

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第4411582号

(P4411582)

(45) 発行日 平成22年2月10日 (2010. 2. 10)

(24) 登録日 平成21年11月27日 (2009. 11. 27)

(51) Int. Cl.

F 1

C O 7 C 311/46 (2006. 01)

C O 7 C 311/46

A O 1 N 41/06 (2006. 01)

A O 1 N 41/06

Z

A O 1 N 47/02 (2006. 01)

A O 1 N 47/02

A O 1 P 7/04 (2006. 01)

A O 1 P 7/04

C O 7 D 213/75 (2006. 01)

C O 7 D 213/75

請求項の数 3 (全 46 頁)

(21) 出願番号 特願2003-208687 (P2003-208687)
 (22) 出願日 平成15年8月25日 (2003. 8. 25)
 (65) 公開番号 特開2004-143147 (P2004-143147A)
 (43) 公開日 平成16年5月20日 (2004. 5. 20)
 審査請求日 平成18年8月1日 (2006. 8. 1)
 (31) 優先権主張番号 特願2002-245264 (P2002-245264)
 (32) 優先日 平成14年8月26日 (2002. 8. 26)
 (33) 優先権主張国 日本国 (JP)

(73) 特許権者 000232623
 日本農薬株式会社
 東京都中央区日本橋 1 丁目 2 番 5 号
 (74) 代理人 100068618
 弁理士 粁 経夫
 (74) 代理人 100093193
 弁理士 中村 壽夫
 (74) 代理人 100104145
 弁理士 宮崎 嘉夫
 (72) 発明者 山口 実
 大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農
 薬株式会社総合研究所内
 (72) 発明者 中尾 勇美
 大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農
 薬株式会社総合研究所内

最終頁に続く

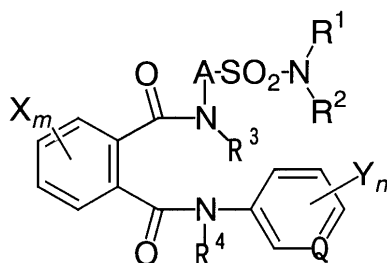
(54) 【発明の名称】 スルホンアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I)

【化 1】



(I)

(式中、AはC₁－C₆アルキレン基を示す。

R¹は水素原子、C₁－C₆アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、C₁－C₆アルコキシ基、ハロC₁－C₆アルコキシ基、C₁－C₆アルキルチオ基、ハロC₁－C₆アルキルチオ基、C₁－C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁－C₆アルキルスルフィニル基、C₁－C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁－C₆アルキルスルホニル基、モノC₁－C₆アルキルアミノ基、モノ（ハロC₁－C₆アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC₁－C₆アルキルアミノ基、同

一又は異なっても良いジ（ハロC₁－C₆アルキル）アミノ基、C₁－C₆アルコキシカルボニル基、C₁－C₆アルキルアミノカルボニル基、C₁－C₆アルキルカルボニルオキシ基、フェニルチオ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁－C₆アルキル基、ハロC₁－C₆アルキル基、C₁－C₆アルコキシ基、ハロC₁－C₆アルコキシ基、モノC₁－C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁－C₆アルキルアミノ基、C₁－C₆アルキルチオ基、ハロC₁－C₆アルキルチオ基、C₁－C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁－C₆アルキルスルフィニル基、C₁－C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁－C₆アルキルスルホニル基又はC₁－C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基又はピリジル基から選択される1以上の置換基を有する置換C₁－C₆アルキル基、C₃－C₆アルケニル基、ハロC₃－C₆アルケニル基、C₃－C₆アルキニル基又はハロC₃－C₆アルキニル基を示す。

10

R²、R³及びR⁴は同一又は異なっても良く、水素原子、C₁－C₆アルキル基、C₃－C₆アルケニル基、C₃－C₆アルキニル基、C₁－C₄アルコキシC₁－C₄アルキル基又はC₁－C₄アルキルチオC₁－C₄アルキル基を示し、又、R²はR¹と結合して、1～3個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い3～8員環を形成することができる。

Qは炭素原子又は窒素原子を示す。

Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、C₁－C₆アルキル基、ハロC₁－C₆アルキル基、C₂－C₆アルケニル基、ハロC₂－C₆アルケニル基、C₂－C₆アルキニル基、ハロC₃－C₆アルキニル基、C₁－C₆アルコキシ基、ハロC₁－C₆アルコキシ基、C₁－C₆アルキルカルボニルオキシ基、ハロC₁－C₆アルキルカルボニルオキシ基、C₁－C₆アルキルチオ基、ハロC₁－C₆アルキルチオ基、C₁－C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁－C₆アルキルスルフィニル基、C₁－C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁－C₆アルキルスルホニル基、C₁－C₆アルキルスルホニルオキシ基又はハロC₁－C₆アルキルスルホニルオキシ基を示し、mは0～2の整数を示す。

20

Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、C₁－C₆アルキル基、ハロC₁－C₆アルコキシC₁－C₆アルキル基、ハロC₁－C₆アルキル基、ヒドロキシハロC₁－C₆アルキル基、C₁－C₆アルコキシハロC₁－C₆アルキル基、ハロC₁－C₆アルコキシハロC₁－C₆アルキル基、C₁－C₆アルコキシ基、ハロC₁－C₆アルコキシ基、ハロC₁－C₆アルコキシハロC₁－C₆アルコキシ基、C₁－C₆アルキルチオ基、ハロC₁－C₆アルキルチオ基、C₁－C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁－C₆アルキルスルフィニル基、C₁－C₆アルキルスルホニル基又はハロC₁－C₆アルキルスルホニル基を示し、nは0～3の整数を示す。）

30

で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類。

【請求項2】

請求項1記載の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

【請求項3】

40

有用植物から害虫を防除するため請求項2記載の農園芸用殺虫剤の有効量を対象作物植物体、土壌又は水田に処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明はスルホンアミド誘導体又はその塩類及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

【0002】

【従来技術】

従来、本発明のスルホンアミド誘導体に類似した化合物が農園芸用殺虫剤として有用であ

50

ることが知られている（例えば、特許文献1又は2参照。）。しかしながら、本発明の一般式（I）で表される化合物についての実施例、物性等は示されていない。

【特許文献1】

特開平11-240857号公報

【特許文献2】

特開2001-131141号公報

【0003】

【発明が解決しようとする課題】

農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤の開発が望まれている。又、就農者の老齢化等により各種の省力的施用方法が求められるとともに、これらの施用方法に適した性格を有する農園芸用殺虫剤の創出が求められている。

10

【0004】

【課題を解決するための手段】

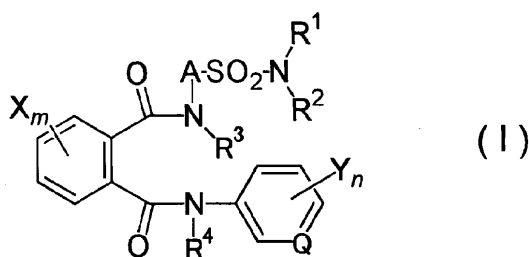
本発明者等は新規な農園芸用殺虫剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類が文献未記載の新規化合物であり、上記従来文献に記載される類似の化合物に対し、低薬量で効果を示す優れた農園芸用殺虫剤であることを見出し、本発明を完成させたものである。

【0005】

即ち、本発明は、一般式（I）

20

【化2】



(I)

30

{式中、Aは C_1 - C_6 アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換 C_1 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換 C_3 - C_6 アルケニレン基、 C_3 - C_6 アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換 C_3 - C_6 アルキニレン基を示す。又、 C_1 - C_6 アルキレン基、置換 C_1 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基、置換 C_3 - C_6 アルケニレン基、 C_3 - C_6 アルキニレン基又は置換 C_3 - C_6 アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は C_2 - C_5 アルキレン基で置換されて C_3 - C_6 シクロアルカン環を示すこともでき、 C_2 - C_6 アルキレン基、置換 C_2 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基又は

40

50

置換 C_3 - C_6 アルケニレン基中の任意の2個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒にあって C_3 - C_6 シクロアルカン環又は C_3 - C_6 シクロアルケン環を示すこともできる。

【0006】

R^1 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ（ハロ C_1 - C_6 アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ C_1 - C_6 アルキル）アミノ基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、

【0007】

ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基から選択される1以上の置換基を有する置換 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、ハロ C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、水酸基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、アミノ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ（ハロ C_1 - C_6 アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ C_1 - C_6 アルキル）アミノ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ（ハロ C_1 - C_6 アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ C_1 - C_6 アルキル）アミノ基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基又は C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6

アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基又はC₁-C₆アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換ベンゾイルアミノ基、

【0008】

—N=C(T¹)T²（式中、T¹及びT²は同一又は異なっても良く、水素原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基又はC₁-C₆アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。）

【0009】

フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基又はC₁-C₆アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基を示す。

