

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6802805号
(P6802805)

(45) 発行日 令和2年12月23日(2020.12.23)

(24) 登録日 令和2年12月1日(2020.12.1)

(51) Int.Cl.

F 1

C 0 7 D 249/06	(2006.01)	C O 7 D 249/06	5 0 1
A 6 1 K 31/4192	(2006.01)	C O 7 D 249/06	5 0 3
A 6 1 K 31/4439	(2006.01)	C O 7 D 249/06	5 0 2
A 6 1 K 31/4196	(2006.01)	C O 7 D 249/06	5 0 4
A 6 1 K 31/4245	(2006.01)	A 6 1 K 31/4192	

請求項の数 3 (全 111 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2017-554150 (P2017-554150)
 (86) (22) 出願日 平成28年11月30日(2016.11.30)
 (86) 国際出願番号 PCT/JP2016/085601
 (87) 国際公開番号 W02017/094790
 (87) 国際公開日 平成29年6月8日(2017.6.8)
 審査請求日 令和1年9月30日(2019.9.30)
 (31) 優先権主張番号 特願2015-233791 (P2015-233791)
 (32) 優先日 平成27年11月30日(2015.11.30)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
 日本国(JP)

(73) 特許権者 000242002
 北興化学工業株式会社
 東京都中央区日本橋本町1丁目5番4号
 (74) 代理人 110002505
 特許業務法人航栄特許事務所
 (72) 発明者 廣木 英勝
 神奈川県厚木市戸田2165番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内
 (72) 発明者 小林 優太
 神奈川県厚木市戸田2165番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内
 (72) 発明者 鈴木 潤
 神奈川県厚木市戸田2165番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内

最終頁に続く

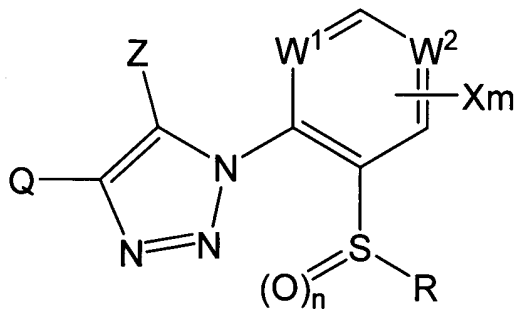
(54) 【発明の名称】 1, 2, 3-トリアゾール誘導体および当該誘導体を有効成分とする殺虫・殺ダニ剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記一般式(1)

【化1】



(1)

(前記一般式(1)中、

Rはエチル基を表す。

nは0~2の整数を表す。

W¹及びW²は、CHを表す。

Xは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよいC1-C6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC3-C6シクロアルキル基、C1-C6ア

ルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、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、C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニル基、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、ジ(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、(C 1 - C 6 アルキル)カルボニル(C 1 - C 6 アルキル)アミノ基、ペンタフルオロスルファニル基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基を表す。

mは1～4の整数を表し、mが2以上の整数を表す場合は、各々のXは同一でも相異なってもよい。

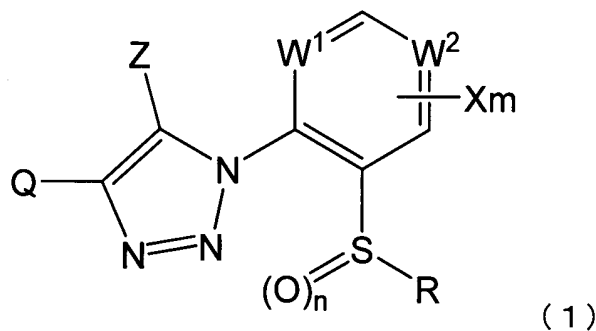
Qは、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 アルキルスルフィニル基、C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい(C 1 - C 6 アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいフェニル基を表す。

Zは、水素原子、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基を表す。)で表される1, 2, 3 - トリアゾール誘導体。

【請求項2】

下記一般式(1)

【化2】



(前記一般式(1)中、

Rはエチル基を表す。

nは0～2の整数を表す。

W¹及びW²は、CHを表す。

Xは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、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、C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニル基、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、ジ(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、(C 1 - C 6 アルキル)カルボニル(C 1 - C 6 アルキル)アミノ基、ペンタフルオロスルファニル基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基を表す。

mは1～4の整数を表し、mが2以上の整数を表す場合は、各々のXは同一でも相異なっているもよい。

Qは、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換しているもよいC1-C6アルキル基、シアノ基で置換しているもよいC3-C6シクロアルキル基、C1-C6アルコキシ基、シアノ基で置換しているもよいC1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、C1-C6ハロアルキルチオ基、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、C1-C6アルキルカルボニル基、C1-C6ハロアルキルカルボニル基、及びペンタフルオロスルファニル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されているもよいピリジル基を表す。

Zは、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基を表す。)で表される1, 2, 3-トリアゾール誘導体。

10

【請求項3】

請求項1又は2に記載の1, 2, 3-トリアゾール誘導体を有効成分として含有する殺虫・殺ダニ剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は新規な1, 2, 3-トリアゾール誘導体および当該誘導体を有効成分として含有することを特徴とする殺虫・殺ダニ剤に関する。

【背景技術】

20

【0002】

従来、農園芸分野では、各種害虫の防除を目的とした殺虫・殺ダニ剤が開発され実用に供されている。しかしながら、従来汎用されている殺虫・殺ダニ剤は、効果、スペクトラム、あるいは残効性等の点において必ずしも満足すべきものではない。また、施用回数や施用薬量の低減等の社会的要請を充分満足しているとは言えない。

【0003】

また、従来汎用されてきた殺虫・殺ダニ剤に対して抵抗性を獲得した害虫の出現も問題となっている。例えば、野菜、果樹、花卉、茶、ムギ類及びイネ等の栽培において、様々な系統の殺虫・殺ダニ剤、例えば、有機リン剤（フェントロチオン、マラチオン、プロチオフォス、DDVP等）、ピレスロイド系（ペルメトリン、シベルメリン、フェンバレレート、サイハロスリン等）、ベンゾイルウレア系（ジフルベンズロン、テフルベンズロン、クロルフルアズロン等）、ネライストキシシン系（カルタップ、ペンスタップ等）殺虫・殺ダニ剤に抵抗性を獲得した害虫の防除が年々困難になっている。

30

【0004】

さらに、害虫が未だ抵抗性を獲得していない殺虫・殺ダニ剤（例えば、DDTやBHC等の有機ハロゲン系農薬、アルドリル、ディルドリン、エンドリン、ヘプタクロル、ベンゾエピン等の塩素化環状ジエン系農薬等）もあるが、毒性及び環境汚染等の観点から好ましいものではない。従って、従来汎用の農園芸用殺虫・殺ダニ剤に抵抗性を獲得した各種害虫に対しても低薬量で十分な防除効果を示し、しかも有用生物に対して安全性が高く、環境への悪影響が少ない新規な殺虫・殺ダニ剤の開発が切望されている。

40

【0005】

これまでに殺虫・殺ダニ活性を示す1, 2, 3-トリアゾール誘導体としては、例えば、特許文献1には、各種有害生物に対して殺虫・殺ダニ活性を有する1, 2, 3-トリアゾール誘導体が記載されているものの、本発明に係る1, 2, 3-トリアゾール誘導体に関しては何ら開示されていない。また、本発明に類似した化合物が特許文献2～特許文献18に記載されているものの、本発明のような1, 2, 3-トリアゾール環の1位に2-アルキルチオ基、2-アルキルスルフィニル基又は2-アルキルスルホニル基が置換し、かつ、他の置換基が置換しているもよいフェニル基が置換した1, 2, 3-トリアゾール誘導体に関する記載は皆無である。

【先行技術文献】

50

【特許文献】

【0006】

【特許文献1】国際公開第2011/113756号

【特許文献2】国際公開第2015/144895号

【特許文献3】国際公開第2015/144826号

【特許文献4】国際公開第2015/068719号

【特許文献5】日本国特開2015-003906号公報

【特許文献6】国際公開第2015/002211号

【特許文献7】国際公開第2015/000715号

【特許文献8】国際公開第2014/157600号

10

【特許文献9】国際公開第2014/148451号

【特許文献10】国際公開第2014/142292号

【特許文献11】国際公開第2014/132972号

【特許文献12】国際公開第2014/132971号

【特許文献13】国際公開第2014/123206号

【特許文献14】国際公開第2014/123205号

【特許文献15】国際公開第2014/104407号

【特許文献16】国際公開第2014/021468号

【特許文献17】国際公開第2014/002754号

【特許文献18】国際公開第2013/191188号

20

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0007】

本発明は、新規な1, 2, 3-トリアゾール誘導体、並びにそれらを含む殺虫・殺ダニ剤を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0008】

本発明者らは、上記課題を解決するために鋭意研究を重ねた結果、下記一般式(1)で表される1, 2, 3-トリアゾール誘導体が、殺虫・殺ダニ活性を有することを見出し、本発明を完成させた。

30

【0009】

したがって本願の第一の発明は、下記一般式(1)で表される1, 2, 3-トリアゾール誘導体(本明細書において「本発明化合物」と記す場合がある。)に関するものであり、第二の発明は、一般式(1)で表される1, 2, 3-トリアゾール誘導体を有効成分として含有することを特徴とする殺虫・殺ダニ剤に関する。

【0010】

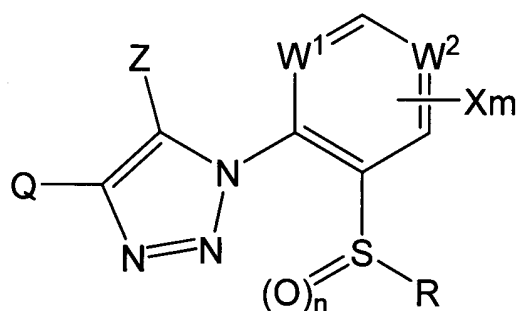
即ち、本発明者らは、以下の構成により上記課題が解決できることを見出した。

〔1〕

下記一般式(1)

【化1】

40



(1)

50

(前記一般式(1)中、

Rはエチル基を表す。

nは0～2の整数を表す。

W^1 及び W^2 は、CHを表す。

Xは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよいC1-C6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC3-C6シクロアルキル基、C1-C6アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C6アルキルカルボニル基、C1-C6アルキルチオ基、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、C1-C6ハロアルキルチオ基、C1-C6ハロアルキルスルフィニル基、C1-C6ハロアルキルスルホニル基、C1-C6アルキルアミノ基、(C1-C6アルコキシ)カルボニル基、ジ(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、(C1-C6アルキル)カルボニル(C1-C6アルキル)アミノ基、ペンタフルオロスルファニル基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基を表す。

mは1～4の整数を表し、mが2以上の整数を表す場合は、各々のXは同一でも相異なっているもよい。

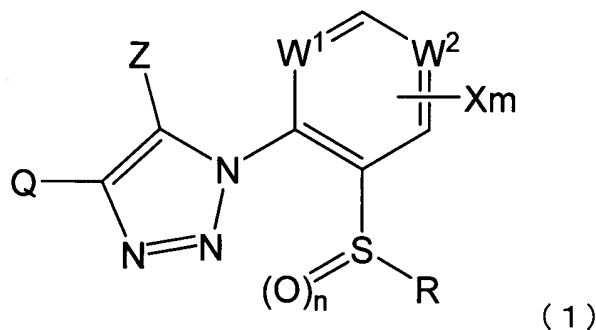
Qは、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、シアノ基で置換していてもよいC1-C6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC3-C6シクロアルキル基、C1-C6アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、C1-C6ハロアルキルチオ基、C1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基、C1-C6アルキルカルボニル基、C1-C6ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、窒素原子がC1-C6アルキル基で置換していてもよい(C1-C6アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいフェニル基を表す。

Zは、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基を表す。)で表される1, 2, 3-トリアゾール誘導体。

(2)

下記一般式(1)

【化2】



(前記一般式(1)中、

Rはエチル基を表す。

nは0～2の整数を表す。

W^1 及び W^2 は、CHを表す。

Xは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよいC1-C6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC3-C6シクロアルキル基、C1-C6アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C6アルキルカルボニル基、C1-C6アルキルチオ基、C1-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、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニル基、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、ジ(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、(C 1 - C 6 アルキル)カルボニル(C 1 - C 6 アルキル)アミノ基、ペンタフルオロスルファニル基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基を表す。

m は 1 ~ 4 の整数を表し、m が 2 以上の整数を表す場合は、各々の X は同一でも相異なってもよい。

Q は、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、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、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルカルボニル基、及びペンタフルオロスルファニル基からなる群より選択される 1 つ以上の基で置換されていてもよいピリジル基を表す。

Z は、水素原子、ハロゲン原子又は C 1 - C 6 アルキル基を表す。) で表される 1, 2, 3 - トリアゾール誘導体。

[3]

[1] 又は [2] に記載の 1, 2, 3 - トリアゾール誘導体を有効成分として含有する殺虫・殺ダニ剤。

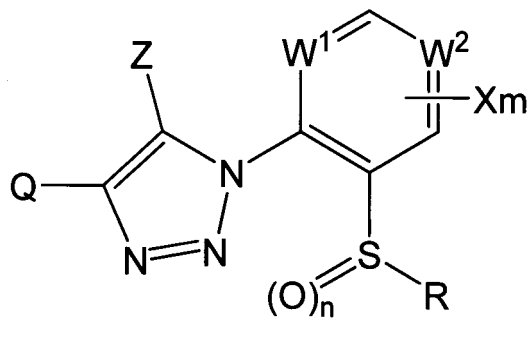
本発明は、上記 [1] ~ [3] に係る発明であるが、以下、それ以外の事項 (例えば、下記 < 1 > ~ < 5 >) についても記載している。

【 0 0 1 1 】

< 1 > 下記一般式 (1) で表される 1, 2, 3 - トリアゾール誘導体。

【 0 0 1 2 】

【 化 1 】



【 0 0 1 3 】

前記一般式 (1) 中、

R は C 1 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 ハロアルキル基を表す。

n は 0 ~ 2 の整数を表す。

W¹ 及び W² は、それぞれ独立に、C H 又は窒素原子を表す。

X は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、水酸基、カルボキシル基、水酸基もしくはシアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、(C 1 - C 6 アルコキシ) C 1 - C 6 フルオロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルスルホニルオキシ基、(C 1 - C 6 アルコキシ) C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニルオキシ基、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、C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、C 1 - C 6 ハロアルキル

10

20

30

40

50

チオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニル基、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、ジ(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、(C 1 - C 6 アルキル)カルボニル(C 1 - C 6 アルキル)アミノ基、N - (C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、ペンタフルオロスルファニル基、C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいトリアゾリル基、C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいオキサジアゾリル基、C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいテトラゾリル基、(C 1 - C 6 ハロアルキル基で置換していてもよいテトラゾリル)C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリーールスルホニル基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリーールスルフィニル基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリーールチオ基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリーールアミノ基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリーールオキシ基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリーール基を表す。

10

mは1~4の整数を表し、mが2以上の整数を表す場合は、各々のXは同一でも相異なってもよい。

Qは、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、{N - (C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している}C 1 - C 6 ハロアルキル基、{N - (ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい)アリーールカルバモイル基で置換している}C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 アルコキシカルボニル基、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、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、N - (C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、N - (C 1 - C 6 ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいN - (ピリジル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、N - (C 1 - C 6 アルキルカルボニル)アミノ基、N - (C 1 - C 6 ハロアルキルカルボニル)アミノ基、N - (C 1 - C 6 アルコキシカルボニル)アミノ基、N - (C 1 - C 6 ハロアルコキシカルボニル)アミノ基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェニル基がハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェニルスルホニルアミノ基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい(C 1 - C 6 アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、フェニル基、ピリジル基、チアゾリル基、キノリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基又はベンゾイミダゾリル基を表す。

20

30

40

Zは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、アミノ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C 1 - C 6 アルキル基、C 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、(C 1 - C 6 アルコキシ)C 1 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 アルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 アルキルアミノ基、ジ(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)カルボニルアミノ基、N - (C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、N - (C 1 - C 6 ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、(C 1 - C 6 ハロアルキル)カルボニルアミノ基、N, N' - ジ(C 1 - C 6

50

アルキル)カルボニルアミノ基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいアリールカルボニルアミノ基を表す。

【 0 0 1 4 】

< 2 >

前記一般式 (1) 中

R が C 1 - C 6 アルキル基であって、

W¹ 及び W² が C H であって、

X が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、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、C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニル基、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、ジ (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、(C 1 - C 6 アルキル) カルボニル (C 1 - C 6 アルキル) アミノ基、N - (C 1 - C 6 アルキル) カルバモイル基、N , N ' - ジ (C 1 - C 6 アルキル) カルバモイル基、ペンタフルオロスルファニル基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基であって、

Q が、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 アルコキシカルボニル基、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、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、窒素原子が C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい (C 1 - C 6 アルキル) アミノスルホニル基、ハロゲン原子又は C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又は C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される 1 つ以上の基で置換されていてもよい、フェニル基又はピリジル基であって、

Z が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、C 1 - C 6 アルキル基、C 3 - C 6 シクロアルキル基又は C 1 - C 6 ハロアルキル基である、< 1 > に記載の 1 , 2 , 3 - トリアゾール誘導体。

【 0 0 1 5 】

< 3 >

前記一般式 (1) 中

R がエチル基であって、

W¹ 及び W² が C H であって、

X が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、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、C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニル基、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、ジ (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、(C 1 - C 6 アルキル) カルボニル (C 1 - C 6 アルキル) アミノ基、N - (C 1 - C 6 アルキル) カルバモイル基、N , N ' - ジ (C 1 - C 6 アルキル) カルバモイル基、ペンタフルオロスルファニル基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基であって、

Q が、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、シアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 ア

10

20

30

40

50

ルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 アルコキシカルボニル基、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、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい(C 1 - C 6 アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいフェニル基であって、

Zが、水素原子、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基である、< 1 > に記載の1, 2, 3 - トリアゾール誘導体。

10

【0016】

< 4 >

前記一般式(1)中

Rがエチル基であって、

W¹及びW²がCHであって、

Xが、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、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、C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルフィニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニル基、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、ジ(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、(C 1 - C 6 アルキル)カルボニル(C 1 - C 6 アルキル)アミノ基、N - (C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、ペンタフルオロスルファニル基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基であって、

20

Qが、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、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、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルカルボニル基及びペンタフルオロスルファニル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいピリジル基であって、

30

Zが、水素原子、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基である、< 1 > に記載の1, 2, 3 - トリアゾール誘導体。

【0017】

< 5 >

< 1 > ~ < 4 > のいずれか1項に記載の1, 2, 3 - トリアゾール誘導体を有効成分として含有する殺虫・殺ダニ剤。

40

【発明の効果】

【0018】

前記一般式(1)で表される本発明の新規な1, 2, 3 - トリアゾール誘導体は優れた殺虫・殺ダニ剤効果を奏する。

【発明を実施するための形態】

【0019】

本発明化合物に係わる1, 2, 3 - トリアゾール誘導体、それらの製造方法並びに有効成分として含有する殺虫・殺ダニ剤について具体的に説明する。

【0020】

なお、下記の各基において、記載の炭素数は、シアノ基を有する場合のシアノ基中の炭

50

素は含まない。また、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、(C 1 - C 6) アルコキシカルボニル基といった、カルボニルを含む基におけるカルボニル炭素も含まないものとする。

【 0 0 2 1 】

なお、一般式 (1) において、W¹ 又は W² が C H を表す場合に、X が W¹ 又は W² に結合するときは、W¹ 又は W² における水素原子が X に置き換わるものである。

【 0 0 2 2 】

本発明の一般式 (1) で表される 1 , 2 , 3 - トリアゾール誘導体において、X 及び Z で表されるハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素を例示することができる。

【 0 0 2 3 】

R 及び Z で表される C 1 - C 6 アルキル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メチル基、エチル基、n - プロピル基、イソプロピル基、n - ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、1 - ペンチル基、イソアミル基、ネオペンチル基、2 - ペンチル基、3 - ペンチル基、2 - メチルブチル基、tert - ペンチル基、1 - ヘキシル基等を例示することができる。

