200 100 (g/ha) フリラゾール 湿潤化可能な粉末5% AW/W 50 25 (g/ha)
15 10 (%)	2. 5 0 (%)	5 5 (%)	0 0 (%)

10

【0 5 3 6】

【表 8 1】

表E2：トウモロコシ（ロレンゾ）に対して発芽前に使用したときの毒性緩和剤の作用

化合物1. 07 湿潤化可能な粉末25% AW/W 400 200 (g/ha)	化合物1. 07 湿潤化可能な粉末25% AW/W 400 200 (g/ha) ベノキサコール 湿潤化可能な粉末25% AW/W 100 50 (g/ha)	化合物1. 07 湿潤化可能な粉末25% AW/W 400 200 (g/ha) ジクロルミド EC 250 GA/L 100 50 (g/ha)	化合物1. 07 湿潤化可能な粉末25% AW/W 400 200 (g/ha) フリラゾール 湿潤化可能な粉末5% AW/W 100 50 (g/ha)
30 2. 5 (%)	0 0 (%)	2. 5 0 (%)	0 0 (%)

20

【0 5 3 7】

【表 8 2】

化合物2. 04 湿潤化可能な粉末25% AW/W 200 100 (g/ha)	化合物2. 04 湿潤化可能な粉末25% AW/W 200 100 (g/ha) ベノキサコール 湿潤化可能な粉末25% AW/W 50 25 (g/ha)	化合物2. 04 湿潤化可能な粉末25% AW/W 200 100 (g/ha) ジクロルミド EC 250 GA/L 50 25 (g/ha)	化合物2. 04 湿潤化可能な粉末25% AW/W 200 100 (g/ha) フリラゾール 湿潤化可能な粉末5% AW/W 50 25 (g/ha)
17. 5 2. 5 (%)	0 0 (%)	7. 5 0 (%)	2. 5 0 (%)

30

40

【0 5 3 8】

試験物質は優れた結果を示した。同じ結果が、一般式（I）の化合物をWO 97/34485の他の実施例に従って調合した場合に得られた。

【0 5 3 9】

実施例F1：トウモロコシに対する発芽後の安全性試験

【0 5 4 0】

50

試験用植物を温室条件下で容器に播いた。栽培用の土として標準的な土を用いた。トウモロコシの葉が1枚の生長段階（GS11）において、除草剤そのものと、除草剤と毒性緩和剤の混合物の両方を、土と葉の表面に散布した。25%の湿潤化可能な粉末（WO 97/34485の実施例F3、b）、または懸濁濃縮液（WO 97/34485の実施例F8）から調製した試験物質の水性懸濁液を施用し、畑の場合に換算して200リットル/haになるようにした。28日後に試験結果を評価した（100%=完全に枯れた植物、0%=植物に対する生長阻害作用なし）。

【0541】

【表83】

表F1：トウモロコシ（マリスタ11f）に対して発芽後に使用したときの毒性緩和剤の作用

化合物2.10 湿潤化可能な粉末25% AW/W 150 75 37.5 (g/ha)	化合物2.10 湿潤化可能な粉末25% AW/W 150 75 37.5 (g/ha) ベノキサコール 湿潤化可能な粉末25% AW/W 37.5 19 9.5 (g/ha)
75 50 20 (%)	10 0 0 (%)

10

20

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		Inter- nal Application No PCT/GB2005/003228
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER C07D261/10 C07D413/12 C07D417/12 A01N43/80		
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) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EP0-Internal, PAJ, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 1 203 768 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO.) 8 May 2002 (2002-05-08) cited in the application Table 16, compounds 1-371-1-376; Table 19, compounds 1-449, 1-450, 1-453, 1-454; claims	1-11
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1997, no. 01, 31 January 1997 (1997-01-31) & JP 08 225548 A (SANKYO), 3 September 1996 (1996-09-03) abstract; table 1	1-11
Y	EP 1 364 946 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO.) 26 November 2003 (2003-11-26) claims; table 18	1-11
-/-		
☒ Further documents are listed in the continuation of box C. ☒ Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document 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 7 December 2005		Date of mailing of the international search report 15/12/2005
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Helps, I