【0010】

R²、R³及びR⁴は同一又は異なっても良く、水素原子、C₁-C₆アルキル基、C₃-C₆アルケニル基、C₃-C₆アルキニル基、C₁-C₄アルコキシC₁-C₄アルキル基又はC₁-C₄アルキルチオC₁-C₄アルキル基を示す。又、R²はA又はR¹と結合して、1～3個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い3～8員環を形成することができる。該3～8員環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、C₁-C₆アルキル基又はC₁-C₆アルコキシ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、R²はR¹と一緒に= C(T³)T⁴（式中、T³及びT⁴は同一又は異なっても良く、水素原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、アミノ基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ

10

20

30

40

50

基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基又はC₁-C₆アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。）を示すことができる。

【0011】

Qは炭素原子又は窒素原子を示す。

Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₂-C₆アルケニル基、ハロC₂-C₆アルケニル基、C₂-C₆アルキニル基、ハロC₃-C₆アルキニル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ基、ハロC₁-C₆アルキルカルボニルオキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、C₁-C₆アルキルスルホニルオキシ基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニルオキシ基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、C₁-C₆アルキルカルボニルアミノ基、ハロC₁-C₆アルキルカルボニルアミノ基、C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基又はハロC₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基を示す。

【0012】

又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。mは0～2の整数を示す。

【0013】

Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、ホルミル基、C₁-C₆アルキル基、ヒドロキシC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、ヒドロキシハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシハロC₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルコキシハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルコキシハロC₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルコキシハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルコキシハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロC₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、

【0014】

フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基又はハロC₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフ

ィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基を示す。

【0015】

又、芳香環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ（ハロ C_1 - C_6 アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ（ハロ C_1 - C_6 アルキル）アミノ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。nは0～3の整数を示す。}

で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

【0016】

【発明の実施の形態】

本発明のスルホンアミド誘導体の一般式（I）の定義において「ハロゲン原子」とは塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示し、「 C_1 - C_6 アルキル」とは、例えばメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「ハロ C_1 - C_6 アルキル」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「 C_3 - C_6 シクロアルキル」とは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の炭素原子3～6個からなる環状のアルキル基を示し、「 C_1 - C_6 アルキレン」とはメチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、ジメチルメチレン、テトラメチレン、イソブチレン、ジメチルエチレン等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキレン基を示し、「 C_2 - C_6 アルケニレン」とは直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルケニレン基を示し、「 C_2 - C_6 アルキニレン」とは直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルキニレン基を示す。

【0017】

「縮合環」としてはナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環、インデン環、インダン環、キノリン環、キナゾリン環、クロマン環、イソクロマン環、インドール環、インドリン環、ベンゾジオキササン環、ベンゾジオキサソール環、ベンゾフラン環、ジヒドロベンゾフラン環、ベンゾチオフェン環、ジヒドロベンゾチオフェン環、ベンゾオキサゾール環、ベンゾチアゾール環、ベンズイミダゾール環又はインダゾール環等を例示することができる。

【0018】

本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン等との塩類を例示することができる。

【0019】

本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉炭素原子又は不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の炭素-炭素二重結合又は炭素-窒素二重結合に由来する2種以上の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

【0020】

本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体において、Aとして特に好ましく

は C_1 - C_6 アルキレン基である。 R^1 として好ましくは水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、置換 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、フェニル基又は置換フェニル基であり、特に好ましくは C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_6 アルキル基又は C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_6 アルキル基である。 R^2 、 R^3 及び R^4 として好ましくは水素原子又は C_1 - C_6 アルキル基である。 Q として好ましくは炭素原子又は窒素原子であり、特に好ましくは炭素原子である。 X として好ましくはハロゲン原子、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基であり、特に好ましくはハロゲン原子である。 m として好ましくは1又は2であり、特に好ましくは1である。 Y として好ましくはハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ヒドロキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基又はハロ C_1 - C_6 アルコキシ基であり、特に好ましくは C_1 - C_6 アルキル基又はハロ C_1 - C_6 アルキル基である。 n として好ましくは1～3の整数であり、特に好ましくは2である。

【0021】

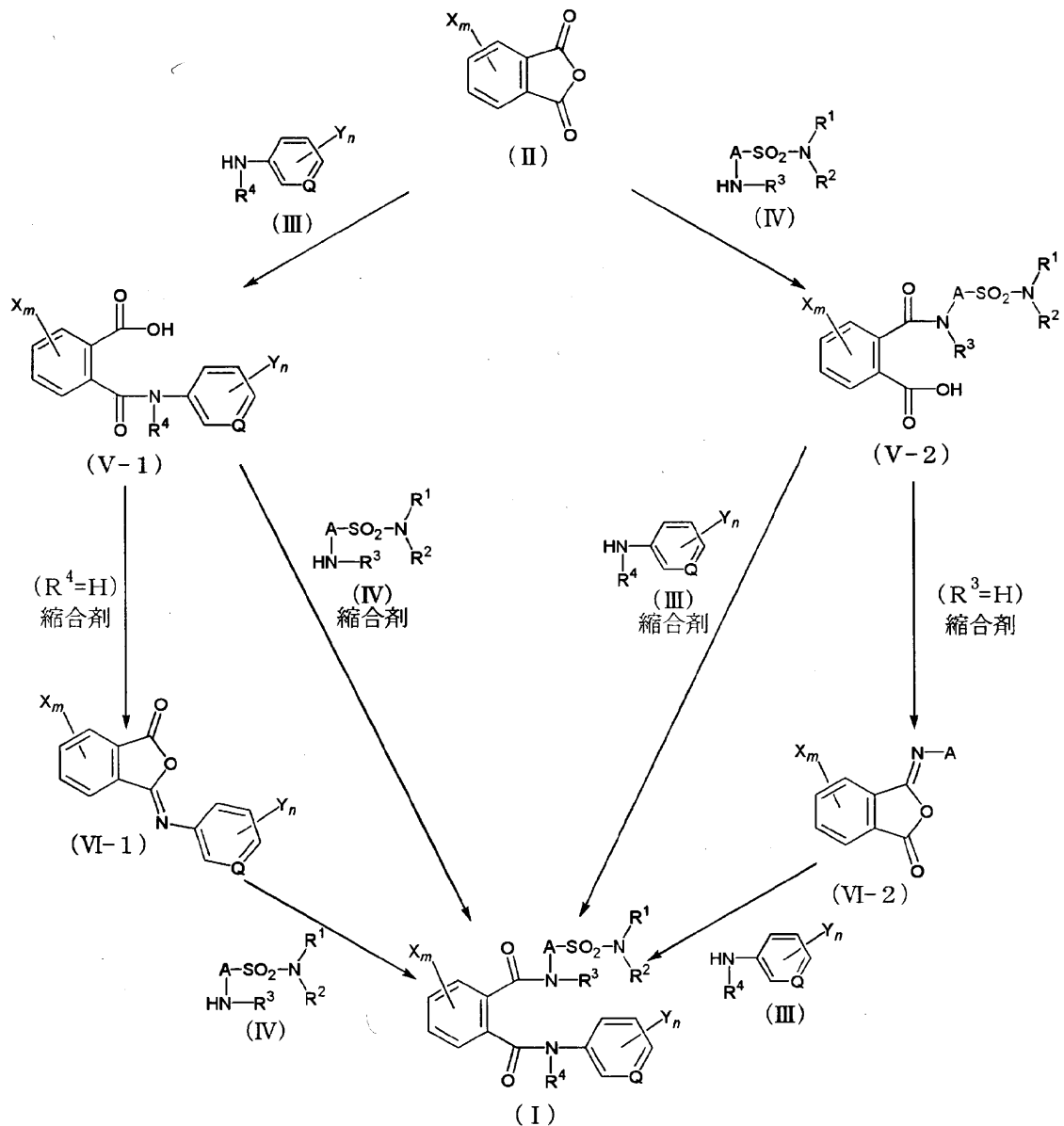
本発明の、一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体は例えば、下記に図示する製造方法により製造することができるが、これらに限定されるものではない。

製造方法.