X で表される水酸基もしくはシアノ基で置換していてもよい C 1 - C 6 アルキル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メチル基、エチル基、n - プロピル基、イソプロピル基、n - ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、tert - ブチル基、1 - ペンチル基、イソアミル基、ネオペンチル基、2 - ペンチル基、3 - ペンチル基、2 - メチルブチル基、tert - ペンチル基、1 - ヘキシル基、ヒドロキシメチル基、シアノメチル基、2 - メチルシアノメチル基、2 , 2 - ジメチルシアノメチル基、2 - エチル - 2 - メチルシアノメチル基、2 , 2 - ジエチルシアノメチル基、2 - シアノエチル基等を例示することができる。

【 0 0 2 4 】

Z で表される C 3 - C 6 シクロアルキル基としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等を例示することができる。

【 0 0 2 5 】

X で表されるシアノ基で置換していてもよい C 3 - C 6 シクロアルキル基としては、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、1 - シアノシクロプロピル基、2 - シアノシクロプロピル基等を例示することができる。

X で表される (C 1 - C 6 アルコキシ) C 1 - C 6 フルオロアルキル基としては、1 - メトキシ - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル基、1 - エトキシ - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル基、2 - メトキシ - 1 , 1 , 1 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロ - イソプロピル基、2 - エトキシ - 1 , 1 , 1 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロイソプロピル基等を例示することができる。

【 0 0 2 6 】

X 及び Z で表される C 1 - C 6 アルコキシ基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メトキシ基、エトキシ基、n - プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、n - ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、sec - ブチルオキシ基、tert - ブチルオキシ基、1 - ペンチルオキシ基、イソアミルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、2 - ペンチルオキシ基、3 - ペンチルオキシ基、2 - メチルブチルオキシ基、tert - ペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基等を例示することができる。

X で表される C 1 - C 6 アルキルスルホニルオキシ基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メチルスルホニルオキシ基、エチルスルホニルオキシ基、プロピルスルホニルオキシ基、イソプロピルスルホニルオキシ基、n - ブチルスルホニルオキシ基、イソブチルスルホニルオキシ基、sec - ブチルスルホニルオキシ基、tert - ブチルスルホニルオキシ基、1 - ペンチルスルホニルオキシ基、イソアミルスルホニルオキシ基、ネオペンチルスルホニルオキシ基、2 - ペンチルスルホニルオキシ基、3 - ペンチルスルホニルオキシ基、2 - メチルブチルスルホニルオキシ基、tert - ペンチルスルホニルオキシ基、1 - ヘキシルスルホニルオキシ基等を例示することができる。

10

20

30

40

50

Xで表される(C1 - C6アルコキシ)C1 - C6アルコキシ基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メトキシメトキシ基、メトキシエトキシ基、エトキシメトキシ基、エトキシエトキシ基、メトキシプロポキシ基、エトキシプロポキシ基、n - プロポキシメトキシ基、イソプロポキシメトキシ基、n - ブトキシメトキシ基、sec - ブトキシメトキシ基、tert - ブトキシメトキシ基、1 - ペンチルオキシメトキシ基、1 - ヘキシルオキシメトキシ基等を例示することができる。

【0027】

Zで表される(C1 - C6アルコキシ)C1 - C6アルキル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシメチル基、エトキシエチル基、n - プロポキシメチル基、イソプロポキシメチル基、n - ブトキシメチル基、sec - ブトキシメチル基、tert - ブトキシメチル基、1 - ペンチルオキシメチル基、1 - ヘキシルオキシメチル基等を例示することができる。

10

【0028】

Xで表されるシアノ基で置換していてもよいC1 - C6ハロアルキル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、モノフルオロメチル基、モノクロロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、2 - クロロエチル基、1 - フルオロエチル基、2 - フルオロエチル基、6 - フルオロヘキシル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロ - イソプロピル基、(シアノ)ジフルオロメチル基等を例示することができる。

【0029】

R及びZで表されるC1 - C6ハロアルキル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、モノフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、2 - クロロエチル基、1 - フルオロエチル基、2 - フルオロエチル基、6 - フルオロヘキシル基、ヘプタフルオロイソプロピル基等を例示することができる。

20

【0030】

Xで表されるC1 - C6ハロアルコキシ基としては、トリフルオロメトキシ基、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ基、2 - クロロエトキシ基、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ基等を例示することができる。

Xで表されるC1 - C6アルキルカルボニル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、アセチル基、エチルカルボニル基、n - プロピルカルボニル基、イソプロピルカルボニル基、n - ブチルカルボニル基、イソブチルカルボニル基、sec - ブチルカルボニル基、tert - ブチルカルボニル基、1 - ペンチルカルボニル基、1 - ヘキシルカルボニル基等を例示することができる。

30

Xで表されるC1 - C6ハロアルキルスルホニルオキシ基としては、ジフルオロメチルスルホニルオキシ基、トリフルオロメチルスルホニルオキシ基、クロロメチルスルホニルオキシ基、トリクロロメチルスルホニルオキシ基、2 - クロロエチルスルホニルオキシ基等を例示することができる。

【0031】

X及びZで表されるC1 - C6アルキルチオ基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メチルチオ基、エチルチオ基、n - プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、n - ブチルチオ基、イソブチルチオ基、sec - ブチルチオ基、tert - ブチルチオ基、1 - ペンチルチオ基、イソアミルチオ基、ネオペンチルチオ基、2 - ペンチルチオ基、3 - ペンチルチオ基、2 - メチルブチルチオ基、tert - ペンチルチオ基、1 - ヘキシルチオ基等を例示することができる。

40

【0032】

Xで表されるC1 - C6アルキルスルフィニル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、n - プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、n - ブチルスルフィニル基、イソブチルスルフィニル基、sec - ブチルスルフィニル基、tert - ブチルスルフィニル基、1 - ペ

50

ンチルスルフィニル基、イソアミルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、2 - ペンチルスルフィニル基、3 - ペンチルスルフィニル基、2 - メチルブチルスルフィニル基、*tert* - ペンチルスルフィニル基、1 - ヘキシルスルフィニル基等を例示することができる。

【0033】

Xで表されるC1 - C6アルキルスルホニル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、*n* - プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、*n* - ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、*sec* - ブチルスルホニル基、*tert* - ブチルスルホニル基、1 - ペンチルスルホニル基、イソアミルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、2 - ペンチルスルホニル基、3 - ペンチルスルホニル基、2 - メチルブチルスルホニル基、*tert* - ペンチルスルホニル基、1 - ヘキシルスルホニル基等を例示することができる。

10

X及びZで表されるC1 - C6ハロアルキルチオ基としては、モノフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルチオ基、2, 2, 2 - トリクロロエチルチオ基等を例示することができる。

Xで表されるC1 - C6ハロアルキルスルフィニル基としては、モノフルオロメチルスルフィニル基、ジフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルフィニル基、2, 2, 2 - トリクロロエチルスルフィニル基等を例示することができる。

Xで表されるC1 - C6ハロアルキルスルホニル基としては、モノフルオロメチルスルホニル基、ジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルホニル基、2, 2, 2 - トリクロロエチルスルホニル基等を例示することができる。

20

【0034】

X及びZで表されるC1 - C6アルキルアミノ基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メチルアミノ基、エチルアミノ基、イソプロピルアミノ基、イソブチルアミノ基、1 - ペンチルアミノ基、1 - ヘキシルアミノ基等を例示することができる。

X及びZで表される(C1 - C6アルコキシ)カルボニル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、*n* - プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、*n* - ブトキシカルボニル基、*sec* - ブトキシカルボニル基、*tert* - ブトキシカルボニル基、*n* - ヘキシルオキシカルボニル基等を例示することができる。

30

【0035】

X及びZで表されるジ(C1 - C6アルキル)アミノ基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、*N* - エチル - *N*' - メチルアミノ基、ジ(イソプロピル)アミノ基、ジ(*n* - ブチル)アミノ基、ジ(*n* - ペンチル)アミノ基、ジ(*n* - ヘキシル)アミノ基等を例示することができる。

【0036】

X及びZで表される(C1 - C6アルキル)カルボニルアミノ基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、アセチルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、*n* - プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、*tert* - ブチルカルボニルアミノ基等を例示することができる。

40

【0037】

Xで表される(C1 - C6アルキル)カルボニル(C1 - C6アルキル)アミノ基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、*N* - (メチル)アセチルアミノ基、*N* - (エチル) - *n* - プロピルカルボニルアミノ基、*N* - (エチル)イソプロピルカルボニルアミノ基、*N* - (エチル) - *tert* - ブチルカルボニルアミノ基等を例示することができる。

【0038】

50

X及びZで表されるN-(C1-C6アルキル)カルバモイル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、N-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-(n-プロピル)カルバモイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-(n-ヘキシル)カルバモイル基等を例示することができる。

X及びZで表されるN,N'-ジ(C1-C6アルキル)カルバモイル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、N,N'-ジメチルカルバモイル基、N,N'-ジエチルカルバモイル基、N-エチル-N'-メチルカルバモイル基、N-エチル-N'-イソプロピルカルバモイル基等を例示することができる。

Xで表されるC1-C6アルキル基で置換していてもよいトリアゾリル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、1,2,4-トリアゾール-3-イル基、1-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル基、1-エチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル基、1-(n-プロピル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル基、1-イソプロピル-1,2,4-トリアゾール-3-イル基等を例示することができる。

【0039】

Xで表されるC1-C6アルキル基で置換していてもよいオキサジアゾリル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル基、5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル基、5-エチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル基、5-(n-プロピル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル基、5-イソプロピル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル基等を例示することができる。

Xで表されるC1-C6アルキル基で置換していてもよいテトラゾリル基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、テトラゾール-5-イル基、1-メチルテトラゾール-5-イル基、1-エチルテトラゾール-5-イル基、1-(n-プロピル)-テトラゾール-5-イル基、1-イソプロピルテトラゾール-5-イル基、2-メチルテトラゾール-5-イル基、2-エチルテトラゾール-5-イル基、2-(n-プロピル)-テトラゾール-5-イル基、2-イソプロピルテトラゾール-5-イル基等を例示することができる。

Xで表される(C1-C6ハロアルキル基で置換していてもよいテトラゾリル)C1-C6アルキル基としては、(5-トリフルオロメチルテトラゾール-2-イル)メチル基、(5-ペンタフルオロエチルテトラゾール-2-イル)メチル基等を例示することができる。

【0040】

Xで表されるハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基としては、ベンゾイル基、2-フルオロベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-フルオロベンゾイル基、2-クロロベンゾイル基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイル基、2-ブロモベンゾイル基、3-ブロモベンゾイル基、4-ブロモベンゾイル基、2-ヨードベンゾイル基、3-ヨードベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2,4-ジクロロベンゾイル基、2,6-ジクロロベンゾイル基、3,4-ジクロロベンゾイル基、3,5-ジクロロベンゾイル基等を例示することができる。

Xで表されるハロゲン原子で置換していてもよいアリールスルホニル基としては、フェニルスルホニル基、2-フルオロフェニルスルホニル基、3-フルオロフェニルスルホニル基、4-フルオロフェニルスルホニル基、2-クロロフェニルスルホニル基、3-クロロフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルスルホニル基、2-ブロモフェニルスルホニル基、3-ブロモフェニルスルホニル基、4-ブロモフェニルスルホニル基、2-ヨードフェニルスルホニル基、3-ヨードフェニルスルホニル基、4-ヨードフェニルスルホニル基、2,4-ジクロロフェニルスルホニル基、2,6-ジクロロフェニルスルホニル基、3,4-ジクロロフェニルスルホニル基、3,5-ジクロロフェニルスルホニル基、2-ピリジルスルホニル基、5-クロロ-2-ピリジルスルホニル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジルスルホニル基、3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジルスルホニル基、3-ピリジルスルホニル基、6-クロロ-3-ピリジルスルホニル基、

10

20

30

40

50

4 - ピリジルスルホニル基等を例示することができる。

Xで表されるハロゲン原子で置換していてもよいアリーールスルフィニル基としては、フェニルスルフィニル基、2 - フルオロフェニルスルフィニル基、3 - フルオロフェニルスルフィニル基、4 - フルオロフェニルスルフィニル基、2 - クロロフェニルスルフィニル基、3 - クロロフェニルスルフィニル基、4 - クロロフェニルスルフィニル基、2 - ブロモフェニルスルフィニル基、3 - ブロモフェニルスルフィニル基、4 - ブロモフェニルスルフィニル基、2 - ヨードフェニルスルフィニル基、3 - ヨードフェニルスルフィニル基、4 - ヨードフェニルスルフィニル基、2, 4 - ジクロロフェニルスルフィニル基、2, 6 - ジクロロフェニルスルフィニル基、3, 4 - ジクロロフェニルスルフィニル基、3, 5 - ジクロロフェニルスルフィニル基、2 - ピリジルスルフィニル基、5 - クロロ - 2 - ピリジルスルフィニル基、5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルスルフィニル基、3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルスルフィニル基、3 - ピリジルスルホニル基、6 - クロロ - 3 - ピリジルスルフィニル基、4 - ピリジルスルフィニル基等を例示することができる。

10

【0041】

Xで表されるハロゲン原子で置換していてもよいアリーールチオ基としては、フェニルチオ基、2 - フルオロフェニルチオ基、3 - フルオロフェニルチオ基、4 - フルオロフェニルチオ基、2 - クロロフェニルチオ基、3 - クロロフェニルチオ基、4 - クロロフェニルチオ基、2 - ブロモフェニルチオ基、3 - ブロモフェニルチオ基、4 - ブロモフェニルチオ基、2 - ヨードフェニルチオ基、3 - ヨードフェニルチオ基、4 - ヨードフェニルチオ基、2, 4 - ジクロロフェニルチオ基、2, 6 - ジクロロフェニルチオ基、3, 4 - ジクロロフェニルチオ基、3, 5 - ジクロロフェニルチオ基、2 - ピリジルチオ基、5 - クロロ - 2 - ピリジルチオ基、5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルチオ基、3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルチオ基、3 - ピリジルチオ基、6 - クロロ - 3 - ピリジルチオ基、4 - ピリジルチオ基等を例示することができる。

20

Xで表されるハロゲン原子で置換していてもよいアリーールアミノ基としては、フェニルアミノ基、2 - フルオロフェニルアミノ基、3 - フルオロフェニルアミノ基、4 - フルオロフェニルアミノ基、2 - クロロフェニルアミノ基、3 - クロロフェニルアミノ基、4 - クロロフェニルアミノ基、2 - ブロモフェニルアミノ基、3 - ブロモフェニルアミノ基、4 - ブロモフェニルアミノ基、2 - ヨードフェニルアミノ基、3 - ヨードフェニルアミノ基、4 - ヨードフェニルアミノ基、2, 4 - ジクロロフェニルアミノ基、2, 6 - ジクロロフェニルアミノ基、3, 4 - ジクロロフェニルアミノ基、3, 5 - ジクロロフェニルアミノ基、2 - ピリジルアミノ基、5 - クロロ - 2 - ピリジルアミノ基、5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルアミノ基、3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルアミノ基、3 - ピリジルアミノ基、6 - クロロ - 3 - ピリジルアミノ基、4 - ピリジルアミノ基等を例示することができる。

30

【0042】

Xで表されるハロゲン原子で置換していてもよいアリーールオキシ基としては、フェノキシ基、2 - フルオロフェノキシ基、3 - フルオロフェノキシ基、4 - フルオロフェノキシ基、2 - クロロフェノキシ基、3 - クロロフェノキシ基、4 - クロロフェノキシ基、2 - ブロモフェノキシ基、3 - ブロモフェノキシ基、4 - ブロモフェノキシ基、2 - ヨードフェノキシ基、3 - ヨードフェノキシ基、4 - ヨードフェノキシ基、2, 4 - ジクロロフェノキシ基、2, 6 - ジクロロフェノキシ基、3, 4 - ジクロロフェノキシ基、3, 5 - ジクロロフェノキシ基、2 - ピリジルオキシ基、5 - クロロ - 2 - ピリジルオキシ基、5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ基、3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ基、3 - ピリジルオキシ基、6 - クロロ - 3 - ピリジルオキシ基、4 - ピリジルオキシ基等を例示することができる。

40

Xで表されるハロゲン原子で置換していてもよいアリーール基としては、フェニル基、2 - フルオロフェニル基、3 - フルオロフェニル基、4 - フルオロフェニル基、2 - クロロフェニル基、3 - クロロフェニル基、4 - クロロフェニル基、2 - ブロモフェニル基、3

50

- ブロモフェニル基、4 - ブロモフェニル基、2 - ヨードフェニル基、3 - ヨードフェニル基、4 - ヨードフェニル基、2, 4 - ジクロロフェニル基、2, 6 - ジクロロフェニル基、3, 4 - ジクロロフェニル基、3, 5 - ジクロロフェニル基、2 - ピリジル基、5 - クロロ - 2 - ピリジル基、5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジル基、3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジル基、3 - ピリジル基、6 - クロロ - 3 - ピリジル基、4 - ピリジル基等を例示することができる。

【0043】

Zで表されるN - (C1 - C6ハロアルキル)カルバモイル基としては、N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルバモイル基、N - (3, 3, 3 - トリフルオロプロピル)カルバモイル基等を例示することができる。

10

【0044】

Zで表されるN, N' - ジ(C1 - C6アルキル)カルボニルアミノ基としては、直鎖状もしくは分枝状のいずれであってもよく、N, N' - ジアセチルアミノ基、N - アセチル - N' - エチルカルボニルアミノ基、N, N' - ジエチルカルボニルアミノ基、N - アセチル - N' - (n - プロピル)カルボニルアミノ基、N - アセチル - N' - イソプロピルカルボニルアミノ基等を例示することができる。

【0045】

Zで表されるハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基としては、N - (フェニル)カルバモイル基、N - (2 - クロロフェニル)カルバモイル基、N - (3 - クロロフェニル)カルバモイル基、N - (4 - クロロフェニル)カルバモイル基、N - (2 - メチルフェニル)カルバモイル基、N - (3 - メチルフェニル)カルバモイル基、N - (4 - メチルフェニル)カルバモイル基等を例示することができる。

20

【0046】

Zで表される(C1 - C6ハロアルキル)カルボニルアミノ基としては、トリフルオロメチルカルボニルアミノ基、(2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルボニルアミノ基、(3, 3, 3 - トリフルオロプロピル)カルボニルアミノ基等を例示することができる。

【0047】

Zで表されるハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいアリアルカルボニルアミノ基としては、ベンゾイルアミノ基、2 - クロロベンゾイルアミノ基、3 - クロロベンゾイルアミノ基、4 - クロロベンゾイルアミノ基、2 - メチルベンゾイルアミノ基、3 - メチルベンゾイルアミノ基、4 - メチルベンゾイルアミノ基等を例示することができる。

30

【0048】

Qで表される、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシ基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC1 - C6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC3 - C6シクロアルキル基、C1 - C6アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC1 - C6ハロアルキル基、{N - (C1 - C6アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している}C1 - C6ハロアルキル基、{N - (ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよい)アリアルカルバモイル基で置換している}C1 - C6ハロアルキル基、C1 - C6ハロアルコキシ基、C1 - C6アルキルチオ基、C1 - C6ハロアルキルチオ基、C1 - C6アルコキシカルボニル基、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、C1 - C6アルキルカルボニル基、C1 - C6ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、N - (C1 - C6アルキル)カルバモイル基、N - (C1 - C6ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいN - (ピリジル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C1 - C6アルキル)カルバモイル基、N - (C1 - C6アルキルカルボニル)アミノ基、N - (C1 - C6ハロアルキルカルボニル)アミノ基、N - (C1 - C6アルコキシカルボニル)アミノ基、N - (C1 - C6ハロアルコキシカルボニル)ア