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter nal Application No
PCT/GB2005/003228

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 03/010165 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO.) 6 February 2003 (2003-02-06) tables -----	1-11
P, Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 2005, no. 12, 5 December 2003 (2003-12-05) & JP 2005 035924 A (IHARA CHEMICAL INDUSTRIES CO.), 10 February 2005 (2005-02-10) abstract; tables -----	1-11
Y	EP 1 405 853 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO.) 7 April 2004 (2004-04-07) claims; examples -----	1-11
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1998, no. 04, 31 March 1998 (1998-03-31) & JP 09 328483 A (SANKYO), 22 December 1997 (1997-12-22) abstract; tables -----	1-11

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/GB2005/003228

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 1203768	A	08-05-2002	AU 769834 B2	05-02-2004
			AU 6472500 A	13-03-2001
			BR 0013251 A	16-04-2002
			CA 2380499 A1	22-02-2001
			CN 1368965 A	11-09-2002
			CZ 20020461 A3	15-05-2002
			HU 0202799 A2	28-01-2003
			WO 0112613 A1	22-02-2001
			RU 2237664 C2	10-10-2004
			US 6841519 B1	11-01-2005
			ZA 200200392 A	16-01-2003
JP 08225548	A	03-09-1996	NONE	
EP 1364946	A	26-11-2003	BR 0207025 A	17-02-2004
			CA 2438547 A1	15-08-2002
			CN 1491217 A	21-04-2004
			CN 1673221 A	28-09-2005
			CZ 20032148 A3	17-12-2003
			HU 0400723 A2	30-08-2004
			WO 02062770 A1	15-08-2002
			NZ 527032 A	29-07-2005
			SK 10052003 A3	04-05-2004
			US 2004110749 A1	10-06-2004
WO 03010165	A	06-02-2003	NONE	
JP 2005035924	A	10-02-2005	NONE	
EP 1405853	A	07-04-2004	WO 03000686 A1	03-01-2003
			US 2004259734 A1	23-12-2004
JP 09328483	A	22-12-1997	NONE	

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 261/10	(2006.01)	C 0 7 D 261/10	
A 0 1 P 13/00	(2006.01)	A 0 1 P 13/00	
A 0 1 N 43/80	(2006.01)	A 0 1 N 43/80	1 0 1
		A 0 1 N 43/80	1 0 2

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LS,MW,MZ,NA,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,NL,PL,PT,RO,SE,SI,SK,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KM,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,L S,LT,LU,LV,MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PG,PH,PL,PT,RO,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,SY,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,YU,ZA,ZM,ZW

(74)代理人 100117019

弁理士 渡辺 陽一

(72)発明者 プラント, アンドリュウ

イギリス国, アールジー 4 2 6 イーワイ, バークシャー, ブラックネル, ジェーロッツ ヒル
インターナショナル リサーチ センター, シンジェンタ リミテッド

(72)発明者 ベーマー, ユッタ エリザベート

イギリス国, アールジー 4 2 6 イーワイ, バークシャー, ブラックネル, ジェーロッツ ヒル
インターナショナル リサーチ センター, シンジェンタ リミテッド

(72)発明者 ブラック, ジャニス

イギリス国, アールジー 4 2 6 イーワイ, バークシャー, ブラックネル, ジェーロッツ ヒル
インターナショナル リサーチ センター, シンジェンタ リミテッド

(72)発明者 スパークス, ティモシー デイビッド

イギリス国, アールジー 4 2 6 イーワイ, バークシャー, ブラックネル, ジェーロッツ ヒル
インターナショナル リサーチ センター, シンジェンタ リミテッド

F ターム (参考) 4C056 AA01 AB01 AC01 AD01 AE02 AE03 AF04 FA03 FA07 FB01

FB03 FB07 FC01

4C063 AA01 AA03 BB08 CC51 CC61 CC72 DD22 DD51 EE03

4H011 AB01 BB10

【要約の続き】

させる方法、を請求の範囲とする。