【化3】

10

20



(式中、A、 $R^1 \sim R^4$ 、X、Y、n、m及びQは前記に同じ。)

【0022】

本反応はJ. Med. Chem., 10, 982 (1967)、特開平11-240857号公報、特開2001-131141号公報等に掲載の方法に従い製造することができる。即ち、一般式(II)で表されるフタル酸無水物類と一般式(III)で表されるアミン類とを、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(V-1)で表されるフタルアミド酸類とし、該フタルアミド酸類(V-1)を単離し又は単離せずして、 R^4 が水素原子を示すフタルアミド酸類(V-1)の場合、塩基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合反応を行い、一般式(VI-1)で表されるイソイミド誘導体とし、該イソイミド誘導体(VI-1)を単離し又は単離せずして、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に一般式(IV)で表されるスルファモイルアミン類と反応させることにより、一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができ、 R^4 が水素原子以外の置換基を示すフタルアミド酸類(V-1)の場合、一般式(IV)で表されるスルファモイルアミン類とを塩基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合させることにより、一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができる。

【0023】

又、一般式 (II) で表されるフタル酸無水物類と一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類とを、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式 (V-2) で表されるフタルアミド酸類とし、該フタルアミド酸類 (V-2) を単離し又は単離せずして、 R^3 が水素原子を示すフタルアミド酸類 (V-2) の場合、塩基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合反応を行い、一般式 (VI-2) で表されるイソイミド誘導体とし、該イソイミド誘導体 (VI-2) を単離し又は単離せずして、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に一般式 (III) で表されるアミン類と反応させることにより、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができ、 R^3 が水素原子以外の置換基を示すフタルアミド酸類 (V-2) の場合、一般式 (III) で表されるアミン類とを塩基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合させることにより、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができる。

10

【0024】

1. 一般式 (II) → 一般式 (V-1) 又は一般式 (V-2)

本反応で使用する酸としては、例えば酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、塩酸、硫酸等の無機酸類を例示することができ、その使用量は、一般式 (II) で表されるフタル酸無水物類に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は、一般式 (II) で表されるフタル酸無水物類に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

20

【0025】

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、酢酸等の酸類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

30

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかを過剰に使用することもできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離し又は単離せずして次の反応に使用することができる。

一般式 (II) で表されるフタル酸無水物類は J. Org. Chem., 52, 129 (1987)、J. Am. Chem. Soc., 51, 1865 (1929)、及び J. Am. Chem. Soc., 63, 1542 (1941) 等に記載の方法により製造することができる。

40

【0026】

2. 一般式 (V-1) 又は一般式 (V-2) → 一般式 (I)

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、アセトニトリル等のニトリル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

本反応で使用する縮合剤としては、通常のアミド製造に使用されるものであれば良く、例えば無水トリフルオロ酢酸、クロロ炭酸エステル、向山試薬 (2-クロロ-N-メチルピリジニウムヨード)、DCC (1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド)、CDI (

50

カルボニルジイミダゾール)、DEPC(シアノリン酸ジエチル)等を例示することができ、その使用量は一般式(V-1)又は(V-2)で表されるフタルアミド酸類に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

【0027】

本反応で利用できる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は一般式(V-1)又は一般式(V-2)で表されるフタルアミド酸類に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

反応温度は0℃乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0028】

3. 一般式(V-1) → 一般式(VI-1) 又は
一般式(V-2) → 一般式(VI-2)

本反応は、例えばJ. Med. Chem., 10, 982 (1967)に記載の方法に従って目的物を製造することができる。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離し又は単離せずして次の反応に使用することができる。

【0029】

4. 一般式(VI-1) 又は一般式(VI-2) → 一般式(I)

本反応は1.と同様にすることにより、目的物を製造することができる。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

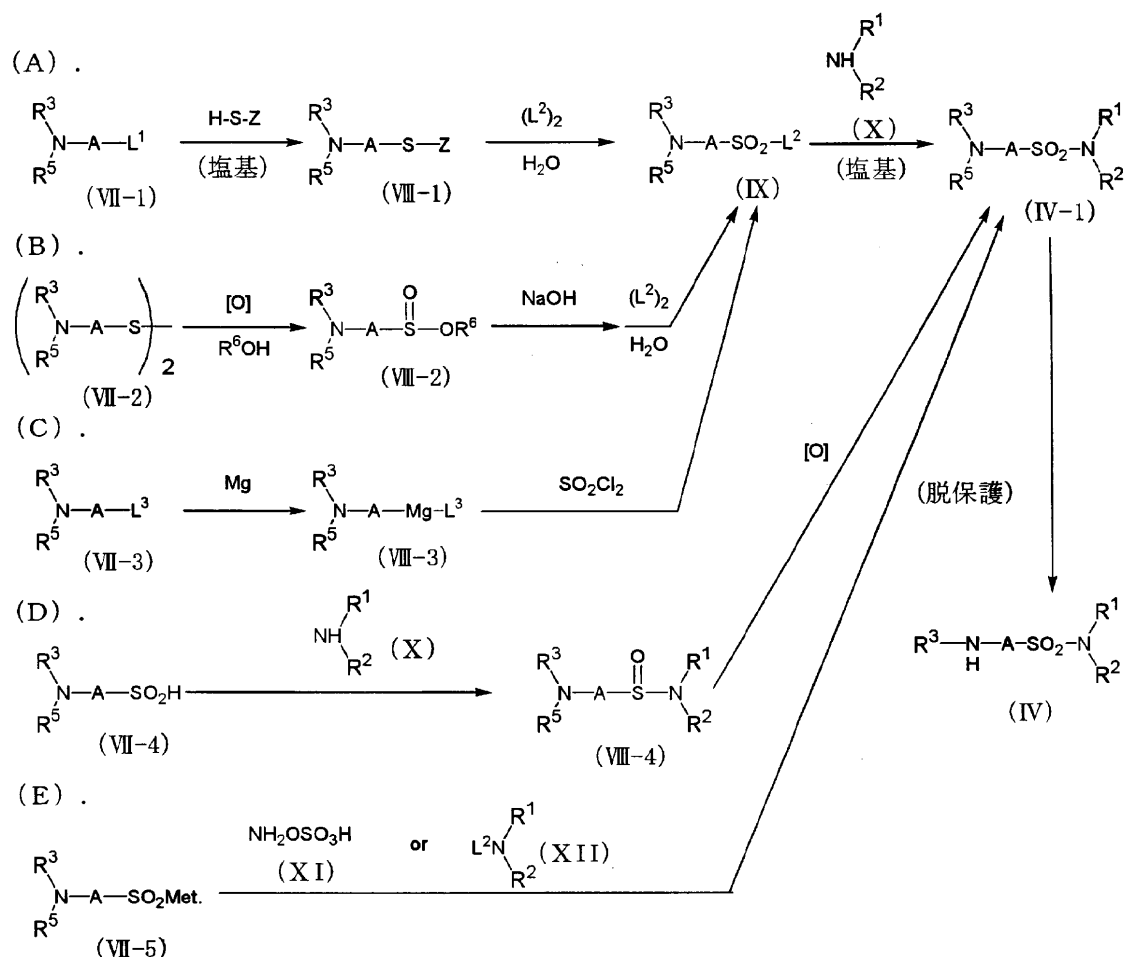
【0030】

原料であるスルファモイルアミン類(IV)は例えば以下に図示する文献記載の方法に準じて製造することができる。

【化4】

10

20



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び A は前記に同じくし、 R^5 はベンジルオキシカルボニル基、ターシャリーブトキシカルボニル基、アルキルシリル基等の保護基を示し、 R^6 は C_1 - C_6 アルキル基を示し、 L^1 、 L^2 及び L^3 はハロゲン原子等の脱離基を示し、 Met はナトリウム、カリウム等の金属原子を示し、 Z は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基又はベンジル基を示す。)

【0031】

(A) . 一般式 (VII-1) $\rightarrow$ 一般式 (IV)

一般式 (VII-1) で表されるアミン誘導体を *J. Am. Chem. Soc.*, 58, 1348 (1936)、*J. Am. Chem. Soc.*, 60, 1486 (1938) 等に記載の方法に従い、チオール類と反応させることによりチオアルキルアミン誘導体 (VII-1) とし、該チオアルキルアミン誘導体を単離し又は単離せずして、ハロゲン類と反応させることにより、一般式 (IX) で表されるスルホニルハライド誘導体とし、該スルホニルハライド誘導体を *Synthesis*, 1970, 545、*J. Org. Chem.*, 21, 667 (1956) 等に記載の方法に従い、一般式 (X) で表されるアミン類と反応させることにより一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、該スルホンアミド誘導体を常法に従い脱保護反応を行うことにより、一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。

【0032】

(B) . 一般式 (VII-2) $\rightarrow$ 一般式 (IV)

一般式 (VII-2) で表されるジスルフィド誘導体を *Synth. Commun.*, 27, 1321 (1997)、*Synthesis*, 1988, 252 等に記載の方法に従い、スルフェン酸エステル誘導体 (VIII-2) とし、該スルフェン酸エステル誘導体を単離し又は単離せずして、加水分解反応を行い、*J. Am. Chem. Soc.*, 45, 10

10

20

30

40

50

68 (1923) 等に記載の方法に従い、ハロゲン類と反応させることにより、一般式 (IX) で表されるスルホニルハライド誘導体とし、以下 (A) と同様にして一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。

【0033】

(C) . 一般式 (VII-3) → 一般式 (IV)

一般式 (VII-3) で表されるアミン誘導体を J. Org. Chem. , 20, 1159 (1955) 等に記載の方法に従い、グリニャール試薬 (VIII-3) とし、スルフリルクロライドと反応させることにより、一般式 (IX) で表されるスルホニルハライド誘導体とし、以下 (A) と同様にして一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。

10

【0034】

(D) . 一般式 (VII-4) → 一般式 (IV)