40

50

ミノ基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキルスル
 ホニルアミノ基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロ
 アルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよくフ
 ェニル基がハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェニルスルホ
 ニルアミノ基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい(C 1 - C 6 アル
 キル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよ
 いフェニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェノキシ
 基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以
 上の基で置換されていてもよいフェニル基としては、フェニル基、2 - フルオロフェニル
 基、3 - フルオロフェニル基、4 - フルオロフェニル基、2 - クロロフェニル基、3 - ク
 ロロフェニル基、4 - クロロフェニル基、2 - プロモフェニル基、3 - プロモフェニル基
 、4 - プロモフェニル基、2 - メチルフェニル基、3 - メチルフェニル基、4 - メチルフェ
 ニル基、2 - シクロプロピルフェニル基、3 - シクロプロピルフェニル基、4 - シクロ
 プロピルフェニル基、2 - メトキシフェニル基、3 - メトキシフェニル基、4 - メトキシ
 フェニル基、3 - トリフルオロメトキシフェニル基、4 - シアノフェニル基、4 - フェノ
 キシフェニル基、2 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - (トリフルオロメチル)
 フェニル基、4 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - ペンタフルオロスルファニル
 フェニル基、3, 5 - ジクロロフェニル基、2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェ
 ニル基、3 - (トリフルオロメチル) - 4 - クロロフェニル基、3, 5 - ビス(トリフル
 オロメチル)フェニル基、2, 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 4 -
 ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、3, 4 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル
 基、4 - (パーフルオロイソプロピル)フェニル基、2 - クロロ - 3, 5 - ビス(トリフル
 オロメチル)フェニル基、2 - フルオロ - 3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニ
 ル基、3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - フルオロ - 5 - (トリ
 フルオロメチル)フェニル基、3 - プロモ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3
 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - アセチル - 5 - (トリフルオロ
 メチル)フェニル基、3 - トリフルオロアセチル - 5 - (トリフルオロメチル)フェニ
 ル基、3 - シアノ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - シアノメチル - 5 - (トリ
 フルオロメチル)フェニル基、3 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメチル)フェ
 ニル基、3 - (1 - シアノシクロプロピル) - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、
 3 - トリフルオロメトキシ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - メチルチオ -
 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - メチルスルフィニル - 5 - (トリフルオロ
 メチル)フェニル基、3 - メチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、
 3 - トリフルオロメチルチオ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - メトキシカ
 ルボニル - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - エトキシカルボニル - 5 - (トリ
 フルオロメチル)フェニル基、3 - メチルカルバモイル - 5 - (トリフルオロメチル)
 フェニル基、3 - (N - メチルカルバモイル)ジフルオロメチル - 5 - (トリフルオロメ
 チル)フェニル基、3 - (N - フェニルカルバモイル)ジフルオロメチル - 5 - (トリフル
 オロメチル)フェニル基、3 - フェニルアミノカルボニル - 5 - (トリフルオロメチル)
)フェニル基、3 - (2 - ピリジルアミノ)カルボニル - 5 - (トリフルオロメチル)フェ
 ニル基、3 - (3 - ピリジルアミノ)カルボニル - 5 - (トリフルオロメチル)フェ
 ニル基、3 - (4 - ピリジルアミノ)カルボニル - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基
 、3 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、
 3 - (トリフルオロアセチルアミノ) - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3
 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、
 3 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル基、3 - フェノキシ - 5 - (トリフル
 オロメチル)フェニル基、3 - シアノジフルオロメチル - 5 - (トリフルオロメチル)
 フェニル基、4 - tert - ブチルフェニル基、4 - ビフェニル基、4 - クロロ - 3, 5
 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、4 - メチル - 3, 5 - ビス(トリフルオロメ
 チル)フェニル基、3 - {N - (4 - クロロフェニル)カルバモイル} - 5 - (トリフルオ

10

20

30

40

50

ロメチル)フェニル基、3-カルバモイルジフルオロメチル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-トリフルオロメチル-5-(メチルアミノカルボニルジフルオロメチル)フェニル基、3-ベンゾイル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-トリフルオロメチル-5-{(N-フェニルカルバモイル)ジフルオロメチル}フェニル基、3-(1,1'-ジフルオロエチル)-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-カルボキシル-5-(トリフルオロメチル)フェニル基等を例示することができる。

【0049】

Qで表される、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC1-C6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC3-C6シクロアルキル基、C1-C6アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC1-C6ハロアルキル基、{N-(C1-C6アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している}C1-C6ハロアルキル基、{N-(ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していてもよい)アリールカルバモイル基で置換している}C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、C1-C6ハロアルキルチオ基、C1-C6アルコキシカルボニル基、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、C1-C6アルキルカルボニル基、C1-C6ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、N-(C1-C6アルキル)カルバモイル基、N-(C1-C6ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していてもよいN-(フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していてもよいN-(ピリジル)カルバモイル基、N,N'-ジ(C1-C6アルキル)カルバモイル基、N-(C1-C6アルキルカルボニル)アミノ基、N-(C1-C6ハロアルキルカルボニル)アミノ基、N-(C1-C6アルコキシカルボニル)アミノ基、N-(C1-C6ハロアルコキシカルボニル)アミノ基、窒素原子がC1-C6アルキル基で置換していてもよいC1-C6アルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1-C6アルキル基で置換していてもよいC1-C6ハロアルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1-C6アルキル基で置換していてもよくフェニル基がハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していてもよいフェニルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1-C6アルキル基で置換していてもよい(C1-C6アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいピリジル基としては、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、6-クロロ-2-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基、2-クロロ-4-ピリジル基、6-プロモ-2-ピリジル基、5-プロモ-3-ピリジル基、2-プロモ-4-ピリジル基、6-メチル-2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、4-クロロ-2-ピリジル基、4-シアノ-2-ピリジル基、2-メチル-4-ピリジル基、2-トリフルオロメチル-4-ピリジル基、6-シクロプロピル-3-ピリジル基、6-メトキシ-2-ピリジル基、6-メトキシ-3-ピリジル基、3-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、4-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、6-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、4-ペンタフルオロエチル-2-ピリジル基、5-ペンタフルオロエチル-3-ピリジル基、4-ペンタフルオロスルファニル-2-ピリジル基、4,6-ビストリフルオロメチル-2-ピリジル基、2,5-ビストリフルオロメチル-4-ピリジル基、3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、3-シアノ-4,6-ビストリフルオロメチル-2-ピリジル基、3-クロロ-4-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、4-トリフルオロメチル-5-クロロ-2-ピリジル基、4-トリフルオロメチル-6-クロロ-2-ピリジル基、4-トリフルオロメチル-3-プロモ-2-ピリジル基、4-トリフルオロメチル-5-プロモ-2-ピリジル基、4-トリフルオロメチル-6-プロモ-2-ピリジル基、3,5-ジクロロ-4-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、3-フルオロ-4-トリフルオロ

10

20

30

40

50

メチル - 2 - ピリジル基、4 - トリフルオロメチル - 5 - フルオロ - 2 - ピリジル基、4 - トリフルオロメチル - 6 - フルオロ - 2 - ピリジル基、3, 5 - ジフルオロ - 4 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジル基、4 - トリフルオロメチル - 6 - メトキシ - 2 - ピリジル基、4 - トリフルオロメチル - 6 - シアノ - 2 - ピリジル基、4 - トリフルオロメチル - 6 - シクロプロピル - 2 - ピリジル基、4 - トリフルオロメチル - 3 - ピリジル基、5 - トリフルオロメチル - 3 - ピリジル基、6 - トリフルオロメチル - 3 - ピリジル基、2 - フルオロ - 5 - トリフルオロメチル - 3 - ピリジル基、3 - トリフルオロメチル - 4 - ピリジル基、4 - トリフルオロメトキシ - 2 - ピリジル基、5 - トリフルオロメトキシ - 2 - ピリジル基、5 - メチルチオ - 2 - ピリジル基、4 - メチルチオ - 2 - ピリジル基、5 - メチルスルフィニル - 2 - ピリジル基、4 - メチルスルフィニル - 2 - ピリジル基、5 - メチルスルホニル - 2 - ピリジル基、4 - メチルスルホニル - 2 - ピリジル基、4 - トリフルオロメチルチオ - 2 - ピリジル基、4 - トリフルオロメチルスルフィニル - 2 - ピリジル基、4 - トリフルオロメチルスルホニル - 2 - ピリジル基、3 - N - メチルカルバモイル - 2 - ピリジル基、3 - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)カルバモイル - 2 - ピリジル基、3 - N, N' - ジメチルカルバモイル - 2 - ピリジル基、3 - メチルスルホニルアミノ - 2 - ピリジル基、5 - トリフルオロメチルスルホニルアミノ - 2 - ピリジル基、5 - フェニルスルホニルアミノ - 2 - ピリジル基、5 - メチルアミノスルホニル - 2 - ピリジル基等を例示することができる。

10

【0050】

Qで表される、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC1 - C6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC3 - C6シクロアルキル基、C1 - C6アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC1 - C6ハロアルキル基、{N - (C1 - C6アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している}C1 - C6ハロアルキル基、{N - (ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよい)アリールカルバモイル基で置換している}C1 - C6ハロアルキル基、C1 - C6ハロアルコキシ基、C1 - C6アルキルチオ基、C1 - C6ハロアルキルチオ基、C1 - C6アルコキシカルボニル基、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、C1 - C6アルキルカルボニル基、C1 - C6ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、N - (C1 - C6アルキル)カルバモイル基、N - (C1 - C6ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいN - (ピリジル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C1 - C6アルキル)カルバモイル基、N - (C1 - C6アルキルカルボニル)アミノ基、N - (C1 - C6ハロアルキルカルボニル)アミノ基、N - (C1 - C6アルコキシカルボニル)アミノ基、N - (C1 - C6ハロアルコキシカルボニル)アミノ基、窒素原子がC1 - C6アルキル基で置換していてもよいC1 - C6アルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1 - C6アルキル基で置換していてもよいC1 - C6ハロアルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1 - C6アルキル基で置換していてもよくフェニル基がハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいフェニルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1 - C6アルキル基で置換していてもよい(C1 - C6アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいチアゾリル基としては、2 - チアゾリル基、4 - メチルチアゾール - 2 - イル基、4 - トリフルオロメチルチアゾール - 2 - イル基、4 - クロロチアゾール - 2 - イル基、4, 5 - ジメチルチアゾール - 2 - イル基、5 - トリフルオロメチルチアゾール - 2 - イル基等を例示することができる。

20

30

40

【0051】

Qで表される、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC1 - C6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC3 -

50

C₆シクロアルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC₁-C₆ハロアルキル基、{N-(C₁-C₆アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している}C₁-C₆ハロアルキル基、{N-(ハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよい)アリールカルバモイル基で置換している}C₁-C₆ハロアルキル基、C₁-C₆ハロアルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆ハロアルキルチオ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、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、C₁-C₆アルキルカルボニル基、C₁-C₆ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、N-(C₁-C₆アルキル)カルバモイル基、N-(C₁-C₆ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいN-(フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいN-(ピリジル)カルバモイル基、N,N'-ジ(C₁-C₆アルキル)カルバモイル基、N-(C₁-C₆アルキルカルボニル)アミノ基、N-(C₁-C₆ハロアルキルカルボニル)アミノ基、N-(C₁-C₆アルコキシカルボニル)アミノ基、N-(C₁-C₆ハロアルコキシカルボニル)アミノ基、窒素原子がC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいC₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいC₁-C₆ハロアルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC₁-C₆アルキル基で置換していてもよくフェニル基がハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいフェニルスルホニルアミノ基、窒素原子がC₁-C₆アルキル基で置換していてもよい(C₁-C₆アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいキノリル基としては、2-キノリル基、3-キノリル基、4-キノリル基、5-キノリル基、6-キノリル基、7-キノリル基、8-キノリル基、4-メチル-2-キノリル基、4-トリフルオロメチル-2-キノリル基、8-トリフルオロメチル-2-キノリル基、4-クロロ-6-キノリル基、4-シアノ-8-トリフルオロメチル-6-キノリル基等を例示することができる。

【0052】

Qで表される、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC₁-C₆アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC₃-C₆シクロアルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC₁-C₆ハロアルキル基、{N-(C₁-C₆アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している}C₁-C₆ハロアルキル基、{N-(ハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよい)アリールカルバモイル基で置換している}C₁-C₆ハロアルキル基、C₁-C₆ハロアルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆ハロアルキルチオ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、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、C₁-C₆アルキルカルボニル基、C₁-C₆ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、N-(C₁-C₆アルキル)カルバモイル基、N-(C₁-C₆ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいN-(フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいN-(ピリジル)カルバモイル基、N,N'-ジ(C₁-C₆アルキル)カルバモイル基、N-(C₁-C₆アルキルカルボニル)アミノ基、N-(C₁-C₆ハロアルキルカルボニル)アミノ基、N-(C₁-C₆アルコキシカルボニル)アミノ基、N-(C₁-C₆ハロアルコキシカルボニル)アミノ基、窒素原子がC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいC₁-C₆アルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいC₁-C₆ハロアルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC₁-C₆アルキル基で置換していてもよくフェニル基がハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよいフェニルスルホニルアミノ基、窒素原子がC₁-C₆アルキル基で置換していてもよい(C₁-C₆アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC₁-C₆アルキル基で置換していてもよ

10

20

30

40

50

いフェニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいベンゾオキサゾリル基としては、2 - ベンゾオキサゾリル基、5 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イル基、5 - メトキシベンゾオキサゾール - 2 - イル基、5 - フルオロベンゾオキサゾール - 2 - イル基、5 - クロロベンゾオキサゾール - 2 - イル基、5 - ブロモベンゾオキサゾール - 2 - イル基、5 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イル基、6 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イル基、6 - フルオロベンゾオキサゾール - 2 - イル基等を例示することができる。

【0053】

Qで表される、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6シクロアルキル基、C 1 - C 6アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6ハロアルキル基、{ N - (C 1 - C 6アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している } C 1 - C 6ハロアルキル基、{ N - (ハロゲン原子又はC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよい)アリアルカルバモイル基で置換している } C 1 - C 6ハロアルキル基、C 1 - C 6ハロアルコキシ基、C 1 - C 6アルキルチオ基、C 1 - C 6ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6アルコキシカルボニル基、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、C 1 - C 6アルキルカルボニル基、C 1 - C 6ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、N - (C 1 - C 6アルキル)カルバモイル基、N - (C 1 - C 6ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよいN - (ピリジル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C 1 - C 6アルキル)カルバモイル基、N - (C 1 - C 6アルキルカルボニル)アミノ基、N - (C 1 - C 6ハロアルキルカルボニル)アミノ基、N - (C 1 - C 6アルコキシカルボニル)アミノ基、N - (C 1 - C 6ハロアルコキシカルボニル)アミノ基、窒素原子がC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよいC 1 - C 6アルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよいC 1 - C 6ハロアルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよくフェニル基がハロゲン原子又はC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよいフェニルスルホニルアミノ基、窒素原子がC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよい(C 1 - C 6アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいベンゾチアゾリル基としては、2 - ベンゾチアゾリル基、5 - メチルベンゾチアゾール - 2 - イル基、5 - メトキシベンゾチアゾール - 2 - イル基、5 - フルオロベンゾチアゾール - 2 - イル基、5 - クロロベンゾチアゾール - 2 - イル基、5 - ブロモベンゾチアゾール - 2 - イル基、5 - トリフルオロメチルベンゾチアゾール - 2 - イル基、6 - トリフルオロメチルベンゾチアゾール - 2 - イル基、6 - メチルベンゾチアゾール - 2 - イル基、6 - フルオロベンゾチアゾール - 2 - イル基等を例示することができる。

【0054】

Qで表される、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシル基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6シクロアルキル基、C 1 - C 6アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6ハロアルキル基、{ N - (C 1 - C 6アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している } C 1 - C 6ハロアルキル基、{ N - (ハロゲン原子又はC 1 - C 6アルキル基で置換していてもよい)アリアルカルバモイル基で置換している } C 1 - C 6ハロアルキル基、C 1 - C 6ハロアルコキシ基、C 1 - C 6アルキルチオ基、C 1 - C 6ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6アルコキシカルボニル基、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、C 1 - C 6アルキルカルボニル基、C 1 - C

10

20

30

40

50

6 ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、N - (C1 - C6アルキル)カルバモイル基、N - (C1 - C6ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいN - (ピリジル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C1 - C6アルキル)カルバモイル基、N - (C1 - C6アルキルカルボニル)アミノ基、N - (C1 - C6ハロアルキルカルボニル)アミノ基、N - (C1 - C6アルコキシカルボニル)アミノ基、N - (C1 - C6ハロアルコキシカルボニル)アミノ基、窒素原子がC1 - C6アルキル基で置換していてもよいC1 - C6アルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1 - C6アルキル基で置換していてもよいC1 - C6ハロアルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1 - C6アルキル基で置換していてもよくフェニル基がハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいフェニルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1 - C6アルキル基で置換していてもよい(C1 - C6アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC1 - C6アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいベンゾイミダゾリル基、としては、1 - メチル - 2 - ベンゾイミダゾリル基、1, 5 - ジメチル - 2 - ベンゾイミダゾリル基、1 - メチル - 5 - メトキシ - 2 - ベンゾイミダゾール - 2 - イル基、1 - メチル - 5 - クロロ - 2 - ベンゾイミダゾール - 2 - イル基、1 - メチル - 5 - プロモベンゾイミダゾール - 2 - イル基、1 - メチル - 5 - トリフルオロメチルベンゾイミダゾール - 2 - イル基、1 - メチル - 6 - トリフルオロメチルベンゾイミダゾール - 2 - イル基、1 - メチル - 6 - クロロベンゾイミダゾール - 2 - イル基、1, 6 - ジメチル - 2 - ベンゾイミダゾリル基等を例示することができる。

10

20

【0055】

一般式(1)中のRとしては、C1 - C6アルキル基であることが好ましく、エチル基であることがより好ましい。

【0056】

一般式(1)中のW¹及びW²としては、CHであることがより好ましい。

【0057】

一般式(1)中のXとしては、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、カルボキシル基、水酸基もしくはシアノ基で置換していてもよいC1 - C6アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC3 - C6シクロアルキル基、(C1 - C6アルコキシ)C1 - C6フルオロアルキル基、C1 - C6アルコキシ基、(C1 - C6アルコキシ)C1 - C6アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC1 - C6ハロアルキル基、C1 - C6ハロアルコキシ基、C1 - C6アルキルカルボニル基、C1 - C6ハロアルキルスルホニルオキシ基、C1 - C6アルキルチオ基、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、C1 - C6ハロアルキルチオ基、C1 - C6ハロアルキルスルフィニル基、C1 - C6ハロアルキルスルホニル基、C1 - C6アルキルアミノ基、(C1 - C6アルコキシ)カルボニル基、ジ(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、(C1 - C6アルキル)カルボニル(C1 - C6アルキル)アミノ基、N - (C1 - C6アルキル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C1 - C6アルキル)カルバモイル基、ペンタフルオロスルファニル基、C1 - C6アルキル基で置換していてもよいトリアゾリル基、C1 - C6アルキル基で置換していてもよいオキサジアゾリル基、C1 - C6アルキル基で置換していてもよいテトラゾリル基、(C1 - C6ハロアルキル基で置換していてもよいテトラゾリル)C1 - C6アルキル基、ハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールスルホニル基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールスルフィニル基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールチオ基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールアミノ基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールオキシ基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基が好ましく、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、水酸基、カルボキ