一般式 (VII-4) で表されるスルフェン酸誘導体と一般式 (X) で表されるアミン誘導体から J. Am. Chem. Soc. , 57, 2172 (1935) 、 Chem. Lett , 1976 , 149 等に記載の方法に従い、一般式 (VIII-4) で表されるスルフェンアミド誘導体とし、該スルフェンアミド誘導体を、J. Org. Chem. , 31, 2357 (1966) 等に記載の方法に従い、一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、以下 (A) と同様に脱保護することにより、一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。

【0035】

(E) . 一般式 (VII-5) → 一般式 (IV)

一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミンのうち、 R^1 及び R^2 が水素原子であるスルファモイルアミンは一般式 (VII-5) で表されるスルフェン酸塩誘導体とヒドロキシルアミン- α -スルホン酸 (XI) から Synthesis , 1985, 1032 に記載の方法に従い、一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、以下 (A) と同様に脱保護することにより、製造することができる。また、一般式 (VII-5) で表されるスルフェン酸塩誘導体と一般式 (XII) で表される N-ハロ置換アミン類から、J. Org. Chem. , 46, 5077 (1981) に記載の方法に従い、一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、以下 (A) と同様に脱保護することにより、一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することもできる。

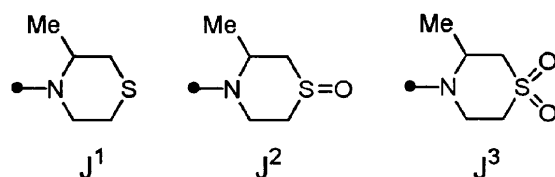
20

30

【0036】

以下に一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体の代表的な化合物を第1表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。以下の表において、「n」はノルマルを、「s」はセカンダリーを、「t」はターシャリーを、「i」はイソを、「c」はシクロを、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Pen」はペンチル基を、「Hex」はヘキシル基を、「Ph」はフェニル基を、「Py」はピリジル基を、「C^{*}」は不斉炭素を示す。又、「J¹」、「J²」、「J³」は以下にあらわされる置換基を示す。

【化5】

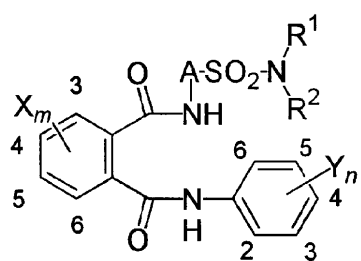


40

【0037】

一般式 (I-1)

【化6】



(I-1)

【0038】

【表1】

第 1 表

N o	-A-S O ₂ N R ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-1	CHMeCH ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	217-219
1-2	CHMeCH ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	186-188
1-3	CHMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	122-125
1-4	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	170-172
1-5	CHMeCH ₂ SO ₂ N(Me)Et	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-6	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	116
1-7	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	147-150
1-8	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-i-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	204-206
1-9	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-10	CHMeCH ₂ SO ₂ N(n-Pr) ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-11	CHMeCH ₂ SO ₂ N(i-Pr) ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-12	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	178-181
1-13	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-s-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-14	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-t-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	195-197
1-15	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-i-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-16	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-17	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Pen	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-18	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Hex	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-19	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -c-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-20	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	109-113
1-21	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C≡CH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	111-113
1-22	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	200-202
1-23	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-FPh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	195-198
1-24	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-ClPh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	193-196
1-25	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-BrPh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	189-192
1-26	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-MePh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

【 0 0 3 9 】

【表 2】

第1表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃	
1-27	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-OMePh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	180-183	
1-28	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-NO ₂ Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	173-177	
1-29	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(3-OMePh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	196-198	
1-30	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(3-NO ₂ Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	155-160	10
1-31	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(3-CNPh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	147-150	
1-32	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2,6-(OMe) ₂ Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	210-213	
1-33	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-ClPh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-34	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-MePh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-35	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-MeOPh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	176-179	
1-36	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-NO ₂ Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	185-187	
1-37	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-CNPh)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	169-171	20
1-38	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-SCF ₃ Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	201-204	
1-39	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	228-231	
1-40	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -3-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	144-147	
1-41	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -4-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	166-168	
1-42	CHMeCH ₂ SO ₂ N(Me)CH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	186-189	
1-43	CHMeCH ₂ SO ₂ N(Et)CH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	184-186	
1-44	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH(Me)Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	173-175	30
1-45	CHMeCH ₂ SO ₂ NHC*H(Me)Ph R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	168-170	
1-46	CHMeCH ₂ SO ₂ NHC*H(Me)Ph S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	159-161	
1-47	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	203-206	
1-48	CHMeCH ₂ SO ₂ NHC(Me) ₂ CH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	197-198	
1-49	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-50	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₃	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-51	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₄	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		40
1-52	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₅	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		

【 0 0 4 0 】

【表3】

第 1 表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-53	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₆	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-54	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ O	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	204-207
1-55	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ S	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	191-194
1-56	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ SO	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	195-198
1-57	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ SO ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	237-240
1-58	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ S	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	164-165
1-59	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ SO	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	167-168
1-60	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ SO ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	166-167
1-61	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ J ¹	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	207-208
1-62	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ J ²	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	アモルファス
1-63	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ J ³	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	157-159
1-64	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ NH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-65	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ NMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-66	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ NCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	196-198
1-67	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ C=O	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	209-211
1-68	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CF ₃	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-69	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH(Me)CF ₃	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-70	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH=CCl ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-71	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ Cl	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	90-95
1-72	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	171-174
1-73	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	142-144
1-74	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCH ₂ OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-75	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	156-158
1-76	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	132-134
1-77	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	186-189

【 0 0 4 1 】

【表 4】

第1表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-78	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	150-151
1-79	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	167-168
1-80	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ OCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	181-182
1-81	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	161-162
1-82	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	154-155
1-83	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	151-152
1-84	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	166-167
1-85	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SOEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	144-145
1-86	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Et	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	168-169
1-87	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	155-156
1-88	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SOPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	151-153
1-89	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	170-172
1-90	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-91	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCH ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	190-193
1-92	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCH ₂ SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	130-133
1-93	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCH ₂ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	150-154
1-94	CHMeCH ₂ SO ₂ NCMe ₂ CH ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	157-160
1-95	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₃ OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-96	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₃ SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-97	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₃ SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-98	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₃ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-99	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CN	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-100	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-101	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CO ₂ Et	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-102	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-103	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCONH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	228-230

【 0 0 4 2 】

【表 5】

第 1 表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃	
1-104	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCONHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	176-177	
1-105	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CONEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	172-174	
1-106	CHMeCH ₂ SO ₂ NHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	232-234	
1-107	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(2-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	211-212	10
1-108	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(2-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	101-106	
1-109	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(3-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	235-236	
1-110	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(4-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	228-233	
1-111	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(4-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	143-147	
1-112	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(4-MeS-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	165-170	
1-113	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-114	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-3-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		20
1-115	CHMeCH ₂ SO ₂ NHOH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-116	CHMeCH ₂ SO ₂ NHOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	200-205	
1-117	CHMeCH ₂ SO ₂ NMeOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-118	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-119	CHMeCH ₂ SO ₂ NMeNH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-120	CHMeCH ₂ SO ₂ NMeNHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-121	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	161-166	30
1-122	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-123	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNHCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-124	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNHCOPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-125	CHMeCH ₂ SO ₂ NHN=CMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-126	CHMeCH ₂ SO ₂ NHN=CHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-127	CHMeCH ₂ SO ₂ NHN=C(Me)Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-128	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		40
1-129	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		

【 0 0 4 3 】

【 表 6 】

第1表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-130	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CH-i-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-131	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-132	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHNHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-133	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHNMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	10
1-134	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHNEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-135	C*HMeCH ₂ SO ₂ NH ₂ R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-136	C*HMeCH ₂ SO ₂ NH ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-137	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHMe R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-138	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHMe S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-139	C*HMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂ R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	20
1-140	C*HMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-141	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHEt R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-142	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHEt S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	105-107
1-143	C*HMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂ R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-144	C*HMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	159-163
1-145	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	30
1-146	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	158-159
1-147	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHC*HMe CH ₂ SMe S,S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	アモルファス
1-148	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHC*HMe CH ₂ SOMe S,S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	115-120
1-149	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHC*HMe CH ₂ SO ₂ Me S,S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	アモルファス

【0044】

【表7】

第 1 表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-150	CHMeSO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	10
1-151	CHMeSO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-152	CHMeSO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-153	CHMeSO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-154	CHMeSO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-155	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-156	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-157	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-158	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-159	CHMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-160	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NH ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	20
1-161	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHMe S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-162	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NMe ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-163	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHEt S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-164	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NEt ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-165	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	30
1-166	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-167	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-168	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-169	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-170	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	40
1-171	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-172	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-173	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-174	CHMe(CH ₂) ₄ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

【 0 0 4 5 】

【 表 8 】

第1表(続き)