30

40

50

シル基、水酸基もしくはシアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、(C 1 - C 6 アルコキシ)C 1 - C 6 フルオロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、(C 1 - C 6 アルコキシ)C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニルオキシ基、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、C 1 - C 6 アルキルスルホニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、(C 1 - C 6 アルコキシ)カルボニル基、N - (C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、ペンタフルオロスルファニル基、C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいトリアゾリル基、C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいオキサジアゾリル基、C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいテトラゾリル基、(C 1 - C 6 ハロアルキル基で置換していてもよいテトラゾリル)C 1 - C 6 アルキル基、ハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールスルホニル基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールスルフィニル基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールチオ基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールアミノ基、ハロゲン原子で置換していてもよいアリールオキシ基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基がより好ましく、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 ハロアルキルスルホニルオキシ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、(C 1 - C 6 アルコキシ)カルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいトリアゾリル基、C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいオキサジアゾリル基、C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいテトラゾリル基、又はハロゲン原子で置換していてもよいアリール基がさらに好ましい。

10

20

【0058】

一般式(1)中のQとしては、上記の置換基群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいフェニル基又はピリジル基が好ましく、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、カルボキシ基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、{N-(C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している}C 1 - C 6 ハロアルキル基、{N-(ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい)アリールカルバモイル基で置換している}C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、C 1 - C 6 アルコキシカルボニル基、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、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルカルボニル基、ペンタフルオロスルファニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいN-(フェニル)カルバモイル基、窒素原子がC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい(C 1 - C 6 アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいフェニル基又はピリジル基がより好ましい。

30

40

【0059】

上記の置換基群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいフェニル基としては、ハロゲン原子、シアノ基、カルボキシ基、水酸基又はシアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、{N-(C 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい)カルバモイル基で置換している}C 1 - C 6 ハロアルキル基、{N-(ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよい)アリールカルバモイル基で置換している}C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルコキシカルボニル基、C 1 - C 6 アルキルカルボ

50

ニル基、ペンタフルオロスルファニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェニル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいフェノキシ基及びハロゲン原子で置換していてもよいベンゾイル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいフェニル基がさらに好ましく、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルコキシカルボニル基、及びペンタフルオロスルファニル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいフェニル基が特に好ましい。

【0060】

上記の置換基群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいピリジル基としては、ハロゲン原子、シアノ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 アルキル基、シアノ基で置換していてもよいC 3 - C 6 シクロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシ基、シアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 ハロアルコキシ基、C 1 - C 6 アルキルチオ基、C 1 - C 6 ハロアルキルチオ基、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、C 1 - C 6 アルキルカルボニル基、C 1 - C 6 ハロアルキルカルボニル基及びペンタフルオロスルファニル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいピリジル基がさらに好ましく、ハロゲン原子、シアノ基、C 1 - C 6 アルコキシ基、及びシアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいピリジル基が特に好ましく、ハロゲン原子、シアノ基及びシアノ基で置換していてもよいC 1 - C 6 ハロアルキル基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていてもよいピリジル基が最も好ましい。

【0061】

一般式(1)中のZとしては、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、アミノ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C 1 - C 6 アルキル基、C 3 - C 6 シクロアルキル基、(C 1 - C 6 アルコキシ)C 1 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 ハロアルキル基、C 1 - C 6 アルコキシカルボニル基、N - (C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、(C 1 - C 6 ハロアルキル)カルボニルアミノ基、N, N' - ジ(C 1 - C 6 アルキル)カルボニルアミノ基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいアリールカルボニルアミノ基が好ましく、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、アミノ基、カルボキシル基、カルバモイル基、C 1 - C 6 アルキル基、(C 1 - C 6 アルコキシ)C 1 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 アルコキシカルボニル基、N - (C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいN - (フェニル)カルバモイル基、N, N' - ジ(C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基、(C 1 - C 6 ハロアルキル)カルボニルアミノ基、N, N' - ジ(C 1 - C 6 アルキル)カルボニルアミノ基、ハロゲン原子又はC 1 - C 6 アルキル基で置換していてもよいアリールカルボニルアミノ基がより好ましく、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、アミノ基、C 1 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 アルコキシカルボニル基、N, N' - ジ(C 1 - C 6 アルキル)カルバモイル基がさらに好ましく、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、アミノ基、C 1 - C 6 アルキル基が特に好ましい。

【0062】

尚、本願における好ましい一態様としては、一般式(1)で表される1, 2, 3 - トリアゾール誘導体が、下記一般式(1A)で表される1, 2, 3 - トリアゾール誘導体である。

【0063】

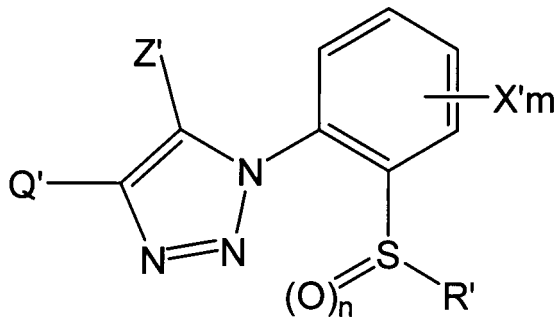
10

20

30

40

【化2】



(1A)

10

【0064】

上記一般式(1A)中

R'はC1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基を表す。

nは0~2の整数を表す。

X'は、水素原子、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、C3-C6シクロアルキル基、C1-C6アルコキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、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、C1-C6アルキルアミノ基、(C1-C6アルコキシ)カルボニル基、ジ(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、(C1-C6アルキル)カルボニル(C1-C6アルキル)アミノ基、N-(C1-C6アルキル)カルバモイル基又はN,N-ジ(C1-C6アルキル)カルバモイル基を表す。

20

mは1~4の整数を表し、mが2以上の整数を表す場合は、各々のXは同一でも相異なってもよい。

Q'は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、C3-C6シクロアルキル基、C1-C6アルコキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6ハロアルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、C1-C6ハロアルキルチオ基、C1-C6アルコキシカルボニル基、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、N-(C1-C6アルキル)カルバモイル基、N-(C1-C6ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していても良いN-(フェニル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していても良いN-(ピリジル)カルバモイル基、N,N-ジ(C1-C6アルキル)カルバモイル基、N-(C1-C6アルキルカルボニル)アミノ基、N-(C1-C6ハロアルキルカルボニル)アミノ基、N-(C1-C6アルコキシカルボニル)アミノ基、N-(C1-C6ハロアルコキシカルボニル)アミノ基、窒素原子がC1-C6アルキル基で置換していても良いC1-C6アルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1-C6アルキル基で置換していても良いC1-C6ハロアルキルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1-C6アルキル基で置換していても良いフェニル基がハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していても良いフェニルスルホニルアミノ基、窒素原子がC1-C6アルキル基で置換していても良い(C1-C6アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していても良いフェニル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していても良いフェノキシ基からなる群より選択される1つ以上の基で置換されていても良いフェニル基又はピリジル基を表す。

30

40

Z'は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、C1-C6アルキル基、C3-C6シクロアルキル基、C1-C6アルコキシ基、C1-C6ハロアルキル基、C1-C6アルキルチオ基、C1-C6ハロアルキルチオ基、C1-C6アルコキシカルボニル基、N-(C1-C6アルキル)カルバモイル基、N-(C1-C6ハロアルキル)カルバモイル基、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基で置換していても良いN-(フェニル)カルバ

50

モイル基、N,N-ジ(C1-C6アルキル)カルバモイル基、アミノ基、C1-C6アルキルアミノ基、ジ(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又は(C1-C6ハロアルキル)カルボニルアミノ基を表す。

【0065】

R'の各基としては、一般式(1)のRにおいて説明した、対応する各基を挙げることができる。

X'の各基としては、一般式(1)のXにおいて説明した、対応する各基を挙げることができる。

【0066】

Q'の各基としては、一般式(1)のQにおいて説明した、対応する各基を挙げることができる。

10

Z'の各基としては、一般式(1)のZにおいて説明した、対応する各基を挙げることができる。

【0067】

なお、式(1)において表される1,2,3-トリアゾール誘導体の代表例を下記表1~4にまとめて例示するが、これらの化合物に限定されるものではない。これらの化合物には光学異性体およびE体、Z体を含む化合物が含まれる。化合物番号は以後の記載において参照される。

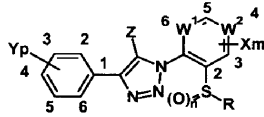
表中及び本願明細書中の次の表記は、下記のとおりそれぞれの該当する基を表す。

また、「Me」はメチル基、「Et」はエチル基、「n-Pr」はノルマルプロピル基、「i-Pr」はイソプロピル基、「c-Pr」はシクロプロピル基、「n-Bu」はノルマルブチル基、「n-Pen」はノルマルペンチル基、「tert-Bu」はターシャリーブチル基、「n-Pen」はノルマルペンチル基、「n-Hex」はノルマルヘキシル基、「Ac」はアセチル基、「Ph」はフェニル基を表す。

20

【0068】

【表 1 - 1】



化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-1	Me	0	H	H	H	CH	CH		
1-2	Me	0	H	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-3	Me	0	H	3-CF ₃	Me	CH	CH		
1-4	Me	0	H	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-5	Me	0	H	4-CF ₃	Me	CH	CH		
1-6	Me	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-7	Me	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-8	Me	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	F	CH	CH		
1-9	Me	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-10	Me	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-11	Me	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-12	Me	0	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-13	Me	0	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-14	Me	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-15	Me	0	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-16	Et	0	H	H	H	CH	CH	薄黄色固体	88-90
1-17	Et	0	H	H	Me	CH	CH		
1-18	Et	0	H	H	Cl	CH	CH		
1-19	Et	0	H	H	Br	CH	CH		
1-20	Et	0	H	H	I	CH	CH		
1-21	Et	0	H	3-Cl	H	CH	CH	赤褐色油状	
1-22	Et	0	H	4-Cl	H	CH	CH	無色油状	
1-23	Et	0	H	3-Br	H	CH	CH	赤褐色油状	
1-24	Et	0	H	3-OCF ₃	H	CH	CH	赤褐色油状	
1-25	Et	0	H	2-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-26	Et	0	H	3-CF ₃	H	CH	CH	褐色油状	
1-27	Et	0	H	3-CF ₃	Me	CH	CH	赤褐色油状	
1-28	Et	0	H	3-CF ₃	Et	CH	CH	赤褐色油状	
1-29	Et	0	H	3-CF ₃	Cl	CH	CH	黄色固体	87-90
1-30	Et	0	H	3-CF ₃	Br	CH	CH		
1-31	Et	0	H	3-CF ₃	I	CH	CH	白色固体	136-139
1-32	Et	0	3-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-33	Et	0	4-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-34	Et	0	5-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-35	Et	0	6-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-36	Et	0	3-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-37	Et	0	4-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-38	Et	0	5-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH	黄色油状	
1-39	Et	0	6-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-40	Et	0	H	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	114-115
1-41	Et	0	H	4-CF ₃	Me	CH	CH		
1-42	Et	0	H	4-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-43	Et	0	H	4-CF ₃	Br	CH	CH		
1-44	Et	0	H	4-CF ₃	I	CH	CH		
1-45	Et	0	3-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		

10

20

30

【 0 0 6 9 】

【表 1 - 2】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-46	Et	0	4-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-47	Et	0	5-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-48	Et	0	6-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-49	Et	0	3-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-50	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-51	Et	0	5-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-52	Et	0	6-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-53	Et	0	H	4-tert-Bu	H	CH	CH	無色油状	
1-54	Et	0	H	4-Ph	H	CH	CH	茶色固体	117-121
1-55	Et	0	H	4-OPh	H	CH	CH	褐色油状	
1-56	Et	0	H	4-CN	H	CH	CH	黄色固体	72-76
1-57	Et	0	H	2-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	<60
1-58	Et	0	H	2-Cl-4-CF ₃	Me	CH	CH		
1-59	Et	0	H	2-Cl-4-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-60	Et	0	H	2-Cl-4-CF ₃	Br	CH	CH		
1-61	Et	0	H	2-Cl-4-CF ₃	I	CH	CH		
1-62	Et	0	H	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-63	Et	0	H	3-Me-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-64	Et	0	H	3-Me-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-65	Et	0	H	3-Me-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-66	Et	0	H	3-Me-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-67	Et	0	3-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-68	Et	0	4-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-69	Et	0	5-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-70	Et	0	6-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-71	Et	0	3-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-72	Et	0	4-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-73	Et	0	5-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-74	Et	0	6-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-75	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	67
1-76	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-77	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	c-Pr	CH	CH		
1-78	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH	CH		
1-79	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-80	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-81	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH	白色固体	122-125
1-82	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	NH ₂	CH	CH	赤褐色油状	
1-83	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	CO ₂ Et	CH	CH	黄色油状	
1-84	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	CN	CH	CH	黄色固体	119-121
1-85	Et	0	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	118-120
1-86	Et	0	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	115-118
1-87	Et	0	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	98-100
1-88	Et	0	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	119-124
1-89	Et	0	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-90	Et	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	125-127
1-91	Et	0	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	無色油状	98-100
1-92	Et	0	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-93	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-94	Et	0	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-95	Et	0	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-96	Et	0	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-97	Et	0	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-98	Et	0	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-99	Et	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-100	Et	0	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		

【 0 0 7 0 】

10

20

30

【表 1 - 3】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-101	Et	0	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-102	Et	0	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-103	Et	0	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-104	Et	0	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-105	Et	0	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-106	Et	0	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-107	Et	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-108	Et	0	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-109	Et	0	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-110	Et	0	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-111	Et	0	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-112	Et	0	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-113	Et	0	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-114	Et	0	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-115	Et	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-116	Et	0	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-117	Et	0	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-118	Et	0	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-119	Et	0	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-120	Et	0	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-121	Et	0	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-122	Et	0	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-123	Et	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-124	Et	0	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-125	Et	0	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-126	Et	0	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-127	Et	0	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-128	Et	0	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-129	Et	0	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-130	Et	0	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-131	Et	0	3-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-132	Et	0	4-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-133	Et	0	5-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-134	Et	0	6-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-135	Et	0	3-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-136	Et	0	4-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-137	Et	0	5-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-138	Et	0	6-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-139	Et	0	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-140	Et	0	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-141	Et	0	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-142	Et	0	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-143	Et	0	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-144	Et	0	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-145	Et	0	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-146	Et	0	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-147	Et	0	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-148	Et	0	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-149	Et	0	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-150	Et	0	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-151	Et	0	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-152	Et	0	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-153	Et	0	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-154	Et	0	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-155	Et	0	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		

10

20

30

【 0 0 7 1 】

【表 1 - 4】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-156	Et	0	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-157	Et	0	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-158	Et	0	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-159	Et	0	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-160	Et	0	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-161	Et	0	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-162	Et	0	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-163	Et	0	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-164	Et	0	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-165	Et	0	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-166	Et	0	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-167	Et	0	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-168	Et	0	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-169	Et	0	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-170	Et	0	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-171	Et	0	H	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-172	Et	0	H	3-F-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-173	Et	0	H	3-F-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-174	Et	0	H	3-F-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-175	Et	0	H	3-F-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-176	Et	0	3-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-177	Et	0	4-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-178	Et	0	5-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-179	Et	0	6-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-180	Et	0	3-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-181	Et	0	4-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-182	Et	0	5-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-183	Et	0	6-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-184	Et	0	H	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-185	Et	0	H	3-Cl-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-186	Et	0	H	3-Cl-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-187	Et	0	H	3-Cl-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-188	Et	0	H	3-Cl-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-189	Et	0	3-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-190	Et	0	4-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-191	Et	0	5-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-192	Et	0	6-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-193	Et	0	3-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-194	Et	0	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-195	Et	0	5-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-196	Et	0	6-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-197	Et	0	H	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-198	Et	0	H	3-Br-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-199	Et	0	H	3-Br-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-200	Et	0	H	3-Br-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-201	Et	0	H	3-Br-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-202	Et	0	3-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-203	Et	0	4-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-204	Et	0	5-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-205	Et	0	6-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-206	Et	0	3-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-207	Et	0	4-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-208	Et	0	5-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-209	Et	0	6-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-210	Et	0	H	3-CO ₂ Me-5-CF ₃	H	CH	CH	黄色固体	97-100





10

20

30

【 0 0 7 2 】

【表 1 - 5】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-211	Et	0	H	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-212	Et	0	4-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-213	Et	0	5-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-214	Et	0	6-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-215	Et	0	3-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-216	Et	0	4-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-217	Et	0	5-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-218	Et	0	6-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-219	Et	0	H	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-220	Et	0	4-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-221	Et	0	5-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-222	Et	0	6-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-223	Et	0	3-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-224	Et	0	4-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-225	Et	0	5-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-226	Et	0	6-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-227	Et	0	H	3-CONHPh-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	89-96
1-228	Et	0	H	3-CONH(4-ClC ₆ H ₄)-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	93-106
1-229	Et	0	5-F	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	72-77
1-230	Et	0	5-Me	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	橙色固体	98-99
1-231	Et	0	5-OMe	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	橙色油状	
1-232	Et	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	N	CH	白色固体	138-138
1-233	Et	0	H	4-CF(CF ₃) ₂	H	CH	CH	薄黄色固体	134-138
1-234	Et	0	H	3-CF ₂ CONH ₂ -5-CF ₃	H	CH	CH	黄色固体	82-84
1-235	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	F	CH	CH	無色油状	
1-236	Et	0	H	3-SF ₅	H	CH	CH	白色固体	62-63
1-237	Et	0	H	3-Ac-5-CF ₃	H	CH	CH	黄色油状	
1-238	Et	0	H	3-CF ₃ -5-CF ₂ CONHMe	H	CH	CH	黄色油状	
1-239	Et	0	H	3,5-Cl ₂	H	CH	CH	白色固体	113-114
1-240	Et	0	H	3-CF ₂ CN-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	66-68
1-241	Et	0	H	3-COPh-5-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-242	Et	0	H	3-CF ₃ -5-CF ₂ CONHPh	H	CH	CH	白色固体	125-127
1-243	Et	0	H	3-CF ₂ Me-5-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-244	CHFCH ₃	0	H	3-CF ₂ Me-5-CF ₃	H	CH	CH	薄黄色油状	
1-245	Et	0	H	3-Ph-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	130-131
1-246	Et	0	H	3-(c-Pr)-5-CF ₃	H	CH	CH	橙色油状	
1-247	Et	0	4-Ph	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	92-93
1-248	Et	0	4-(4-ClC ₆ H ₄)	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	170-171
1-249	Et	0	4-OPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	無色油状	
1-250	Et	0	4-CN	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	187-188
1-251	Et	0	4-Br	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	125-126
1-252	Et	0		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	茶色固体	205-206
1-253	Et	0		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-254	Et	0		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	162-164
1-255	Et	0	4-(c-Pr)	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	110-112
1-256	Et	0	H	3-CH ₂ CN-5-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-257	Et	0	4-COOH	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	薄黄色固体	248-250
1-258	Et	0	4-CH ₂ OH	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	122-126
1-259	Et	0	H	3-(1-cyanocyclopropyl)-5-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-260	Et	0		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		

【 0 0 7 3 】

10

20

30

40

【表 1 - 6】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-261	Et	0	4-NHPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	無色油状	
1-262	Et	0	4-SOPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-263	Et	0	4-SPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-264	Et	0	4-SO ₂ Ph	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-265	Et	0	4-COOEt	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		156-159
1-266	Et	0	4-CONHMe	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	209-211
1-267	Et	0	4-CH ₂ CN	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	146-149
1-268	Et	0	4- 	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	橙色固体	130-133
1-269	Et	0	6-COOEt	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	114-117
1-270	Et	0	6-CONHMe	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	218-219
1-271	Et	0	4-Cl-6-SEt	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	169-171
1-272	Et	0	4-Cl-6-SO ₂ Et	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-273	Et	0	4-Ac	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	163-165
1-274	Et	0	4-COPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	147-150
1-275	Et	0	H	2-F-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	60>
1-276	Et	0	4- 	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-277	Et	0	4-I	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	橙色固体	113-118
1-278	Et	0	4-OCF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	91-94
1-279	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃	H	N	CH	白色固体	101-103
1-280	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	COOH	CH	CH	白色固体	158-161
1-281	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	GONH ₂	CH	CH	白色固体	227-232
1-282	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONHPh	CH	CH	白色固体	173-175
1-283	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONH(4-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	207-209
1-284	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONHMe	CH	CH	白色固体	136-139
1-285	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONMe ₂	CH	CH	黄色油状	
1-286	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCOCF ₃	CH	CH	白色固体	166-169
1-287	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCOPh	CH	CH	橙色固体	160-164
1-288	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCO(3-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	橙色固体	138-140
1-289	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCO(4-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	204-208
1-290	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	NAc ₂	CH	CH	薄黄色油状	
1-291	Et	0	H	3-COOH-5-CF ₃	H	CH	CH	薄黄色固体	208-209
1-292	Et	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCO(2-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	橙色固体	155-158
1-293	Et	0	4-CF(CF ₃) ₂	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-294	Et	0	4-SF ₅	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-295	Et	1	H	H	H	CH	CH	白色固体	161-165
1-296	Et	1	H	H	Me	CH	CH		
1-297	Et	1	H	H	Cl	CH	CH		
1-298	Et	1	H	H	Br	CH	CH		
1-299	Et	1	H	H	I	CH	CH		
1-300	Et	1	H	3-Cl	H	CH	CH	白色固体	134-136
1-301	Et	1	H	4-Cl	H	CH	CH	白色固体	180-181
1-302	Et	1	H	3-Br	H	CH	CH	白色固体	141-144
1-303	Et	1	H	3-OCF ₃	H	CH	CH	白色固体	109-112
1-304	Et	1	H	2-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	131-133
1-305	Et	1	H	3-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	144-147
1-306	Et	1	H	3-CF ₃	Me	CH	CH	赤褐色油状	
1-307	Et	1	H	3-CF ₃	Et	CH	CH		
1-308	Et	1	H	3-CF ₃	Cl	CH	CH	薄黄色油状	
1-309	Et	1	H	3-CF ₃	Br	CH	CH		
1-310	Et	1	H	3-CF ₃	I	CH	CH	白色固体	122-125

【 0 0 7 4 】

10

20

30

【表 1 - 7】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-311	Et	1	3-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-312	Et	1	4-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-313	Et	1	5-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-314	Et	1	6-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-315	Et	1	3-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-316	Et	1	4-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-317	Et	1	5-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	140-145
1-318	Et	1	6-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-319	Et	1	H	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	149-152
1-320	Et	1	H	4-CF ₃	Me	CH	CH		
1-321	Et	1	H	4-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-322	Et	1	H	4-CF ₃	Br	CH	CH		
1-323	Et	1	H	4-CF ₃	I	CH	CH		
1-324	Et	1	3-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-325	Et	1	4-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-326	Et	1	5-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-327	Et	1	6-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-328	Et	1	3-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-329	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-330	Et	1	5-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-331	Et	1	6-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-332	Et	1	H	4-tert-Bu	H	CH	CH	白色固体	162-167
1-333	Et	1	H	4-Ph	H	CH	CH	黄色固体	157-160
1-334	Et	1	H	4-OPh	H	CH	CH	褐色油状	
1-335	Et	1	H	4-CN	H	CH	CH	白色固体	158-160
1-336	Et	1	H	2-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	103-105
1-337	Et	1	H	2-Cl-4-CF ₃	Me	CH	CH		
1-338	Et	1	H	2-Cl-4-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-339	Et	1	H	2-Cl-4-CF ₃	Br	CH	CH		
1-340	Et	1	H	2-Cl-4-CF ₃	I	CH	CH		
1-341	Et	1	H	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-342	Et	1	H	3-Me-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-343	Et	1	H	3-Me-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-344	Et	1	H	3-Me-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-345	Et	1	H	3-Me-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-346	Et	1	3-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-347	Et	1	4-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-348	Et	1	5-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-349	Et	1	6-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-350	Et	1	3-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-351	Et	1	4-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-352	Et	1	5-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-353	Et	1	6-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-354	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	169-171
1-355	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-356	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	c-Pr	CH	CH		
1-357	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH	CH		
1-358	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-359	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-360	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH	白色固体	148-152
1-361	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	NH ₂	CH	CH	白色固体	84-89
1-362	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	CO ₂ Et	CH	CH	薄黄色油状	
1-363	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	CN	CH	CH	白色固体	134-137
1-364	Et	1	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		79-82
1-365	Et	1	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		186-187

【 0 0 7 5 】

10

20

30

【表 1 - 8】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-366	Et	1	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	薄黄色固体	78-82
1-367	Et	1	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		64-68
1-368	Et	1	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-369	Et	1	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	136-137
1-370	Et	1	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	66-81
1-371	Et	1	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-372	Et	1	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-373	Et	1	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-374	Et	1	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-375	Et	1	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-376	Et	1	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-377	Et	1	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-378	Et	1	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-379	Et	1	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-380	Et	1	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-381	Et	1	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-382	Et	1	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-383	Et	1	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-384	Et	1	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-385	Et	1	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-386	Et	1	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-387	Et	1	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-388	Et	1	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-389	Et	1	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-390	Et	1	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-391	Et	1	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-392	Et	1	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-393	Et	1	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-394	Et	1	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-395	Et	1	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-396	Et	1	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-397	Et	1	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-398	Et	1	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-399	Et	1	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-400	Et	1	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-401	Et	1	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-402	Et	1	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-403	Et	1	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-404	Et	1	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-405	Et	1	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-406	Et	1	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-407	Et	1	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-408	Et	1	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-409	Et	1	3-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-410	Et	1	4-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-411	Et	1	5-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-412	Et	1	6-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-413	Et	1	3-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-414	Et	1	4-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-415	Et	1	5-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-416	Et	1	6-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-417	Et	1	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-418	Et	1	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-419	Et	1	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-420	Et	1	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		

10

20

30

【 0 0 7 6 】

【表 1 - 9】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-421	Et	1	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-422	Et	1	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-423	Et	1	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-424	Et	1	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-425	Et	1	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-426	Et	1	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-427	Et	1	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-428	Et	1	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-429	Et	1	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-430	Et	1	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-431	Et	1	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-432	Et	1	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-433	Et	1	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-434	Et	1	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-435	Et	1	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-436	Et	1	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-437	Et	1	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-438	Et	1	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-439	Et	1	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-440	Et	1	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-441	Et	1	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-442	Et	1	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-443	Et	1	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-444	Et	1	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-445	Et	1	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-446	Et	1	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-447	Et	1	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-448	Et	1	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-449	Et	1	H	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-450	Et	1	H	3-F-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-451	Et	1	H	3-F-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-452	Et	1	H	3-F-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-453	Et	1	H	3-F-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-454	Et	1	3-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-455	Et	1	4-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-456	Et	1	5-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-457	Et	1	6-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-458	Et	1	3-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-459	Et	1	4-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-460	Et	1	5-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-461	Et	1	6-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-462	Et	1	H	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-463	Et	1	H	3-Cl-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-464	Et	1	H	3-Cl-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-465	Et	1	H	3-Cl-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-466	Et	1	H	3-Cl-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-467	Et	1	3-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-468	Et	1	4-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-469	Et	1	5-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-470	Et	1	6-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-471	Et	1	3-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-472	Et	1	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-473	Et	1	5-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-474	Et	1	6-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-475	Et	1	H	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	172-173



10

20

30

【 0 0 7 7 】

【表 1 - 10】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-476	Et	1	H	3-Br-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-477	Et	1	H	3-Br-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-478	Et	1	H	3-Br-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-479	Et	1	H	3-Br-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-480	Et	1	3-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-481	Et	1	4-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-482	Et	1	5-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-483	Et	1	6-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-484	Et	1	3-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-485	Et	1	4-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-486	Et	1	5-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-487	Et	1	6-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-488	Et	1	H	3-CO ₂ Me-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	71-82
1-489	Et	1	H	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-490	Et	1	4-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-491	Et	1	5-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-492	Et	1	6-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-493	Et	1	3-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-494	Et	1	4-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-495	Et	1	5-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-496	Et	1	6-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-497	Et	1	H	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-498	Et	1	4-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-499	Et	1	5-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-500	Et	1	6-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-501	Et	1	3-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-502	Et	1	4-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-503	Et	1	5-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-504	Et	1	6-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-505	Et	1	H	3-CONHPh-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	227-230
1-506	Et	1	H	3-CONH(4-ClC ₆ H ₄)-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	206-211
1-507	Et	1	5-F	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	187-188
1-508	Et	1	5-Me	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	166-167
1-509	Et	1	5-OMe	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	65-70
1-510	Et	1	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	N	CH	白色固体	250≤
1-511	Et	1	H	4-CF(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	174-179
1-512	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	F	CH	CH	白色固体	120-122
1-513	Et	1	H	3-SF ₅	H	CH	CH	白色固体	153-154
1-514	Et	1	H	3-Ac-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	154-156
1-515	Et	1	H	3-CF ₃ -5-CF ₂ CONHMe	H	CH	CH	白色固体	79-83
1-516	Et	1	H	3,5-Cl ₂	H	CH	CH	白色固体	196-199
1-517	Et	1	H	3-CF ₂ CN-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	152-155
1-518	Et	1	H	3-COPh-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	112-122
1-519	Et	1	H	3-CF ₃ -5-CF ₂ CONHPh	H	CH	CH	白色固体	90-97
1-520	Et	1	H	3-CF ₂ Me-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	165-167
1-521	CHFCH ₃	1	H	3-CF ₂ Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-522	Et	1	H	3-Ph-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	158-159
1-523	Et	1	H	3-(c-Pr)-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	159-160
1-524	Et	1	4-Ph	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	178-179
1-525	Et	1	4-(4-ClC ₆ H ₄)	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	188-189
1-526	Et	1	4-OPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	142-144
1-527	Et	1	4-CN	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	203-206
1-528	Et	1	4-Br	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	187-189
1-529	Et	1	4- 	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	250≤
1-530	Et	1	4- 	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		

10

20

30

40

【 0 0 7 8 】

【表 1 - 11】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-531	Et	1		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	207-212
1-532	Et	1	4-(c-Pr)	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	180-181
1-533	Et	1	H	3-CH ₂ CN-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-534	Et	1	4-COOH	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-535	Et	1	4-CH ₂ OH	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-536	Et	1	H	3-(1-cyanocyclopropyl)-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	189-191
1-537	Et	1		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	176-178
1-538	Et	1	4-NHPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	163-164
1-539	Et	1	4-SPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-540	Et	1	4-SOPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-541	Et	1	4-SO ₂ Ph	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-542	Et	1	4-COOEt	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	166-169
1-543	Et	1	4-CONHMe	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	225-226
1-544	Et	1	4-CH ₂ CN	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-545	Et	1		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	201-204
1-546	Et	1	6-COOEt	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-547	Et	1	6-CONHMe	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	101-112
1-548	Et	1	4-Cl-6-SEt	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-549	Et	1	4-Cl-6-SO ₂ Et	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-550	Et	1	4-Ac	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	163-165
1-551	Et	1	4-COPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	201-203
1-552	Et	1	H	2-F-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	145-146
1-553	Et	1		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-554	Et	1	4-I	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	173-176
1-555	Et	1	4-OCF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	131-132
1-556	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃	H	N	CH	白色固体	196-198
1-557	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	COOH	CH	CH		
1-558	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONH ₂	CH	CH		
1-559	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONHPh	CH	CH	白色固体	184-186
1-560	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONH(4-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	102-106
1-561	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONHMe	CH	CH	白色固体	209-211
1-562	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONMe ₂	CH	CH	白色固体	140-142
1-563	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCOCF ₃	CH	CH	薄黄色固体	97-99
1-564	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCOPh	CH	CH	白色固体	103-108
1-565	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCO(3-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	96-103
1-566	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCO(4-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	104-112
1-567	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	NAC ₂	CH	CH	無色油状	
1-568	Et	1	H	3-COOH-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-569	Et	1	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCO(2-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	173-177
1-570	Et	1	4-CF(CF ₃) ₂	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-571	Et	1	4-SF ₅	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-572	Et	2	H	H	H	CH	CH	白色固体	156-158
1-573	Et	2	H	H	Me	CH	CH		
1-574	Et	2	H	H	Cl	CH	CH		
1-575	Et	2	H	H	Br	CH	CH		
1-576	Et	2	H	H	I	CH	CH		
1-577	Et	2	H	3-Cl	H	CH	CH	無色油状	
1-578	Et	2	H	4-Cl	H	CH	CH	白色固体	150-151
1-579	Et	2	H	3-Br	H	CH	CH	白色固体	155-160
1-580	Et	2	H	3-OCF ₃	H	CH	CH	無色油状	

10

20

30

40

【 0 0 7 9 】

【表 1 - 1 2】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-581	Et	2	H	2-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-582	Et	2	H	3-CF ₃	H	CH	CH	黄色固体	105-114
1-583	Et	2	H	3-CF ₃	Me	CH	CH	赤褐色油状	
1-584	Et	2	H	3-CF ₃	Et	CH	CH	薄黄色油状	
1-585	Et	2	H	3-CF ₃	Cl	CH	CH	薄黄色油状	
1-586	Et	2	H	3-CF ₃	Br	CH	CH		
1-587	Et	2	H	3-CF ₃	I	CH	CH	白色固体	163-165
1-588	Et	2	3-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-589	Et	2	4-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-590	Et	2	5-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-591	Et	2	6-Cl	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-592	Et	2	3-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-593	Et	2	4-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-594	Et	2	5-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-595	Et	2	6-CF ₃	3-CF ₃	H	CH	CH		
1-596	Et	2	H	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	168-171
1-597	Et	2	H	4-CF ₃	Me	CH	CH		
1-598	Et	2	H	4-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-599	Et	2	H	4-CF ₃	Br	CH	CH		
1-600	Et	2	H	4-CF ₃	I	CH	CH		
1-601	Et	2	3-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-602	Et	2	4-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-603	Et	2	5-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-604	Et	2	6-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-605	Et	2	3-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-606	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-607	Et	2	5-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-608	Et	2	6-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
1-609	Et	2	H	4-tert-Bu	H	CH	CH	白色固体	127-131
1-610	Et	2	H	4-Ph	H	CH	CH	黄色固体	178-181
1-611	Et	2	H	4-OPh	H	CH	CH	褐色固体	155-159
1-612	Et	2	H	4-CN	H	CH	CH	白色固体	165-167
1-613	Et	2	H	2-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	137-139
1-614	Et	2	H	2-Cl-4-CF ₃	Me	CH	CH		
1-615	Et	2	H	2-Cl-4-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-616	Et	2	H	2-Cl-4-CF ₃	Br	CH	CH		
1-617	Et	2	H	2-Cl-4-CF ₃	I	CH	CH		
1-618	Et	2	H	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-619	Et	2	H	3-Me-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-620	Et	2	H	3-Me-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-621	Et	2	H	3-Me-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-622	Et	2	H	3-Me-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-623	Et	2	3-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-624	Et	2	4-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-625	Et	2	5-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-626	Et	2	6-Cl	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-627	Et	2	3-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-628	Et	2	4-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-629	Et	2	5-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-630	Et	2	6-CF ₃	3-Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-631	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	135-139
1-632	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-633	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	c-Pr	CH	CH		
1-634	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH	CH		
1-635	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		

10

20

30

【 0 0 8 0 】

【表 1 - 13】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-636	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-637	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH	白色固体	182-185
1-638	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	NH ₂	CH	CH	白色固体	83-90
1-639	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	CO ₂ Et	CH	CH	薄黄色油状	
1-640	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	CN	CH	CH	白色固体	135-138
1-641	Et	2	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	170-172
1-642	Et	2	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	180-182
1-643	Et	2	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	72-75
1-644	Et	2	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	156-158
1-645	Et	2	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-646	Et	2	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	156-158
1-647	Et	2	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	171-173
1-648	Et	2	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-649	Et	2	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-650	Et	2	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-651	Et	2	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-652	Et	2	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-653	Et	2	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-654	Et	2	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-655	Et	2	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-656	Et	2	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-657	Et	2	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-658	Et	2	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-659	Et	2	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-660	Et	2	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-661	Et	2	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-662	Et	2	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-663	Et	2	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-664	Et	2	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-665	Et	2	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-666	Et	2	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-667	Et	2	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-668	Et	2	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-669	Et	2	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-670	Et	2	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-671	Et	2	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-672	Et	2	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-673	Et	2	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-674	Et	2	4-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-675	Et	2	5-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-676	Et	2	6-Cl	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-677	Et	2	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-678	Et	2	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-679	Et	2	5-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-680	Et	2	6-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-681	Et	2	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-682	Et	2	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-683	Et	2	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-684	Et	2	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-685	Et	2	H	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-686	Et	2	3-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-687	Et	2	4-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-688	Et	2	5-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-689	Et	2	6-Cl	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-690	Et	2	3-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		

10

20

30

【 0 0 8 1 】

【表 1 - 1 4】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-691	Et	2	4-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-692	Et	2	5-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-693	Et	2	6-CF ₃	4-Cl-3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-694	Et	2	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-695	Et	2	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-696	Et	2	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-697	Et	2	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-698	Et	2	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-699	Et	2	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-700	Et	2	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-701	Et	2	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-702	Et	2	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-703	Et	2	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-704	Et	2	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-705	Et	2	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-706	Et	2	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-707	Et	2	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-708	Et	2	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-709	Et	2	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-710	Et	2	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-711	Et	2	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-712	Et	2	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-713	Et	2	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-714	Et	2	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-715	Et	2	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-716	Et	2	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-717	Et	2	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-718	Et	2	3-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-719	Et	2	4-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-720	Et	2	5-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-721	Et	2	6-Cl	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-722	Et	2	3-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-723	Et	2	4-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-724	Et	2	5-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-725	Et	2	6-CF ₃	4-Me-3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-726	Et	2	H	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-727	Et	2	H	3-F-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-728	Et	2	H	3-F-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-729	Et	2	H	3-F-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-730	Et	2	H	3-F-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-731	Et	2	3-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-732	Et	2	4-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-733	Et	2	5-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-734	Et	2	6-Cl	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-735	Et	2	3-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-736	Et	2	4-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-737	Et	2	5-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-738	Et	2	6-CF ₃	3-F-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-739	Et	2	H	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-740	Et	2	H	3-Cl-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-741	Et	2	H	3-Cl-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-742	Et	2	H	3-Cl-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-743	Et	2	H	3-Cl-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-744	Et	2	3-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-745	Et	2	4-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		

10

20

30

【 0 0 8 2 】

【表 1 - 15】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-746	Et	2	5-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-747	Et	2	6-Cl	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-748	Et	2	3-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-749	Et	2	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-750	Et	2	5-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-751	Et	2	6-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-752	Et	2	H	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	161-164
1-753	Et	2	H	3-Br-5-CF ₃	Me	CH	CH		
1-754	Et	2	H	3-Br-5-CF ₃	Cl	CH	CH		
1-755	Et	2	H	3-Br-5-CF ₃	Br	CH	CH		
1-756	Et	2	H	3-Br-5-CF ₃	I	CH	CH		
1-757	Et	2	3-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-758	Et	2	4-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-759	Et	2	5-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-760	Et	2	6-Cl	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-761	Et	2	3-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-762	Et	2	4-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-763	Et	2	5-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-764	Et	2	6-CF ₃	3-Br-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-765	Et	2	H	3-CO ₂ Me-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	159-162
1-766	Et	2	H	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-767	Et	2	4-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-768	Et	2	5-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-769	Et	2	6-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-770	Et	2	3-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-771	Et	2	4-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-772	Et	2	5-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-773	Et	2	6-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-774	Et	2	H	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-775	Et	2	4-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-776	Et	2	5-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-777	Et	2	6-Cl	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-778	Et	2	3-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-779	Et	2	4-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-780	Et	2	5-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-781	Et	2	6-CF ₃	3,4-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-782	Et	2	H	3-CONHPh-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	232-233
1-783	Et	2	H	3-CONH(4-ClC ₆ H ₄)-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	200-201
1-784	Et	2	5-F	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	132-133
1-785	Et	2	5-Me	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	137-140
1-786	Et	2	5-OMe	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	146-147
1-787	Et	2	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	N	CH	白色固体	230-233
1-788	Et	2	H	4-CF(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	180-182
1-789	Et	2	H	3-CF ₂ CONH ₂ -5-CF ₃	H	CH	CH		
1-790	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	F	CH	CH	白色固体	149-150
1-791	Et	2	H	3-SF ₅	H	CH	CH	白色固体	139-142
1-792	Et	2	H	3-Ac-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	181-183
1-793	Et	2	H	3-CF ₃ -5-CF ₂ CONHMe	H	CH	CH	白色固体	<60
1-794	Et	2	H	3,5-Cl ₂	H	CH	CH	白色固体	179-181
1-795	Et	2	H	3-CF ₂ CN-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	104-108
1-796	Et	2	H	3-COPh-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	201-202
1-797	Et	2	H	3-CF ₂ CONH ₂ -5-CF ₃	H	CH	CH	薄赤色固体	174-177
1-798	Et	2	H	3-CF ₂ Me-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	126-128
1-799	CHFCH ₃	2	H	3-CF ₂ Me-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-800	Et	2	H	3-Ph-5-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	