No	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃	
1-175	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	アモルファス	
1-176	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	アモルファス	
1-177	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	151-152	
1-178	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	アモルファス	10
1-179	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	アモルファス	
1-180	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH-n-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	185-186	
1-181	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₄	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	129-130	
1-182	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-183	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C≡CH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-184	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	152-153	
1-185	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		20
1-186	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH-2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-187	CMe ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-188	CMe ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-189	CMe ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-190	CMe ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-191	CMe ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-192	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-193	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		30
1-194	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-195	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-196	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-197	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-198	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-199	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂		
1-200	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	185-186	40

【0046】

【表9】

第 1 表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-201	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	142-145
1-202	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-203	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-204	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-205	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-206	CMe ₂ (CH ₂) ₄ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-207	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	120-121
1-208	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	93-94
1-209	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-F	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-210	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-211	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	103-108
1-212	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	136-138
1-213	CHMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	107-110
1-214	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	112-115
1-215	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Pr	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	159-161
1-216	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-i-Pr	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	185-187
1-217	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Bu	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	179-181
1-218	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	139-141
1-219	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	169-170
1-220	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3,4-Cl ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-221	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3,4-Br ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-222	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	4-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-223	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	4-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-224	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	4-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-225	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NO ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-226	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NH ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

【 0 0 4 7 】

【表 1 0】

第 1 表(続き)

No	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-227	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-N(CH ₃) ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	10
1-228	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NHCOCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-229	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NHCOCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-230	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NHSO ₂ CH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-231	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-NHSO ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-232	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-CH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-233	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-234	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-235	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-236	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCOCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-237	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCOCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	20
1-238	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-SCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-239	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-SOCH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-240	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-SO ₂ CH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-241	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-SCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-242	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-SOCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-243	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-SO ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-244	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OSO ₂ CH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-245	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OSO ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-246	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-C≡CH	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	30
1-247	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-C≡CCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-248	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-CN	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-249	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-CHCHCHCH-4	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-250	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCF ₂ O-4	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-251	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-252	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-F	

【 0 0 4 8 】

【 表 1 1 】

第 1 表(続き)

N o	-A-S O ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-253	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-Cl	
1-254	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-Br	
1-255	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-I	
1-256	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-F-4-Cl	
1-257	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-F	10
1-258	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3,4-Cl ₂	
1-259	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-Br	
1-260	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-I	
1-261	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,4-Cl ₂	
1-262	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-Br	
1-263	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-I	
1-264	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,4-Br ₂	20
1-265	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Br-4-I	
1-266	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3,4-Cl ₃	アモルファス
1-267	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2,3,4-Cl ₃	114-118
1-268	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2,3,4-Cl ₃	164-166
1-269	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-F	
1-270	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-Br	
1-271	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-I	30
1-272	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,4-Cl ₂ -3-Br	
1-273	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,4-Cl ₂ -3-F	
1-274	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCHF ₂	
1-275	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCF ₃	181-182
1-276	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-OCF ₃	アモルファス
1-277	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-OCF ₃	アモルファス
1-278	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CF ₃	40

【 0 0 4 9 】

【 表 1 2 】

第1表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-279	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	10
1-280	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	
1-281	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
1-282	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOC ₃ F _{7-n}	
1-283	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-OCHF ₂	
1-284	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF ₃	100-103
1-285	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Cl-4-OCF ₃	
1-286	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Cl-4-OCF ₃	
1-287	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CF ₃	
1-288	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CHF ₂	
1-289	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CHFCF ₃	20
1-290	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
1-291	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF ₂ CHFOC ₃ F _{7-n}	
1-292	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₃	
1-293	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	
1-294	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHFCF ₃	30
1-295	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
1-296	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₂ CHFOC ₃ F _{7-n}	
1-297	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	4-CF ₂ CF ₂ CF ₃	
1-298	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	4-CF(CF ₃) ₂	
1-299	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF ₃	118-120
1-300	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-301	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-302	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-303	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-304	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C H ₂ SMe	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	153-154
				164-166

【0050】

【表13】

第 1 表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃	
1-305	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C H ₂ SOMe	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	150-152	
1-306	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C H ₂ SO ₂ Me	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	139-142	
1-307	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C H ₂ SEt	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	159-160	
1-308	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C H ₂ SOEt	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	198-199	10
1-309	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C H ₂ SO ₂ Et	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	133-134	
1-310	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ C H ₂ SPh	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	144-145	
1-311	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃		
1-312	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-CF ₃		
1-313	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-F-4-CF ₂ CF ₃		
1-314	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃		20
1-315	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃		
1-316	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-F-4-CF(CF ₃) ₂		
1-317	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂		
1-318	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂		
1-319	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-I-4-CF(CF ₃) ₂		
1-320	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂		
1-321	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CF(CF ₃) ₂		
1-322	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-i-Pr-4-CF(CF ₃) ₂		30
1-323	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-t-Bu-4-CF(CF ₃) ₂		
1-324	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Ph-4-CF(CF ₃) ₂		
1-325	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-CH ₂ OH-4-CF(CF ₃) ₂		
1-326	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-CH ₂ OMe-4-CF(CF ₃) ₂		
1-327	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂		
1-328	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SMe-4-CF(CF ₃) ₂		
1-329	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-N(Me) ₂ -4-CF(CF ₃) ₂		40

【 0 0 5 1 】

【 表 1 4 】

第 1 表(続き)

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-330	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-NO ₂ -4-CF(CF ₃) ₂	
1-331	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-CF ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	
1-332	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-CHO-4-CF(CF ₃) ₂	
1-333	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-CN-4-CF(CF ₃) ₂	
1-334	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-COMe-4-CF(CF ₃) ₂	10
1-335	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,3-(Me) ₂ -4-CF(CF ₃) ₂	
1-336	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-337	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
1-338	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-OH-4-CF(CF ₃) ₂	
1-339	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
1-340	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-5-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-341	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-5-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	20
1-342	CHMeCH ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	214-216
1-343	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	232-234
1-344	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	アモルファス
1-345	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₄	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	アモルファス
1-346	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-C(OH)(CF ₃) ₂	
1-347	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-C(OMe)(CF ₃) ₂	
1-348	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-C(OEt)(CF ₃) ₂	
1-349	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-OCF ₂ O-3-4-CF(CF ₃) ₂	30
1-350	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-OCH ₂ O-3-4-CF(CF ₃) ₂	
1-351	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-(CH ₂) ₃ -3-4-CF(CF ₃) ₂	
1-352	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-(CH ₂) ₄ -3-4-CF(CF ₃) ₂	
1-353	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	

10

20

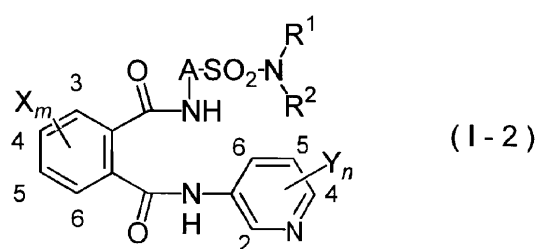
30

40

【 0 0 5 2 】

【 表 1 5 】

一般式 (I-2)



第2表

N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
2-1	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	4-CF(CF ₃) ₂	
2-2	CHMeCH ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-3	CHMeCH ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-4	CHMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-5	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	アモルファス
2-6	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-7	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	アモルファス
2-8	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
2-9	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
2-10	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SMe-4-CF(CF ₃) ₂	
2-11	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SOMe-4-CF(CF ₃) ₂	
2-12	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SO ₂ Me-4-CF(CF ₃) ₂	
2-13	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
2-14	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CF(CF ₃) ₂	
2-15	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	4-CH(CF ₃) ₂	
2-16	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	アモルファス
2-17	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-CH(CF ₃) ₂	
2-18	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-OMe-4-CH(CF ₃) ₂	
2-19	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SMe-4-CH(CF ₃) ₂	
2-20	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SOMe-4-CH(CF ₃) ₂	

【0053】

【表16】

第2表(続き)

No	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
2-21	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SO ₂ Me-4-CH(CF ₃) ₂	
2-22	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Et-4-CH(CF ₃) ₂	
2-23	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CH(CF ₃) ₂	

【0054】

10

第1表及び第2表中、物性がアモルファスで示される化合物の¹H-NMRデータを第3表に示す。

【表17】

第3表

No.	NMR データ ¹ H-NMR[CDCl ₃ (or DMSO-d ₆)/TMS, δ 値(ppm)]	
1-62 (CDCl ₃)	1.30(d,3H),1.60(s,6H),2.38(s,3H),2.80(m,2H), 3.30(m,3H), 3.43(s,2H),4.00(m,1H),4.50(m,1H),6.45(br,1H),7.25(m,1H), 7.48(m,2H),7.76(d,1H), 7.98(d,1H),8.29(d,1H),8.40(br,1H)	20
1-147 (CDCl ₃)	1.09(d,3H),1.44(d,3H),2.05(s,3H),2.37(s,3H), 2.43(m,2H), 3.32(m,2H),3.63(m,1H),4.63(m,1H), 5.46(br,1H),6.70(br,1H), 7.21(t,1H),7.36(d,1H), 7.44(s,1H),7.70(d,1H),7.90(m,2H), 8.64(br,1H)	
1-149 (CDCl ₃)	1.19(d,3H),1.37(d,3H),2.33(s,3H),2.83(s,3H), 3.52(m,2H), 3.27(d,2H),3.98(m,1H),4.55(m,1H),5.98(br,1H),6.88(br,1H), 7.11(t,1H),7.33(d,1H),7.42(s,1H),7.60(m,1H),7.83(m,2H), 8.89(br,1H)	30
1-175 (DMSO-d ₆)	1.49(s,6H),2.35(s,3H),3.65(s,2H),6.91(br,2H), 7.25(m,1H), 7.51(d,1H),7.52(s,1H),7.70(d,1H), 7.78(d,1H),7.99(d,1H), 8.29(s,1H),9.87(br,1H)	
1-176 (CDCl ₃)	1.63(s,6H),2.39(s,3H),2.56(d,3H),3.41(s,2H), 4.21(br,1H), 6.48(br,1H),7.20(m,1H),7.47(m,2H), 7.74(d,1H),7.99(d,1H), 8.30(br,1H),8.32(d,1H)	
1-178 (CDCl ₃)	1.01(t,3H),1.61(s,6H),2.38(s,3H),2.98(q,2H), 3.40(s,2H), 4.52(br,1H),6.63(br,1H),7.19(m,1H), 7.43(m,2H),7.71(d,1H), 7.95(d,1H),8.21(d,1H), 8.46(br,1H)	40

【0055】

【表18】

第3表 (続き)

1-179 (CDCl ₃)	1.08(t,6H),1.61(s,6H),2.34(s,3H),3.12(q,4H),3.21(s,2H), 6.75(br,1H),7.20(m,1H),7.43(m,2H),7.75(d,1H),7.96(d,1H), 8.37(d,1H),8.50(br,1H)	
1-266 (DMSO-d ₆)	1.00(t,3H),1.28(d,3H),2.84(m,4H),4.27(m,1H),7.14(br,1H), 7.28(m,1H),7.67(m,3H),8.03(d,1H),8.52(d,1H),10.14(br,1H)	
1-276 (CDCl ₃)	1.10(t,6H), 1.46(d,3H), 2.31(s,3H), 3.15(m,5H),3.67(m,1H), 4.60(m,1H), 6.80(br,1H), 7.04(s,1H),7.21(t,1H),7.25(d,1H), 7.74(d,1H), 7.95(d,1H),8.01(d,1H),8.26(br,1H)	10
1-277 (CDCl ₃)	1.11(t,6H),1.63(s,6H),2.33(s,3H),3.14(q,4H),3.20(s,2H), 6.67(br,1H),7.12(d,1H),7.21(m,2H),7.77(d,1H),7.97(d,1H), 8.18(d,1H),8.30(br,1H)	
1-302 (CDCl ₃)	1.10(t,6H),1.62(s,6H),2.38(s,3H),3.12(q,4H),3.16(s,2H), 6.68(br,1H),7.22(m,1H),7.43(m,2H),7.79(d,1H),7.99(d,1H), 8.43(br,1H),8.45(d,1H)	
1-344 (CDCl ₃)	1.09(t,6H),1.62(s,6H),2.35(s,3H),3.13(q,4H),3.20(s,2H), 3.99(m,1H),6.63(br,1H),7.26(m,3H),7.78(d,1H),7.98(d,1H), 8.33(d,1H),8.35(br,1H)	20
1-345 (CDCl ₃)	1.63(s,6H),1.78(m,4H),2.35(s,3H),3.19(m,4H),3.26(s,2H), 3.99(m,1H),6.68(br,1H),7.23(m,3H),7.77(d,1H),7.98(d,1H), 8.31(d,1H),8.33(br,1H)	
2-5 (CDCl ₃)	1.05(t,3H),1.47(d,3H),2.59(s,3H),3.05(m,2H),3.25(d,2H), 4.50(m,1H),5.05(br,1H),6.65(br,1H),7.25(m,1H),7.45(d,1H), 7.73(d,1H),7.97(d,1H),8.33(d,1H),8.63(br,1H)	30
2-7 (CDCl ₃)	1.08(t,6H),1.63(s,6H),2.62(s,3H),3.12(q,4H),3.18(s,2H), 6.79(br,1H),7.22(m,1H),7.53(d,1H),7.77(d,1H),7.98(d,1H), 8.73(d,1H),8.78(br,1H)	
2-16 (CDCl ₃)	1.01(t,3H),1.46(d,3H),2.55(s,3H),3.03(m,2H),3.24(d,2H), 4.40(m,2H),5.10(br,1H),6.65(br,1H),7.25(m,2H),7.71(d,1H), 7.93(d,1H),8.14(d,1H),8.74(br,1H)	

【0056】

【実施例】

以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない 40

実施例1.

N²-(2-エチルスルファモイル-1-メチルエチル)-3-ヨード-N¹-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}フタルアミド(化合物No.1-4)の製造

(1-1). 2-アミノプロパノール22.53g(300mmol)をテトラヒドロフラン(500ml)に溶かし、氷冷下、カルボベンゾキシクロリドの30%トルエン溶液155.1g(300mmol)、トリエチルアミン36.43g(360mmol)のテトラヒドロフラン溶液を順次、ゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、析出してきたトリエチルアミンの塩酸塩を減圧濾過、酢酸エチルで洗浄した。濾液を減圧濃縮した後 50

、希塩酸を加え、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して（2-ヒドロキシー-1-メチルエチル）カルバミン酸ベンジルを49.8 g（収率79%）得た。

【0057】

（1-2）． （2-ヒドロキシー-1-メチルエチル）カルバミン酸ベンジル46.5 g（222 mmol）、トリエチルアミン26.96 g（266 mmol）をテトラヒドロフラン（400 ml）に溶かし、0℃でメタンスルホンクロリド27.96 g（244 mmol）のテトラヒドロフラン溶液をゆっくりと滴下した。室温で5時間攪拌後、析出してきたトリエチルアミンの塩酸塩を減圧濾過、酢酸エチルで洗浄した。濾液を減圧濃縮した後、水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒（ヘキサン：酢酸エチル＝4：1）で2回洗浄して、メタンスルホン酸2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピルを49.5 g（収率78%）得た。

【0058】

（1-3）． メタンスルホン酸2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピル34.9 g（120 mmol）をエタノール（120 ml）に溶かし、チオグリコール酸14.42 g（120 mmol）とナトリウムエトキシド（120 mmol）のエタノール溶液から別途調製したチオラートを滴下した。室温で30分間、50℃で2時間反応後、溶媒を留去し、残渣に水を加えて酢酸エチルで3回抽出し、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝4：1）で精製して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピルチオ酢酸を34.5 g（収率92%）得た。

【0059】

（1-4）． 2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピルチオ酢酸34.5 g（110 mmol）を酢酸エチル（150 ml）に溶かし、0℃でメタクロロ過安息香酸23.9 g（110 mmol）の酢酸エチル溶液（50 ml）をゆっくりと滴下した。室温で3時間反応後、反応溶液を飽和重曹水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出、飽和重曹水で3回、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）で2回洗浄して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピルスルフィニル酢酸を30.38 g（収率84%）得た。

【0060】

（1-5）． 2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピルスルフィニル酢酸30.38 g（93 mmol）をメタノール（300 ml）に懸濁させ、ヨウ素19.04 g（75 mmol）を加え、還流下5時間反応させた。反応混合物に亜硫酸水素ナトリウム水溶液を加えて、過剰のヨウ素を還元した後、飽和重曹水と重曹を加えて溶液を弱塩基性とし、メタノールを留去した。残渣に水を加えて酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。

溶媒を留去して得た粗製のビス〔2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピル〕ジスルフィド（29 mmol、¹H-NMR積分比より概算）をエタノール（150 ml）に懸濁させ、N-ブロモコハク酸イミド15.66 g（88 mmol）を少量ずつ加えた。室温で3時間反応後、飽和重曹水と重曹を加えて溶液を弱塩基性とし、エタノールを留去した。残渣に水を加えて酢酸エチルで3回抽出、水で3回、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）で精製して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルフィン酸エチルを16.0 g（収率60%）得た。

【0061】

（1-6）． 2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルフィン酸エチル2.2 g（7.4 mmol）をエタノール（7 ml）に溶かし、氷冷下10%水酸化ナトリウム水溶液3.2 g（8 mmol）をゆっくりと滴下した。室温で1時間反応後、エタノールを留去し、残渣に水を加えてメチルターシャリーブチルエーテルで2回抽出し、

10

20

30

40

50

水層を濃塩酸で酸性として、酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒（ヘキサン：酢酸エチル＝4：1）で2回洗浄して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルフィン酸を1.73 g（収率91%）得た。