10

20

30

【 0 0 8 3 】

【表 1 - 16】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-801	Et	2	H	3-(<i>c</i> -Pr)-5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	63-68
1-802	Et	2	4-Ph	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	225-226
1-803	Et	2	4-(4-ClC ₆ H ₄)	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	221-222
1-804	Et	2	4-OPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	183-184
1-805	Et	2	4-CN	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	210-211
1-806	Et	2	4-Br	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	181-182
1-807	Et	2		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-808	Et	2		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	211-213
1-809	Et	2		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	195-197
1-810	Et	2	4-(<i>c</i> -Pr)	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	118-120
1-811	Et	2	H	3-CH ₂ CN-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-812	Et	2	4-COOH	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-813	Et	2	4-CH ₂ OH	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-814	Et	2	H	3-(1-cyanocyclopropyl)-5-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-815	Et	2		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	80-82
1-816	Et	2	4-NHPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	無色油状	
1-817	Et	2	4-SPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	179-184
1-818	Et	2	4-SOPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	94-98
1-819	Et	2	4-SO ₂ Ph	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	薄黄色固体	207-209
1-820	Et	2	4-COOEt	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	162-164
1-821	Et	2	4-CONHMe	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	≥250
1-822	Et	2	4-CH ₂ CN	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-823	Et	2		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	171-173
1-824	Et	2	6-COOEt	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-825	Et	2	6-CONHMe	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	211-214
1-826	Et	2	4-Cl-6-SEt	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-827	Et	2	4-Cl-6-SO ₂ Et	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	209-212
1-828	Et	2	4-Ac	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	211-212
1-829	Et	2	4-COPh	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	227-230
1-830	Et	2	H	2-F-5-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
1-831	Et	2		3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	80-83
1-832	Et	2	4-I	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	203-204
1-833	Et	2	4-OCF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	143-144
1-834	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃	H	N	CH	白色固体	213-215
1-835	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	COOH	CH	CH		
1-836	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONH ₂	CH	CH		
1-837	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONHPh	CH	CH	白色固体	74-85
1-838	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONH(4-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	78-83
1-839	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONHMe	CH	CH	白色固体	161-165
1-840	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	CONMe ₂	CH	CH	無色油状	
1-841	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCOCF ₃	CH	CH	白色固体	198-200
1-842	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCOPh	CH	CH	白色固体	91-97
1-843	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCO(3-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	91-97
1-844	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCO(4-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	96-102
1-845	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	NAc ₂	CH	CH	白色固体	159-162

【 0 0 8 4 】

10

20

30

【表 1 - 17】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-846	Et	2	H	3-COOH-5-CF ₃	H	CH	CH		
1-847	Et	2	H	3,5-(CF ₃) ₂	NHCO(2-ClC ₆ H ₄)	CH	CH	白色固体	88-95
1-848	Et	2	4-CF(CF ₃) ₂	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-849	Et	2	4-SF ₅	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-850	Et	0	H	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-851	Et	0	4-Cl	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-852	Et	0	4-Br	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-853	Et	0	4-I	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH	黄色油状物	
1-854	Et	0	4-CF ₃	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-855	Et	0	4-OCF ₃	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH	黄色油状物	
1-856	Et	0	4-SF ₅	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-857	Et	1	H	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-858	Et	1	4-Cl	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-859	Et	1	4-Br	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-860	Et	1	4-I	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH	白色固体	135-140
1-861	Et	1	4-CF ₃	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-862	Et	1	4-OCF ₃	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH	白色固体	135-140
1-863	Et	1	4-SF ₅	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-864	Et	2	H	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-865	Et	2	4-Cl	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-866	Et	2	4-Br	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-867	Et	2	4-I	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH	白色固体	183-187
1-868	Et	2	4-CF ₃	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-869	Et	2	4-OCF ₃	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH	白色固体	114-117
1-870	Et	2	4-SF ₅	3-CF ₃ -4-Cl	H	CH	CH		
1-871	n-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-872	n-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-873	n-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-874	n-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-875	n-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-876	n-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-877	n-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-878	n-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-879	n-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-880	n-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-881	i-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-882	i-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-883	i-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-884	i-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-885	i-Pr	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-886	i-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-887	i-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-888	i-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-889	i-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-890	i-Pr	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-891	n-Bu	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-892	n-Bu	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-893	n-Bu	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-894	n-Bu	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-895	n-Bu	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-896	n-Bu	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-897	n-Bu	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-898	n-Bu	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-899	n-Bu	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-900	n-Bu	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		

10

20

30

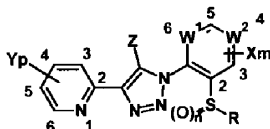
【 0 0 8 5 】

【表 1 - 18】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
1-901	n-Pen	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-902	n-Pen	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-903	n-Pen	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-904	n-Pen	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-905	n-Pen	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-906	n-Pen	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-907	n-Pen	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-908	n-Pen	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-909	n-Pen	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-910	n-Pen	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-911	n-Hex	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-912	n-Hex	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-913	n-Hex	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-914	n-Hex	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-915	n-Hex	0	H	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
1-916	n-Hex	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
1-917	n-Hex	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
1-918	n-Hex	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
1-919	n-Hex	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
1-920	n-Hex	0	4-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		

【 0 0 8 6 】

【表 2 - 1】



化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-1	Me	0	H	H	H	CH	CH		
2-2	Me	0	H	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-3	Me	0	H	5-CF ₃	H	CH	CH		
2-4	Me	0	H	6-CF ₃	H	CH	CH		
2-5	Me	0	H	4-CF ₃	Br	CH	CH		
2-6	Me	0	H	5-CF ₃	Br	CH	CH		
2-7	Me	0	H	6-CF ₃	Br	CH	CH		
2-8	Me	0	4-CF ₃	4-CF ₃	Br	CH	CH		
2-9	Me	0	4-CF ₃	5-CF ₃	Br	CH	CH		
2-10	Me	0	4-CF ₃	6-CF ₃	Br	CH	CH		
2-11	Me	0	H	4-CF ₃	I	CH	CH		
2-12	Me	0	H	5-CF ₃	I	CH	CH		
2-13	Me	0	H	6-CF ₃	I	CH	CH		
2-14	Et	0	H	H	H	CH	CH	黄色油状	
2-15	Et	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	赤褐色油状	
2-16	Et	0	4-Cl	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-17	Et	0	4-Br	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-18	Et	0	4-I	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-19	Et	0	4-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-20	Et	0	4-OCF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	82-84
2-21	Et	0	4-SF ₅	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-22	Et	0	5-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-23	Et	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
2-24	Et	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
2-25	Et	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
2-26	Et	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
2-27	Et	0	H	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-28	Et	0	4-Cl	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-29	Et	0	4-Br	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-30	Et	0	4-I	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	103-105
2-31	Et	0	4-CF ₃	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-32	Et	0	4-OCF ₃	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	86-87
2-33	Et	0	4-SF ₅	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	黄色固体	84-87
2-34	Et	0	H	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-35	Et	0	4-Cl	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-36	Et	0	4-Br	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-37	Et	0	4-I	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-38	Et	0	4-CF ₃	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-39	Et	0	4-OCF ₃	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-40	Et	0	4-SF ₅	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-41	Et	0	H	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-42	Et	0	4-Cl	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-43	Et	0	4-Br	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-44	Et	0	4-I	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-45	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		

【 0 0 8 7 】

10

20

30

【表 2 - 2】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-46	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-47	Et	0	4-SF ₅	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-48	Et	0	H	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-49	Et	0	4-Cl	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-50	Et	0	4-Br	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-51	Et	0	4-I	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-52	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-53	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-54	Et	0	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-55	Et	0	H	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-56	Et	0	4-Cl	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-57	Et	0	4-Br	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-58	Et	0	4-I	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-59	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-60	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-61	Et	0	4-SF ₅	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-62	Et	0	H	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-63	Et	0	4-Cl	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-64	Et	0	4-Br	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-65	Et	0	4-I	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH	白色個体	188-197
2-66	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-67	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-68	Et	0	4-SF ₅	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-69	Et	0	H	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-70	Et	0	4-Cl	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-71	Et	0	4-Br	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-72	Et	0	4-I	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-73	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-74	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-75	Et	0	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-76	Et	0	H	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-77	Et	0	4-Cl	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-78	Et	0	4-Br	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-79	Et	0	4-I	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-80	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-81	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-82	Et	0	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-83	Et	0	H	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-84	Et	0	4-Cl	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-85	Et	0	4-Br	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-86	Et	0	4-I	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-87	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-88	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH	白色個体	163
2-89	Et	0	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-90	Et	0	H	3-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-91	Et	0	H	4-CF ₃	H	CH	CH	褐色油状	
2-92	Et	0	H	4-CF ₃	H	N	CH		
2-93	Et	0	H	4-CF ₃	H	CH	N		
2-94	Et	0	H	4-CF ₃	H	N	N		
2-95	Et	0	3-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	褐色油状	
2-96	Et	0	4-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	114-116
2-97	Et	0	5-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	褐色固体	122-123
2-98	Et	0	6-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-99	Et	0	4-F	4-CF ₃	H	CH	CH	茶色固体	102
2-100	Et	0	4-Br	4-CF ₃	H	CH	CH	褐色固体	97-98

10

20

30

40

【 0 0 8 8 】

【表 2 - 3】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-101	Et	0	4-Br	4-CF ₃	H	N	CH		
2-102	Et	0	4-I	4-CF ₃	H	CH	CH	赤色固体	99-101
2-103	Et	0	4-Me	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	78-80
2-104	Et	0	4-CN	4-CF ₃	H	CH	CH	赤色固体	145-147
2-105	Et	0	4-OH	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-106	Et	0	4-COOEt	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-107	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	143-145
2-108	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃	H	N	CH		
2-109	Et	0	4-CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	CH	CH	黄色固体	90-92
2-110	Et	0	4-CH(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	CH	CH	橙色油状	
2-111	Et	0	4-C(CF ₃) ₂ OMe	4-CF ₃	H	CH	CH	橙色固体	88-93
2-112	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	100-102
2-113	Et	0	4-SCF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	黄色固体	73-75
2-114	Et	0	4-SMe	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-115	Et	0	4-SOMe	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-116	Et	0	4-SO ₂ Me	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-117	Et	0	4-OSO ₂ CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-118	Et	0	4-SF ₅	4-CF ₃	H	CH	CH	赤色固体	116-120
2-119	Et	0	4-OCH ₂ OCH ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-120	Et	0	4-I-5-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	薄黄色固体	112-114
2-121	Et	0	3,4-Cl ₂	4-CF ₃	H	CH	CH	褐色固体	82-84
2-122	Et	0	3-Cl-4-Br	4-CF ₃	H	CH	CH	黄色油状	
2-123	Et	0	4-CH ₂ CN	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	169
2-124	Et	0	4-CF ₂ CN	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-125	Et	0	4-CH ₂ Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	薄黄色固体	122-124
2-126	Et	0	4-CH ₂ OH	4-CF ₃	H	CH	CH	赤褐色油状	
2-127	Et	0	4-(<i>c</i> -Pr)	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	84-87
2-128	Et	0	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	128-130
2-129	Et	0	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-130	Et	0	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-131	Et	0	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	126-127
2-132	Et	0	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	110-111
2-133	Et	0	H	4-CF ₃	Me	CH	CH		
2-134	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₃	Me	CH	CH	褐色固体	89-98
2-135	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃	Me	CH	CH	褐色油状	
2-136	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₃	CH ₂ OMe	CH	CH		
2-137	Et	0	H	4-CF ₃	Cl	CH	CH		
2-138	Et	0	H	4-CF ₃	Br	CH	CH		
2-139	Et	0	H	4-CF ₃	I	CH	CH		
2-140	Et	0	H	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH	黄色油状	
2-141	Et	0	4-Cl	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-142	Et	0	4-Br	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-143	Et	0	4-I	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH	赤色油状	
2-144	Et	0	4-CF ₃	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-145	Et	0	4-OCF ₃	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH	橙色固体	113-115

10

20

30

40

【 0 0 8 9 】

【表 2 - 4】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-146	Et	0	4-SF ₅	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-147	Et	0	H	5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	103-104
2-148	Et	0	H	6-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-149	Et	0	H	6-CF ₃	Me	CH	CH		
2-150	Et	0	H	6-CF ₃	Cl	CH	CH		
2-151	Et	0	H	6-CF ₃	Br	CH	CH		
2-152	Et	0	H	6-CF ₃	I	CH	CH		
2-153	Et	1	H	H	H	CH	CH	白色固体	170-172
2-154	Et	1	H	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-155	Et	1	4-Cl	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-156	Et	1	4-Br	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-157	Et	1	4-I	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-158	Et	1	4-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-159	Et	1	4-OCF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-160	Et	1	4-SF ₅	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-161	Et	1	5-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-162	Et	1	H	4,6-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
2-163	Et	1	H	4,6-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
2-164	Et	1	H	4,6-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
2-165	Et	1	H	4,6-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
2-166	Et	1	H	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-167	Et	1	4-Cl	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-168	Et	1	4-Br	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-169	Et	1	4-I	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	167-170
2-170	Et	1	4-CF ₃	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-171	Et	1	4-OCF ₃	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	150-152
2-172	Et	1	4-SF ₅	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	79-84
2-173	Et	1	H	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-174	Et	1	4-Cl	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-175	Et	1	4-Br	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-176	Et	1	4-I	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-177	Et	1	4-CF ₃	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-178	Et	1	4-OCF ₃	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-179	Et	1	4-SF ₅	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-180	Et	1	H	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-181	Et	1	4-Cl	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-182	Et	1	4-Br	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-183	Et	1	4-I	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-184	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-185	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-186	Et	1	4-SF ₅	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-187	Et	1	H	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-188	Et	1	4-Cl	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-189	Et	1	4-Br	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-190	Et	1	4-I	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-191	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-192	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-193	Et	1	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-194	Et	1	H	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-195	Et	1	4-Cl	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-196	Et	1	4-Br	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-197	Et	1	4-I	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-198	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-199	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-200	Et	1	4-SF ₅	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		

10

20

30

40




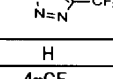
【 0 0 9 0 】

【表 2 - 5】

化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-201	Et	1	H	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-202	Et	1	4-Cl	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-203	Et	1	4-Br	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-204	Et	1	4-I	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH	白色個体	188-197
2-205	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-206	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-207	Et	1	4-SF ₅	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-208	Et	1	H	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-209	Et	1	4-Cl	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-210	Et	1	4-Br	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-211	Et	1	4-I	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-212	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-213	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-214	Et	1	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-215	Et	1	H	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-216	Et	1	4-Cl	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-217	Et	1	4-Br	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-218	Et	1	4-I	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-219	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-220	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-221	Et	1	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-222	Et	1	H	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-223	Et	1	4-Cl	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-224	Et	1	4-Br	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-225	Et	1	4-I	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-226	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-227	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH	白色個体	163
2-228	Et	1	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-229	Et	1	H	3-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	175-177
2-230	Et	1	H	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	165-166
2-231	Et	1	H	4-CF ₃	H	N	CH		
2-232	Et	1	H	4-CF ₃	H	CH	N		
2-233	Et	1	H	4-CF ₃	H	N	N		
2-234	Et	1	3-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-235	Et	1	4-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	175-177
2-236	Et	1	5-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	158-162
2-237	Et	1	6-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-238	Et	1	4-F	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	183-185
2-239	Et	1	4-Br	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	186-193
2-240	Et	1	4-Br	4-CF ₃	H	N	CH		
2-241	Et	1	4-I	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	182-186
2-242	Et	1	4-Me	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	153-156
2-243	Et	1	4-CN	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	213-215
2-244	Et	1	4-OH	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-245	Et	1	4-COOEt	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	162-165
2-246	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	186-187
2-247	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃	H	N	CH		
2-248	Et	1	4-CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	190-192
2-249	Et	1	4-CH(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	154-156
2-250	Et	1	4-C(CF ₃) ₂ OMe	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	167-169
2-251	Et	1	4-OMe	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	134-144
2-252	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	161-165
2-253	Et	1	4-SCF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	166-168
2-254	Et	1	4-SMe	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-255	Et	1	4-SOMe	4-CF ₃	H	CH	CH		

【 0 0 9 1 】

【表 2 - 6】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-256	Et	1	4-SO ₂ Me	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-257	Et	1	4-OSO ₂ CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-258	Et	1	4-SF ₅	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	199-201
2-259	Et	1	4-OCH ₂ OCH ₃	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-260	Et	1	4-I-5-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	208-214
2-261	Et	1	3,4-Cl ₂	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	144-146
2-262	Et	1	3-Cl-4-Br	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	161-165
2-263	Et	1	4-CH ₂ CN	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	200-204
2-264	Et	1	4-CF ₂ CN	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-265	Et	1	4-CH ₂ Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-266	Et	1	4-CH ₂ OH	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-267	Et	1	4-(c-Pr)	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	117-121
2-268	Et	1	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	157-159
2-269	Et	1	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-270	Et	1	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-271	Et	1	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	186-187
2-272	Et	1	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	123-126
2-273	Et	1	H	4-CF ₃	Me	CH	CH		
2-274	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₃	Me	CH	CH	褐色油状	
2-275	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃	Me	CH	CH	薄黄色固体	96-97
2-276	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₃	CH ₂ OMe	CH	CH		
2-277	Et	1	H	4-CF ₃	Cl	CH	CH		
2-278	Et	1	H	4-CF ₃	Br	CH	CH		
2-279	Et	1	H	4-CF ₃	I	CH	CH		
2-280	Et	1	H	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-281	Et	1	4-Cl	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-282	Et	1	4-Br	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-283	Et	1	4-I	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH	白色固体	157-162
2-284	Et	1	4-CF ₃	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-285	Et	1	4-OCF ₃	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH	白色固体	165-167
2-286	Et	1	4-SF ₅	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-287	Et	1	H	5-CF ₃	H	CH	CH		
2-288	Et	1	H	6-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	172-175
2-289	Et	1	H	6-CF ₃	Me	CH	CH		
2-290	Et	1	H	6-CF ₃	Cl	CH	CH		
2-291	Et	1	H	6-CF ₃	Br	CH	CH		
2-292	Et	1	H	6-CF ₃	I	CH	CH		
2-293	Et	2	H	H	H	CH	CH		
2-294	Et	2	H	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	
2-295	Et	2	4-Cl	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		