【0062】

（1-7）．炭酸カリウム0.52 g（3.8 mmol）を水（10 ml）に溶かし、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルフィン酸1.73 g（6.7 mmol）を加えた後、臭素1.07 g（6.7 mmol）を滴下した（滴下途中での結晶が析出して攪拌が困難になってくるため、適宜水を加えた）。室温で30分間攪拌後、結晶を濾過し、水で洗浄して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホニルブロミドを2.30 g（定量的）得た。

10

【0063】

（1-8）．70%エチルアミン水溶液（10 ml）に氷冷下、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホニルブロミド1.44 g（3.3 mmol）のテトラヒドロフラン溶液（5 ml）を滴下した。室温で1時間反応させた後、反応混合物を希塩酸中に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗製のN-エチル-2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホンアミドをそのまま次の反応に用いた。

【0064】

（1-9）．10% Pd-C 0.07 gをアルゴン置換した加圧水添用ボトルに入れ、エタノール（10 ml）を一気に加えて懸濁させた後、（1-8）で得た粗製のN-エチル-2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホンアミドのエタノール溶液（20 ml）を加えて、加圧下（水素圧4 K_g/cm²）10時間反応させた（途中、発生する一酸化炭素の分圧を下げるため、圧を下げ、再び加圧した）。反応溶液をセライト濾過、エタノールで洗浄し、濾液を減圧濃縮して得た結晶を溶媒（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）で2回洗浄して、N-エチル-2-アミノプロパン-1-スルホンアミドを0.27 g {2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホニルブロミドから収率50%} 得た。

20

【0065】

（1-10）．3-ヨード無水フタル酸5.5 g（20 mmol）をアセトニトリル（100 ml）に溶かし、2-メチル-4-〔1,2,2,2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル〕アニリン5.5 g（20 mmol）のアセトニトリル溶液（20 ml）をゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、減圧下にアセトニトリルの2/3量を留去し、析出した結晶を濾過、アセトニトリルで洗浄し、6-ヨード-N-〔2-メチル-4-〔1,2,2,2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル〕フェニル〕フタルアミド酸を5.6 g（収率51%）得た。

30

【0066】

（1-11）．6-ヨード-N-〔2-メチル-4-〔1,2,2,2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル〕フェニル〕フタルアミド酸5.47 g（10 mmol）をメチルターシャリーブチルエーテル（60 ml）に懸濁させ、無水トリフルオロ酢酸3.15 g（15 mmol）のメチルターシャリーブチルエーテル溶液をゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、氷水中に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出、飽和重曹水で2回、飽和食塩水で1回洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒（ヘキサン：酢酸エチル＝4：1）で2回洗浄して、1,3-ジヒドロ-7-ヨード-3-〔2-メチル-4-〔1,2,2,2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル〕フェニルイミノ〕-2-ベンゾフラン-1-オンを5.0 g（収率94%）得た。

40

（1-12）．1,3-ジヒドロ-7-ヨード-3-〔2-メチル-4-〔1,2,2,2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル〕フェニルイミノ〕-2-ベンゾフラン-1-オン0.42 g（0.8 mmol）をアセトニトリル（10 ml）に溶かし

50

、(1-9)で得たN-エチル-2-アミノプロパン-1-スルホンアミド0.13g (0.8 mmol)を加え、室温で10時間反応させた。溶媒を留去し、析出した結晶を濾過、アセトニトリルで洗浄後、混合溶媒(ヘキサン：酢酸エチル=4：1)で更に洗浄し、N²-(2-エチルスルファモイル-1-メチルエチル)-3-ヨード-N¹-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}フタルアミドを0.45g(収率81%)得た。

融点：170～172℃

【0067】

実施例2.

3-ヨード-N¹-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N²-(2-スルファモイル-1,1-ジメチルエチル)フタルアミド(化合物No.1-175)の製造

(2-1). 1,1-ジメチル-2-(メチルチオ)エチルアミン23.86g (200 mmol)をテトラヒドロフラン(300 ml)に溶かし、氷冷下、カルボベンゾキシクロリドの30%トルエン溶液103.4g (200 mmol)、トリエチルアミン24.29g (240 mmol)のテトラヒドロフラン溶液を順次、ゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、析出してきたトリエチルアミンの塩酸塩を減圧濾過、酢酸エチルで洗浄した。濾液を減圧濃縮した残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル=4：1)で精製して、1,1-ジメチル-2-(メチルチオ)エチルカルバミン酸ベンジルを36.35g(収率72%)得た。

【0068】

(2-2). 1,1-ジメチル-2-(メチルチオ)エチルカルバミン酸ベンジル45.4g (179 mmol)の含水メタノール溶液(メタノール150 mlに水5.22g (290 mmol)を加えたもの)に攪拌しながらN-ブロモコハク酸イミド33.46g (188 mmol)を少量ずつ加えた。室温で2時間反応後、飽和重曹水で反応溶液を弱塩基性とした後、メタノールを留去した。残渣に水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、水で3回、飽和食塩水で1回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗製の1,1-ジメチル-2-(メチルスルフィニル)エチルカルバミン酸ベンジルを無水酢酸(150 ml)に溶かし、還流下4時間反応させた。過剰の無水酢酸および酢酸を減圧下に留去し、粗製の酢酸[2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロピル]チオメチルを含有する残渣を得た。この残渣をメタノール(300 ml)に溶かし、ヨウ素19.54g (77 mmol)を加え、還流下5時間反応させた。反応混合物を室温まで冷却後、亜硫酸水素ナトリウム水溶液を加えて過剰のヨウ素を還元し、飽和重曹水で反応溶液を弱塩基性とした後、メタノールを留去した。残渣に水を加え、酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル=4：1)で精製して、ビス[2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロピル]ジスルフィドを10.0g(収率23%)得た。

【0069】

(2-3). ビス[2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロピル]ジスルフィド10.0g (21 mmol)をエタノール(150 ml)に溶かし、N-ブロモコハク酸イミド11.21g (63 mmol)を攪拌しながら少量ずつ加えた。室温で2時間反応後、飽和重曹水で反応溶液を弱塩基性とした後、エタノールを留去した。残渣に水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、水で3回、飽和食塩水で1回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル=2：1)で精製して、2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロパン-1-スルフィン酸エチルを10.45g(収率83%)得た。

【0070】

(2-4). 2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロパン-1-スルフィン酸エチル0.60g (2 mmol)をエタノール(10 ml)に溶かし、氷冷下

10

20

30

40

50

10%水酸化ナトリウム水溶液0.9 g (2.2 mmol) をゆっくりと滴下した。室温で1時間反応後、エタノールを留去し、残渣に水(10 ml)、酢酸ナトリウム0.18 g (2.2 mmol)、ヒドロキシカルボニルアミン-O-スルホン酸0.25 g (2.2 mmol) を加え、室温で1時間反応させた。反応混合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗製の2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロパン-1-スルホンアミド0.49 g (収率86%) をそのまま次の反応に用いた。

【0071】

(2-5). 10% Pd-C 0.20 g をアルゴン置換した加圧水添用ボトルに入れ酢酸(5 ml)を一気に加えて懸濁させた後、(2-4) で得た2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロパン-1-スルホンアミドの酢酸溶液(10 ml)を加えて、加圧下(水素圧4 Kg/cm²) 10時間反応させた(途中、発生する一酸化炭素の分圧を下げるため、圧を下げ、再び加圧した)。反応溶液をセライト濾過、エタノール洗浄し、濾液を減圧濃縮した残渣(粗製の2-アミノ-2-メチルプロパン-1-スルホンアミド酢酸塩)をそのまま次の反応に用いた。

【0072】

(2-6). 1, 3-ジヒドロ-7-ヨード-3-{2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニルイミノ}-2-ベンゾフラン-1-オン0.8 g (1.5 mmol) をアセトニトリル(10 ml)に溶かし、(2-5) で得た粗製の2-アミノ-2-メチルプロパンスルホンアミド酢酸塩及びトリエチルアミン0.17 g (1.7 mmol)を加えて、室温で30時間反応させた。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=1:1)で精製して、3-ヨード-N¹-{2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N²-(2-スルファモイル-1, 1-ジメチルエチル)フタルアミドをアモルファスとして0.05 g (収率9%) 得た。

¹H-NMR [DMSO-d₆/TMS, δ 値(ppm)]

1.49(s, 6H), 2.35(s, 3H), 3.65(s, 2H), 6.91(br, 2H), 7.25(m, 1H), 7.51(d, 1H), 7.52(s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.99(d, 1H), 8.29(s, 1H), 9.87(br, 1H)

【0073】

本発明の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリングコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ(*Adoxophyes* sp.)、リングコシンクイ(*Grapholita inopinata*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ(*Leguminivora glycinivorella*)、クワハマキ(*Olethreutes mori*)、チャノホソガ(*Caloptilia thevivora*)、リングホソガ(*Caloptilia zachrysa*)、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoniella*)、ナシホソガ(*Spulerrina asturota*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)、オオタバコガ類(*Heliothis* sp.)、コドリंगा(*Laspeyresia pomonella*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、リングヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、モモシンクイガ(*Carposina niponensis*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、チャマダラメイガ(*Ephestia elutella*)、クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、サンカメイガ(*Scirpophaga incertulas*)、イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イネヨトウ(*Sesamia inferens*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera exigua*)等の鱗翅目害虫、

【0074】

フタテンヨコバイ(*Macrostelus fascifrons*)、ツマグロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)、ミカンキジラミ(*Diaphorina citri*)、ブドウコナジラミ(*Aleurolobus taenabae*)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)等の

rum)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria aurantii*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ナシマルカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ (*Pratylenchus* sp.)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintiotopunctata*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、ヤサイゾウムシ (*Listroderes costirostris*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis grandis*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*)、コロラドポテトビートル (*Leptinotarsa decemlineata*)、メキシカンビーンビートル (*Epilachna varivestis*)、コーンルートワーム類 (*Diabrotica* sp.)等の甲虫目害虫、

【0075】

ウリミバエ (*Dacus* (*Zeugodacus*) *cucurbitae*)、ミカンコミバエ (*Dacus* (*Bactrocera*) *dorsalis*)、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*)、タネバエ (*Delia platura*)、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia* sp.)、イエバエ (*Musca domestica*)、アカイエカ (*Culex pipiens pipiens*)等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ネコブセンチュウ (*Meloidogyne* sp.)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ (*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*)等のハリセンチュウ目害虫、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai* Kishida)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae* Koch)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theae*)、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)等のダニ目害虫等に対して強い殺虫効果を有するものである。

【0076】

本発明の一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するものである。害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

【0077】

即ち、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パックス剤等に製剤して使用すれば良い。

本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類 (例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等)、タルク類 (例えばタルク、ピロフィライト等)、シリカ類 {例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン (含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。)}、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン

、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

【0078】

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させることとなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類（例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、
10 エーテル類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、鉱油等）、芳香族炭化水素類（例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等）、エステル類（例えば酢酸エチル、ジイソブチルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等）、アミド類（例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等）、ニトリル類（例えばアセトニトリル等）、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

【0079】

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリアルスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を例示することができる。

【0080】

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び／又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコン油等の補助剤を使用することもできる。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることが可能である。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、農園芸用殺虫剤100重部中、0.01～90重量部の範囲で適宜選択すれば良く、例えば粉剤或いは粒剤とする場合は0.01から50重量部、又乳剤或いは水和剤とする場合も同様0.01から50重量部が適当である。

【0081】

本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況

10

20

30

40

50

、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001gから10kg、好ましくは0.01gから1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

【0082】

以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

10

尚、処方例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1.

第1表又は第2表記載の化合物	10部
キシレン	70部
N-メチルピロリドン	10部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

製剤例2.

第1表又は第2表記載の化合物	3部
クレー粉末	82部
珪藻土粉末	15部
以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。	

20

【0083】

製剤例3.

第1表又は第2表記載の化合物	5部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90部
リグニンスルホン酸カルシウム	5部
以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。	

製剤例4.

第1表又は第2表記載の化合物	20部
カオリンと合成高分散珪酸の混合物	75部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	5部
以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。	

30

【0084】

試験例1. コナガ (*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験。

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第1表及び第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

40

[数1]

無処理区孵化虫数－処理区孵化虫数

補正死虫率 (%) = $\frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$

無処理区孵化虫数

判定基準. A・・・死虫率100%

B・・・死虫率99%～90%

50

C・・・死虫率89%～80%

D・・・死虫率79%～50%

E・・・死虫率50%以下

上記試験の結果を表4に記す。

【0085】

試験例2. ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) に対する殺虫試験。

第1表及び第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した薬液にキャベツ葉片(品種:四季穫)を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ2令幼虫を接種した後、蓋をして25℃の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、判定基準は試験例1

10

に従って行った。1区10頭3連制。

【数2】

無処理区生存虫数－処理区生存虫数

補正死虫率(%) = ----- × 100

無処理区生存虫数

上記試験の結果を表4に記す。

【0086】

試験例3. チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.) に対する殺虫試験。

20

第1表及び第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した薬液にチャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。1区10頭3連制。

上記試験の結果を表4に記す。

【0087】

【表19】

第 4 表

N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3	
1-1	A	A	A	
1-2	A	A	A	
1-3	A	A	A	
1-4	A	A	A	10
1-6	A	A	A	
1-7	A	A	A	
1-8	A	A	A	
1-12	A	A	A	
1-14	A	A	A	
1-20	A	A	A	
1-21	A	A	A	20
1-22	A	A	A	
1-23	A	A	A	
1-24	A	A	A	
1-25	A	A	A	
1-27	A	A	A	
1-28	A	A	A	
1-29	A	A	A	30
1-30	A	A	A	
1-31	A	A	A	
1-32	A	A	A	
1-35	A	A	A	
1-36	A	A	A	
1-37	A	A	A	
1-38	A	A	A	40
1-39	A	A	A	

【 0 0 8 8 】

【表 2 0】

第4表 (続き)

N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3	
1-40	A	A	A	
1-41	A	A	A	
1-42	A	A	A	
1-43	A	A	A	10
1-44	A	A	A	
1-45	A	A	A	
1-46	A	A	A	
1-47	A	A	A	
1-48	A	C	A	
1-54	A	A	A	
1-55	A	A	A	20
1-56	A	A	A	
1-57	A	A	A	
1-58	A	A	E	
1-59	A	A	E	
1-60	A	A	E	
1-61	A	A	A	
1-62	A	A	A	30
1-63	A	A	A	
1-66	A	A	A	
1-67	A	E	E	
1-71	A	A	A	
1-72	A	A	A	
1-73	A	A	A	
1-75	A	A	A	40
1-76	A	A	A	

【0089】

【表21】

第4表 (続き)

N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3	
1-77	A	A	A	
1-78	A	E	A	
1-79	A	A	A	
1-80	A	A	A	10
1-81	A	A	A	
1-82	A	A	A	
1-83	A	A	A	
1-84	A	A	A	
1-85	A	A	A	
1-86	A	A	A	
1-87	A	A	A	20
1-88	A	A	A	
1-89	A	A	A	
1-91	A	A	A	
1-92	A	A	A	
1-93	A	A	A	
1-94	A	A	A	
1-103	A	A	A	30
1-104	A	A	A	
1-105	A	A	E	
1-106	A	E	E	
1-107	A	C	A	
1-108	A	A	A	
1-109	A	E	A	
1-110	A	E	E	40
1-111	A	E	E	

【0090】

【表22】

第4表 (続き)

N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3	
1-112	A	E	E	
1-116	A	D	A	
1-121	A	E	E	
1-142	A	A	A	10
1-144	A	A	A	
1-146	A	A	A	
1-147	A	A	A	
1-148	A	A	A	
1-149	A	A	A	
1-175	A	A	A	
1-176	A	A	A	20
1-177	A	A	A	
1-178	A	A	A	
1-179	A	A	A	
1-180	A	C	A	
1-181	A	A	A	
1-184	A	A	A	
1-200	A	A	A	30
1-201	A	A	A	
1-207	A	A	E	
1-208	A	E	A	
1-211	A	A	A	
1-212	A	A	A	
1-213	A	A	A	
1-214	A	A	A	40
1-215	A	A	A	

【0091】

【表23】

第4表 (続き)

N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3	
1-216	A	A	A	
1-217	A	A	A	
1-218	A	A	A	
1-219	A	A	A	10
1-266	A	C	E	
1-267	A	C	E	
1-268	A	A	A	
1-275	A	E	E	
1-276	A	E	E	
1-277	A	A	A	
1-285	A	C	B	20
1-286	A	A	E	
1-301	A	A	A	
1-302	A	A	A	
1-303	A	A	A	
1-304	A	A	A	
1-305	A	A	A	
1-306	A	A	A	30
1-307	A	A	A	
1-308	A	A	A	
1-309	A	A	A	
1-310	A	A	A	
1-342	A	A	A	
1-343	A	A	A	
1-344	A	A	A	40
1-345	A	A	A	

【0092】

【表24】

第4表 (続き)

N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3
2-5	A	A	A
2-7	A	A	A
2-16	A	E	A

フロントページの続き

- (72)発明者 後藤 誠
大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内
- (72)発明者 森本 雅之
大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内
- (72)発明者 藤岡 伸祐
大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内
- (72)発明者 遠西 正範
大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内

審査官 前田 憲彦

- (56)参考文献 国際公開第 0 1 / 0 4 6 1 2 4 (WO, A 1)
特開平 1 1 - 2 4 0 8 5 7 (JP, A)
特開 2 0 0 3 - 0 3 4 6 7 2 (JP, A)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
- C07C 311/00
 - A01N 41/00
 - A01N 47/00
 - C07D 213/00
 - CA/REGISTRY(STN)