10

20

30

【 0 0 9 2 】

【表 2 - 7】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-296	Et	2	4-Br	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-297	Et	2	4-I	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	154-155
2-298	Et	2	4-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-299	Et	2	4-OCF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	179-180
2-300	Et	2	4-SF ₅	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-301	Et	2	5-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-302	Et	2	H	4,6-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
2-303	Et	2	H	4,6-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
2-304	Et	2	H	4,6-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
2-305	Et	2	H	4,6-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
2-306	Et	2	H	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-307	Et	2	4-Cl	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-308	Et	2	4-Br	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-309	Et	2	4-I	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	186-188
2-310	Et	2	4-CF ₃	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-311	Et	2	4-OCF ₃	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	163-164
2-312	Et	2	4-SF ₅	3-CN-4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH	白色固体	208-209
2-313	Et	2	H	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-314	Et	2	4-Cl	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-315	Et	2	4-Br	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-316	Et	2	4-I	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-317	Et	2	4-CF ₃	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-318	Et	2	4-OCF ₃	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-319	Et	2	4-SF ₅	3-Cl-4-CF ₃	H	CH	CH		
2-320	Et	2	H	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-321	Et	2	4-Cl	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-322	Et	2	4-Br	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH	白色固体	195-198
2-323	Et	2	4-I	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH	白色固体	190-194
2-324	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-325	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH	白色固体	149-151
2-326	Et	2	4-SF ₅	4-CF ₃ -5-Cl	H	CH	CH		
2-327	Et	2	H	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-328	Et	2	4-Cl	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-329	Et	2	4-Br	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH	白色固体	179-180
2-330	Et	2	4-I	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH	白色固体	187-188
2-331	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-332	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH	白色固体	179-180
2-333	Et	2	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-Cl	H	CH	CH		
2-334	Et	2	H	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-335	Et	2	4-Cl	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-336	Et	2	4-Br	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-337	Et	2	4-I	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-338	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-339	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-340	Et	2	4-SF ₅	4-CF ₃ -3-Br	H	CH	CH		
2-341	Et	2	H	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-342	Et	2	4-Cl	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-343	Et	2	4-Br	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-344	Et	2	4-I	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH	白色固体	188-197
2-345	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-346	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-347	Et	2	4-SF ₅	4-CF ₃ -5-Br	H	CH	CH		
2-348	Et	2	H	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-349	Et	2	4-Cl	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-350	Et	2	4-Br	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		

10

20

30

40

【 0 0 9 3 】

【表 2 - 8】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-351	Et	2	4-I	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH	白色個体	180-181
2-352	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-353	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH	白色個体	182-183
2-354	Et	2	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-Br	H	CH	CH		
2-355	Et	2	H	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-356	Et	2	4-Cl	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-357	Et	2	4-Br	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH	白色固体	112-115
2-358	Et	2	4-I	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-359	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-360	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-361	Et	2	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-OMe	H	CH	CH		
2-362	Et	2	H	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-363	Et	2	4-Cl	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-364	Et	2	4-Br	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-365	Et	2	4-I	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-366	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-367	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH	白色個体	163
2-368	Et	2	4-SF ₅	4-CF ₃ -6-CN	H	CH	CH		
2-369	Et	2	H	3-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-370	Et	2	H	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	162-165
2-371	Et	2	H	4-CF ₃	H	N	CH		
2-372	Et	2	H	4-CF ₃	H	CH	N		
2-373	Et	2	H	4-CF ₃	H	N	N		
2-374	Et	2	3-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	175-179
2-375	Et	2	4-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	166-168
2-376	Et	2	5-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	115-118
2-377	Et	2	6-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-378	Et	2	4-F	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	160-162
2-379	Et	2	4-Br	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	157-158
2-380	Et	2	4-Br	4-CF ₃	H	N	CH		
2-381	Et	2	4-I	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	144-147
2-382	Et	2	4-Me	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	147-148
2-383	Et	2	4-CN	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	193-196
2-384	Et	2	4-OH	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	128-133
2-385	Et	2	4-COOEt	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	153-156
2-386	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	168-170
2-387	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃	H	N	CH	白色固体	145-149
2-388	Et	2	4-CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-389	Et	2	4-CH(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	145-147
2-390	Et	2	4-C(CF ₃) ₂ OMe	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	169-171
2-391	Et	2	4-OMe	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	108-115
2-392	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	126-129
2-393	Et	2	4-SCF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	124-126
2-394	Et	2	4-SMe	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	125-126
2-395	Et	2	4-SOMe	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	178-180
2-396	Et	2	4-SO ₂ Me	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	147-151
2-397	Et	2	4-OSO ₂ CF ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	120-124
2-398	Et	2	4-SF ₅	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	173-175
2-399	Et	2	4-OCH ₂ OCH ₃	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	99-101
2-400	Et	2	4-I-5-Cl	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	200-202
2-401	Et	2	3,4-Cl ₂	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	212-214
2-402	Et	2	3-Cl-4-Br	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	203-207
2-403	Et	2	4-CH ₂ CN	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	103-106
2-404	Et	2	4-CF ₂ CN	4-CF ₃	H	CH	CH	褐色油状	
2-405	Et	2	4-CH ₂ Cl	4-CF ₃	H	CH	CH		

10






20

30

40

【 0 0 9 4 】

【表 2 - 9】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-406	Et	2	4-CH ₂ OH	4-CF ₃	H	CH	CH		
2-407	Et	2	4-(c-Pr)	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	61-64
2-408	Et	2	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	118-121
2-409	Et	2	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	176-177
2-410	Et	2	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	薄黄色固体	190-191
2-411	Et	2	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	171-174
2-412	Et	2	4- 	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	128-130
2-413	Et	2	H	4-CF ₃	Me	CH	CH		
2-414	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₃	Me	CH	CH	黄色固体	118-123
2-415	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃	Me	CH	CH	白色固体	127-130
2-416	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₃	CH ₂ OMe	CH	CH	薄黄色油状	
2-417	Et	2	H	4-CF ₃	Cl	CH	CH		
2-418	Et	2	H	4-CF ₃	Br	CH	CH		
2-419	Et	2	H	4-CF ₃	I	CH	CH		
2-420	Et	2	H	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH	白色固体	111-115
2-421	Et	2	4-Cl	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-422	Et	2	4-Br	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-423	Et	2	4-I	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH	白色固体	71-76
2-424	Et	2	4-CF ₃	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-425	Et	2	4-OCF ₃	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH	白色固体	144-146
2-426	Et	2	4-SF ₅	4-CF ₂ CF ₃	H	CH	CH		
2-427	Et	2	H	5-CF ₃	H	CH	CH	無色油状	
2-428	Et	2	H	6-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	141-143
2-429	Et	2	H	6-CF ₃	Me	CH	CH		
2-430	Et	2	H	6-CF ₃	Cl	CH	CH		
2-431	Et	2	H	6-CF ₃	Br	CH	CH		
2-432	Et	2	H	6-CF ₃	I	CH	CH		
2-433	n-Pr	0	H	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	66-67
2-434	n-Pr	0	H	5-CF ₃	H	CH	CH	薄黄色固体	93-95
2-435	n-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-436	n-Pr	0	4-Cl	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-437	n-Pr	0	4-Br	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-438	n-Pr	0	4-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-439	n-Pr	0	5-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-440	n-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
2-441	n-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
2-442	n-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
2-443	n-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
2-444	n-Pr	1	H	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	193-194
2-445	n-Pr	1	H	5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	179-180

【 0 0 9 5 】

10

20

30

【表 2 - 10】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
2-446	n-Pr	2	H	4-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	120-123
2-447	n-Pr	2	H	5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	109-111
2-448	i-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-449	i-Pr	0	4-Cl	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-450	i-Pr	0	4-Br	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-451	i-Pr	0	4-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-452	i-Pr	0	5-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-453	i-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
2-454	i-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
2-455	i-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
2-456	i-Pr	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
2-457	n-Bu	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-458	n-Bu	0	4-Cl	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-459	n-Bu	0	4-Br	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-460	n-Bu	0	4-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-461	n-Bu	0	5-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-462	n-Bu	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
2-463	n-Bu	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
2-464	n-Bu	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
2-465	n-Bu	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
2-466	n-Pen	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-467	n-Pen	0	4-Cl	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-468	n-Pen	0	4-Br	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-469	n-Pen	0	4-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-470	n-Pen	0	5-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-471	n-Pen	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
2-472	n-Pen	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
2-473	n-Pen	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
2-474	n-Pen	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
2-475	n-Hex	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-476	n-Hex	0	4-Cl	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-477	n-Hex	0	4-Br	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-478	n-Hex	0	4-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-479	n-Hex	0	5-CF ₃	4,6-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
2-480	n-Hex	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
2-481	n-Hex	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
2-482	n-Hex	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
2-483	n-Hex	0	H	4,6-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
2-484	CF ₃ CH ₂	0	H	5-CF ₃	H	CH	CH	黄色油状	
2-485	CF ₃ CH ₂	1	H	5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	198-199
2-486	CF ₃ CH ₂	2	H	5-CF ₃	H	CH	CH		

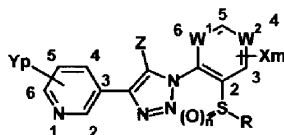
10

20

30

【 0 0 9 6 】

【表 3 - 1】



化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
3-1	Me	0	H	H	H	CH	CH		
3-2	Me	0	H	4-CF ₃	H	CH	CH		
3-3	Me	0	H	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-4	Me	0	H	6-CF ₃	H	CH	CH		
3-5	Me	0	H	4-CF ₃	Br	CH	CH		
3-6	Me	0	H	5-CF ₃	Br	CH	CH		
3-7	Me	0	H	6-CF ₃	Br	CH	CH		
3-8	Me	0	4-CF ₃	4-CF ₃	Br	CH	CH		
3-9	Me	0	4-CF ₃	5-CF ₃	Br	CH	CH		
3-10	Me	0	4-CF ₃	6-CF ₃	Br	CH	CH		
3-11	Me	0	H	4-CF ₃	I	CH	CH		
3-12	Me	0	H	5-CF ₃	I	CH	CH		
3-13	Me	0	H	6-CF ₃	I	CH	CH		
3-14	Et	0	H	H	H	CH	CH	白色固体	83-84
3-15	Et	0	H	5-CF ₃	H	CH	CH	薄黄色固体	79-81
3-16	Et	0	4-Cl	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-17	Et	0	4-Br	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-18	Et	0	4-CF ₃	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-19	Et	0	5-CF ₃	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-20	Et	0	H	5-CF ₃	Me	CH	CH		
3-21	Et	0	H	5-CF ₃	Cl	CH	CH		
3-22	Et	0	H	5-CF ₃	Br	CH	CH		
3-23	Et	0	H	5-CF ₃	I	CH	CH		
3-24	Et	0	H	6-CF ₃	H	CH	CH		
3-25	Et	0	H	6-CF ₃	Me	CH	CH		
3-26	Et	0	H	6-CF ₃	Cl	CH	CH		
3-27	Et	0	H	6-CF ₃	Br	CH	CH		
3-28	Et	0	H	6-CF ₃	I	CH	CH		
3-29	Et	1	H	H	H	CH	CH	白色固体	132-133
3-30	Et	1	H	5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	186-187
3-31	Et	1	4-Cl	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-32	Et	1	4-Br	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-33	Et	1	4-CF ₃	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-34	Et	1	5-CF ₃	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-35	Et	1	H	5-CF ₃	Me	CH	CH		
3-36	Et	1	H	5-CF ₃	Cl	CH	CH		
3-37	Et	1	H	5-CF ₃	Br	CH	CH		
3-38	Et	1	H	5-CF ₃	I	CH	CH		
3-39	Et	1	H	6-CF ₃	H	CH	CH		
3-40	Et	1	H	6-CF ₃	Me	CH	CH		
3-41	Et	1	H	6-CF ₃	Cl	CH	CH		
3-42	Et	1	H	6-CF ₃	Br	CH	CH		
3-43	Et	1	H	6-CF ₃	I	CH	CH		
3-44	Et	2	H	H	H	CH	CH		
3-45	Et	2	H	5-CF ₃	H	CH	CH	白色固体	124-126

【 0 0 9 7 】

10

20

30

40

【表 3 - 2】

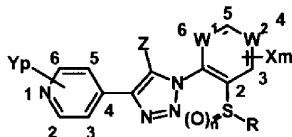
化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
3-46	Et	2	4-Cl	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-47	Et	2	4-Br	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-48	Et	2	4-CF ₃	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-49	Et	2	5-CF ₃	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-50	Et	2	H	5-CF ₃	Me	CH	CH		
3-51	Et	2	H	5-CF ₃	Cl	CH	CH		
3-52	Et	2	H	5-CF ₃	Br	CH	CH		
3-53	Et	2	H	5-CF ₃	I	CH	CH		
3-54	Et	2	H	6-CF ₃	H	CH	CH		
3-55	Et	2	H	6-CF ₃	Me	CH	CH		
3-56	Et	2	H	6-CF ₃	Cl	CH	CH		
3-57	Et	2	H	6-CF ₃	Br	CH	CH		
3-58	Et	2	H	6-CF ₃	I	CH	CH		
3-59	n-Hex	0	H	H	H	CH	CH		
3-60	n-Hex	0	H	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-61	n-Hex	0	4-Cl	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-62	n-Hex	0	4-Br	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-63	n-Hex	0	4-CF ₃	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-64	n-Hex	0	5-CF ₃	5-CF ₃	H	CH	CH		
3-65	n-Hex	0	H	5-CF ₃	Me	CH	CH		
3-66	n-Hex	0	H	5-CF ₃	Cl	CH	CH		
3-67	n-Hex	0	H	5-CF ₃	Br	CH	CH		
3-68	n-Hex	0	H	5-CF ₃	I	CH	CH		
3-69	n-Hex	0	H	6-CF ₃	H	CH	CH		
3-70	n-Hex	0	H	6-CF ₃	Me	CH	CH		
3-71	n-Hex	0	H	6-CF ₃	Cl	CH	CH		
3-72	n-Hex	0	H	6-CF ₃	Br	CH	CH		
3-73	n-Hex	0	H	6-CF ₃	I	CH	CH		

10

20

【 0 0 9 8 】

【表 4 - 1】



化合物番号	R	n	Xm	Yp	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
4-1	Me	0	H	H	H	CH	CH		
4-2	Me	0	H	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-3	Me	0	H	3-CF ₃	H	CH	CH		
4-4	Me	0	H	2-CF ₃	Br	CH	CH		
4-5	Me	0	H	3-CF ₃	Br	CH	CH		
4-6	Me	0	4-CF ₃	2-CF ₃	Br	CH	CH		
4-7	Me	0	4-CF ₃	3-CF ₃	Br	CH	CH		
4-8	Me	0	H	2-CF ₃	I	CH	CH		
4-9	Me	0	H	3-CF ₃	I	CH	CH		
4-10	Et	0	H	H	H	CH	CH	薄茶色固体	103-105
4-11	Et	0	H	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-12	Et	0	4-Cl	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-13	Et	0	4-Br	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-14	Et	0	4-CF ₃	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-15	Et	0	5-CF ₃	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-16	Et	0	H	2-CF ₃	Me	CH	CH		
4-17	Et	0	H	2-CF ₃	Cl	CH	CH		
4-18	Et	0	H	2-CF ₃	Br	CH	CH		
4-19	Et	0	H	2-CF ₃	I	CH	CH		
4-20	Et	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
4-21	Et	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
4-22	Et	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
4-23	Et	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
4-24	Et	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
4-25	Et	1	H	H	H	CH	CH	白色固体	160-164
4-26	Et	1	H	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-27	Et	1	4-Cl	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-28	Et	1	4-Br	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-29	Et	1	4-CF ₃	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-30	Et	1	5-CF ₃	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-31	Et	1	H	2-CF ₃	Me	CH	CH		
4-32	Et	1	H	2-CF ₃	Cl	CH	CH		
4-33	Et	1	H	2-CF ₃	Br	CH	CH		
4-34	Et	1	H	2-CF ₃	I	CH	CH		
4-35	Et	1	H	2,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
4-36	Et	1	H	2,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
4-37	Et	1	H	2,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
4-38	Et	1	H	2,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
4-39	Et	1	H	2,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
4-40	Et	2	H	H	H	CH	CH		
4-41	Et	2	H	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-42	Et	2	4-Cl	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-43	Et	2	4-Br	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-44	Et	2	4-CF ₃	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-45	Et	2	5-CF ₃	2-CF ₃	H	CH	CH		

10

20

30

40

【 0 0 9 9 】

【表 4 - 2】

化合物番号	R	n	X _m	Y _p	Z	W ¹	W ²	形状	融点(°C)
4-46	Et	2	H	2-CF ₃	Me	CH	CH		
4-47	Et	2	H	2-CF ₃	Cl	CH	CH		
4-48	Et	2	H	2-CF ₃	Br	CH	CH		
4-49	Et	2	H	2-CF ₃	I	CH	CH		
4-50	Et	2	H	2,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
4-51	Et	2	H	2,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
4-52	Et	2	H	2,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
4-53	Et	2	H	2,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
4-54	Et	2	H	2,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		
4-55	n-Hex	0	H	H	H	CH	CH		
4-56	n-Hex	0	H	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-57	n-Hex	0	4-Cl	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-58	n-Hex	0	4-Br	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-59	n-Hex	0	4-CF ₃	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-60	n-Hex	0	5-CF ₃	2-CF ₃	H	CH	CH		
4-61	n-Hex	0	H	2-CF ₃	Me	CH	CH		
4-62	n-Hex	0	H	2-CF ₃	Cl	CH	CH		
4-63	n-Hex	0	H	2-CF ₃	Br	CH	CH		
4-64	n-Hex	0	H	2-CF ₃	I	CH	CH		
4-65	n-Hex	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	H	CH	CH		
4-66	n-Hex	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	Me	CH	CH		
4-67	n-Hex	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	Cl	CH	CH		
4-68	n-Hex	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	Br	CH	CH		
4-69	n-Hex	0	H	2,5-(CF ₃) ₂	I	CH	CH		

10

20

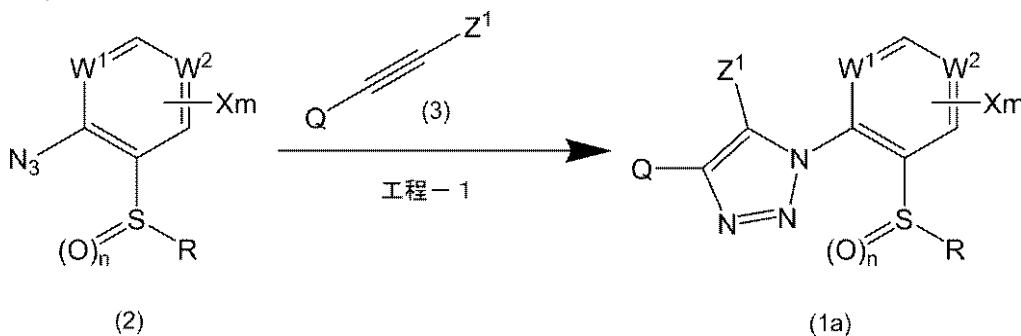
【0100】

次に、本発明の1, 2, 3-トリアゾール誘導体(1)の製造方法について詳細に説明する。なお、反応装置はマグネチックスターラー、メカニカルスターラーのほかマイクロウェーブ合成装置による反応も可能である。

【0101】

[製造方法1]

【化3】



30

(R、n、X、m、W¹、W²及びQは、一般式(1)中のR、n、X、m、W¹、W²及びQと同義である。Z¹は水素原子又はハロゲン原子を表す。)

40

【0102】

工程-1は、式(2)で示されるアジド誘導体と式(3)で表されるアセチレン誘導体を反応させることによって、1, 2, 3-トリアゾール誘導体(1a)を製造する工程である。式(2)で表されるアジド誘導体および式(3)で表されるアセチレン誘導体は、場合によっては公知であり、東京化成工業株式会社などより入手することができる。または入手可能な試薬から実験化学講座、Organic Synthesesなどに記載の公知の方法に準じて容易に製造することもできる。

【0103】

本反応では、1価又は2価の銅試薬存在下にて反応させることが必要であり、具体的な

50

銅試薬としては、塩化銅（Ⅰ）、塩化銅（Ⅱ）、臭化銅（Ⅰ）、臭化銅（Ⅱ）、ヨウ化銅（Ⅰ）、酢酸銅（Ⅰ）、酢酸銅（Ⅱ）、水酸化銅（Ⅱ）、銅トリフラート（Ⅰ）、2-チオフェンカルボン酸銅（Ⅰ）、硫酸銅（Ⅱ）などを例示することができ、場合によっては、アスコルビン酸ナトリウム等の還元剤との組み合わせを必要とすることもある。これらの銅試薬は基質（2）に対して0.01～1当量用いて反応させることにより、収率よく目的物を得ることができる。反応基質（3）は基質（2）に対して通常1～5当量用いられる。

【0104】

本反応は無溶媒下及び溶媒存在下のどちらでも行うことができる。用いる溶媒としては、反応に害を及ぼさない溶媒であれば使用することができ、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素系溶媒、ペンタン、ヘキサン、オクタン等の脂肪族炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、シクロペンチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、酢酸エチル、酢酸n-プロピル、酢酸n-ブチル、プロピオン酸メチル等のエステル系溶媒、N,N'-ジメチルホルムアミド、N,N'-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド系溶媒、メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール、tert-ブタノール等のアルコール系溶媒、ジメチルスルホキシド、水あるいはこれらの混合溶媒を用いることができる。

反応は反応条件によっても異なるが、-78 から200 までの範囲から適宜選ばれた温度で行うことができる。反応終了後は、通常の後処理操作により目的物を得ることができるが、必要であればカラムクロマトグラフィーあるいは再結晶等により精製することもできる。

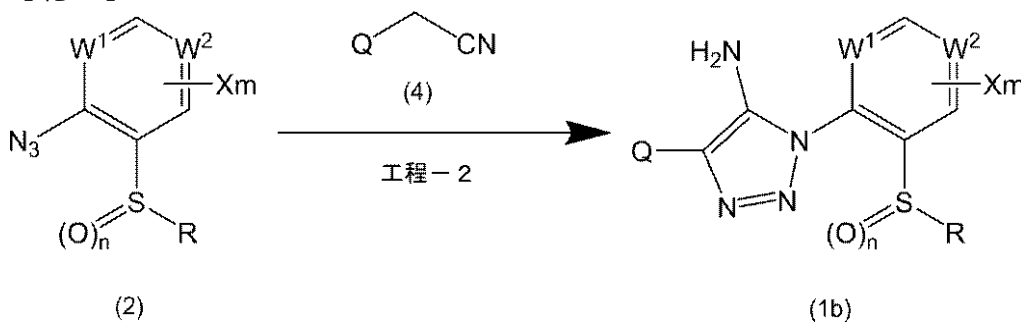
【0105】

また、Z¹がHのとき、得られた1,2,3-トリアゾール誘導体は、ブチルリチウムやリチウムジイソプロピルアミド等の塩基存在下に求電子剤を反応させることによって、所望の5-置換-1,2,3-トリアゾール誘導体へと導くこともできる。

【0106】

[製造方法2]

【化4】



(R、n、X、m、W¹、W²及びQは、一般式(1)中のR、n、X、m、W¹、W²及びQと同義である。)

【0107】

工程-2は、式(2)で示されるアジド誘導体と式(4)で表される置換アセトニトリル誘導体を反応させることによって、5-アミノ-1,2,3-トリアゾール誘導体(1b)を製造する工程である。式(4)で表される置換アセトニトリル誘導体は、場合によっては公知であり、東京化成工業株式会社などより入手することができる。または入手可能な試薬から実験化学講座、Organic Synthesesなどに記載の公知の方法に準じて容易に製造することもできる。

【0108】

本反応は塩基存在下に行うことが必須であり、塩基としては、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリ(n-ブチル)アミン、N-メチルモルホリン、N,N'-ジメチルアニリン、N,N'-ジエチルアニリン、4-tert-ブチル-N,N'-ジメチルアニリン、ピリジン、ピコリン、ルチジン等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-tert-ブトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、ナトリウムアミド、n-ブチルリチウム、tert-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド、トリメチルシリルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラジド等のアルカリ金属塩等を用いることができる。これらの塩基の中では、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等の金属塩基が収率がよい点で好ましい。塩基は基質に対して0.1~5当量用いて反応させることにより、収率よく目的物を得ることができる。反応基質(4)は基質(2)に対して通常1~5当量用いられる。

10

【0109】

本反応は無溶媒下及び溶媒存在下のどちらでも行うことができる。溶媒としては、反応に害を及ぼさない溶媒であれば使用することができ、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素系溶媒、ペンタン、ヘキサン、オクタン等の脂肪族炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、シクロペンチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、酢酸エチル、酢酸n-プロピル、酢酸n-ブチル、プロピオン酸メチル等のエステル系溶媒、N,N'-ジメチルホルムアミド、N,N'-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド系溶媒、メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール、tert-ブタノール等のアルコール系溶媒、ジメチルスルホキシド、水あるいはこれらの混合溶媒を用いることができる。

20

【0110】

反応は、使用する塩基や反応条件によっても異なるが、-78 から200 までの範囲から適宜選ばれた温度で行うことができる。反応終了後は、通常の後処理操作により目的物を得ることができるが、必要であればカラムクロマトグラフィーあるいは再結晶等により精製することもできる。

30

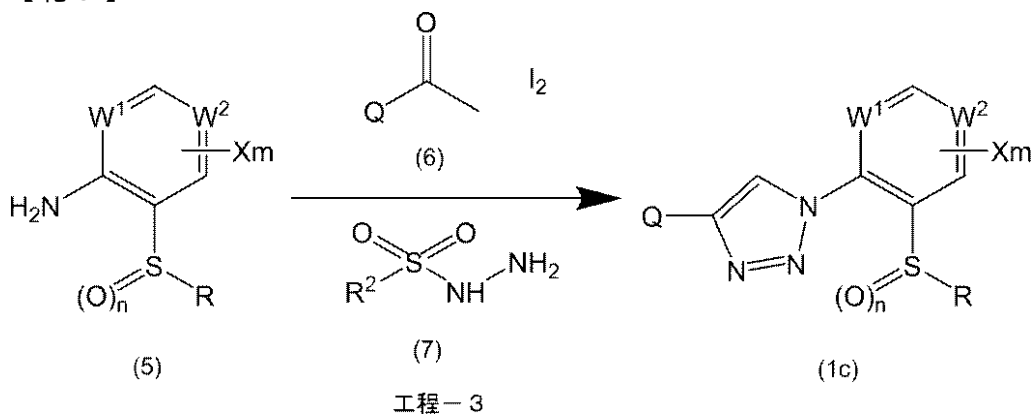
【0111】

また、得られた5-アミノ-1,2,3-トリアゾール誘導体は、求電子剤を反応させることによって、5-置換アミノ-1,2,3-トリアゾール誘導体へと導くこともできる。

【0112】

[製造方法3]

【化5】



40

(R、n、X、m、W¹、W²及びQは、一般式(1)中のR、n、X、m、W¹、W²

50

及びQと同義である。R²は置換されていてもよいフェニル基又は、C1 - C6アルキル基を表す。)

【0113】

工程-3は、式(5)で示されるアニリン誘導体、式(6)で示されるアセチル誘導体、式(7)で表される置換スルホニルヒドラジド誘導体をヨウ素存在下にて反応させることによって、1,2,3-トリアゾール誘導体(1c)を製造する工程である。式(5)で示されるアニリン誘導体、式(6)で示されるアセチル誘導体、式(7)で表される置換スルホニルヒドラジド誘導体は、場合によっては公知であり、東京化成工業株式会社などより入手することができる。または入手可能な試薬から実験化学講座、Organic Synthesesなどに記載の公知の方法に準じて容易に製造することもできる。本工程は、文献記載(Chemistry A European Journal(2014), 20, 17635 - 17639)の方法に準じて合成することができる。

10

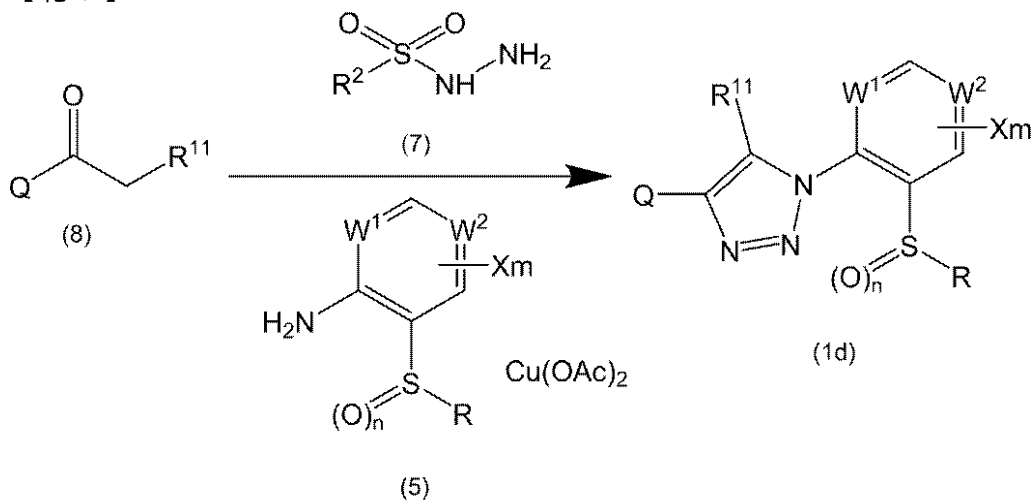
【0114】

また、得られた1,2,3-トリアゾール誘導体は、ブチルリチウムやリチウムジイソプロピルアミド等の塩基存在下に求電子剤を反応させることによって、所望の5-置換-1,2,3-トリアゾール誘導体へと導くこともできる。

【0115】

[製造方法4]

【化6】



20

30

工程-4

(R、n、X、m、W¹、W²及びQは、一般式(1)中のR、n、X、m、W¹、W²及びQと同義である。R²は置換されていてもよいフェニル基又は、C1 - C6アルキル基を表す。R¹¹は水素原子、C1 - C6アルキル基又は、C1 - C6シクロアルキル基を表す。)

【0116】

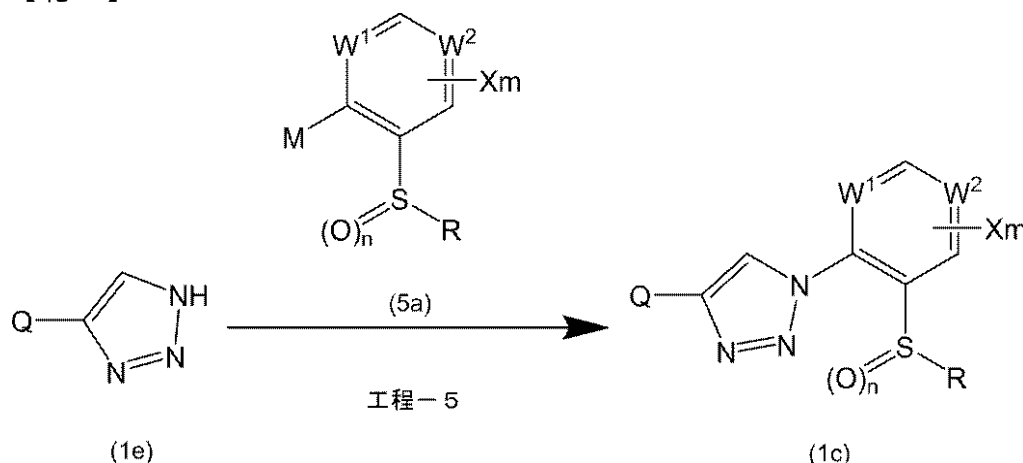
工程-4は、式(8)で示されるケトン誘導体を式(7)で表される置換スルホニルヒドラジド誘導体と反応させた後、式(5)で示されるアニリン誘導体を酢酸銅存在下にて反応させることによって、1,2,3-トリアゾール誘導体(1d)を製造する工程である。本工程は、文献記載(Chemistry A European Journal(2014), 20, 13692 - 13697)の方法に準じて合成することができる。

40

【0117】

[製造方法5]

【化7】



10

(R、n、X、m、W¹、W²及びQは、一般式(1)中のR、n、X、m、W¹、W²及びQと同義である。Mは、ハロゲン原子もしくはアルキルスルホニル基を表す。)

【0118】

工程-5は、式(1e)で示されるトリアゾール誘導体と式(5a)を反応させることによって、1,2,3-トリアゾール誘導体(1c)を製造する工程である。

本反応は塩基存在下に行うことが好ましく、塩基としては、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリブチルアミン、N-メチルモルホリン、N,N'-ジメチルアニリン、N,N'-ジエチルアニリン、4-tert-ブチル-N,N'-ジメチルアニン、ピリジン、ピコリン、ルチジン等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-tert-ブトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、ナトリウムアミド、ブチルリチウム、tert-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド、トリメチルシリルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラジド等のアルカリ金属塩等を用いることができる。これらの塩基の中では、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等の金属塩基が収率がよい点で好ましい。塩基は基質に対して1~5当量用いて反応させることにより、収率よく目的物を得ることができる。

20

30

本反応は無溶媒下及び溶媒存在下のどちらでも行うことができる。溶媒としては、反応に害を及ぼさない溶媒であれば使用することができ、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素系溶媒、ペンタン、ヘキサン、オクタン等の脂肪族炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、シクロペンチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、酢酸エチル、酢酸n-プロピル、酢酸n-ブチル、プロピオン酸メチル等のエステル系溶媒、N,N'-ジメチルホルムアミド、N,N'-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド系溶媒、メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール、tert-ブタノール等のアルコール系溶媒、ジメチルスルホキシド、水あるいはこれらの混合溶媒を用いることができる。

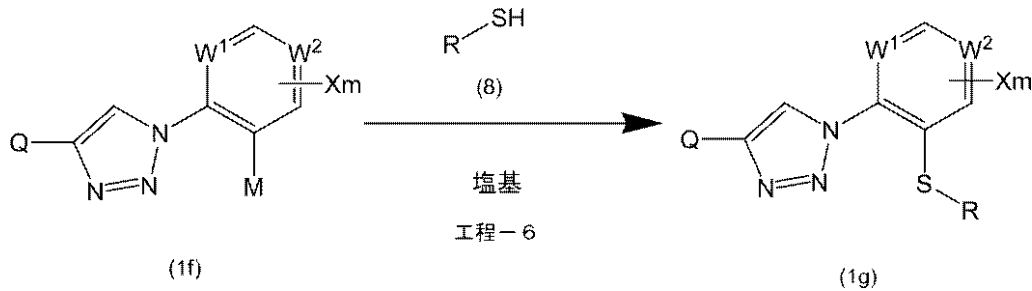
40

反応は、使用する塩基や反応条件によっても異なるが、-78 から200 までの範囲から適宜選ばれた温度で行うことができる。反応終了後は、通常の後処理操作により目的物を得ることができるが、必要であればカラムクロマトグラフィーあるいは再結晶等により精製することもできる。

【0119】

[製造方法6]

【化 8】



(R、X、m、W¹、W²、及びQは、一般式(1)中のR、X、m、W¹、W²、及びQと同義である。Mは、一般式(5a)中のMと同義である。)

【0120】

工程-6は、式(1f)で示されるトリアゾール誘導体に式(8)で表されるチオール類を反応させることによって、1,2,3-トリアゾール誘導体(1g)を製造する工程である。

本反応は塩基存在下に行うことが必須であり、塩基としては、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリブチルアミン、N-メチルモルホリン、N,N'-ジメチルアニリン、N,N'-ジエチルアニリン、4-tert-ブチル-N,N'-ジメチルアニリン、ピリジン、ピコリン、ルチジン等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-tert-ブトキシド、水素化ナトリウム、水素化カリウム、ナトリウムアミド、ブチルリチウム、tert-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド、トリメチルシリルリチウム、リチウムヘキサメチルジシラジド等のアルカリ金属塩等を用いることができる。これらの塩基の中では、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等の金属塩基が収率がよい点で好ましい。塩基は基質に対して1~5当量用いて反応させることにより、収率よく目的物を得ることができる。場合によっては、化合物(8)のチオール塩を調製した後に反応させることもできる。

また、本反応は銅、パラジウム、ロジウム、ルテニウムなどの遷移金属触媒の存在下に反応させ、化合物(1g)を得ることもできる。具体的な遷移金属触媒としては、よう化銅(I)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)を用いることができる。

本反応は無溶媒下及び溶媒存在下のどちらでも行うことができる。溶媒としては、反応に害を及ぼさない溶媒であれば使用することができ、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素系溶媒、ペンタン、ヘキサン、オクタン等の脂肪族炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、シクロペンチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、1,4-ジオキサン等のエーテル系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、プロピオン酸メチル等のエステル系溶媒、N,N'-ジメチルホルムアミド、N,N'-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド系溶媒、メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール、tert-ブタノール等のアルコール系溶媒、ジメチルスルホキシド、水あるいはこれらの混合溶媒を用いることができる。

反応は、使用する塩基や反応条件によっても異なるが、-78から200までの範囲から適宜選ばれた温度で行うことができる。反応終了後は、通常の後処理操作により目的物を得ることができるが、必要であればカラムクロマトグラフィーあるいは再結晶等により精製することもできる。

【0121】

[製造方法7]

10

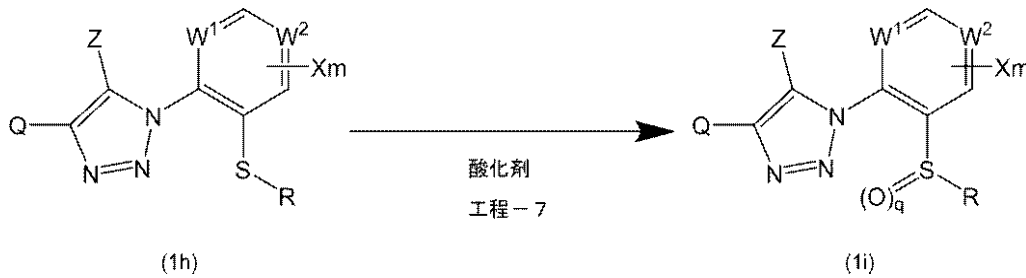
20

30

40

50

【化9】



(R、X、m、Z、W¹、W²、及びQは、一般式(1)中のR、X、m、Z、W¹、W²及びQと同義である。qは1~2の整数を表す。)

10

【0122】

本発明に係る式(1i)で表される化合物は、例えば、上記式(1h)で表される化合物と酸化剤を反応させることにより製造することができる。

【0123】

本反応に用いられる酸化剤としては、過酸化水素、m-クロロ過安息香酸、過ヨウ素ナトリウム、オキソン(OXONE、イー・アイ・デュポン社商品名；ペルオキソ硫酸水素カリウム含有物)、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド、次亜塩素酸tert-ブチル、次亜塩素酸ナトリウム、酸素等を用いることができる。これらの酸化剤の中では、m-クロロ過安息香酸、過酸化水素等が収率がよい点で好ましい。これらの酸化剤は、基質に対して0.01~10当量の範囲内で使用することが反応の進行に悪影響を与えず、好ましくは1~3当量の範囲で使用することが目的物を収率良く得られるため好ましい。

20

【0124】

本反応に用いられる触媒は、酸化モリブデン、ホウ酸、トリス(アセチルアセトン)鉄、タングステン酸ナトリウム等を用いることができ、好ましくは酸化モリブデンなどである。これらの触媒は基質(1h)に対して0.01~1当量用いて反応させることにより、収率よく目的物を得ることができる。

【0125】

本反応は溶媒中で実施することが好ましい。溶媒としては、反応に害を及ぼさない溶媒であれば使用することができ、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の香族炭化水素系溶媒、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒、N,N'-ジメチルホルムアミド、N,N'-ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン系溶媒、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、シクロヘプタン等の脂肪族炭化水素系溶媒、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール、tert-ブタノール等のアルコール系溶媒、酢酸、水、あるいはこれらの混合溶媒を用いることができる。

30

40

【0126】

反応は、使用する酸化剤や反応条件によっても異なるが、-78から溶媒還流温度までの範囲から適宜選ばれた温度で行うことができる。反応終了後は、通常の後処理操作により目的物を得ることができるが、必要であればカラムクロマトグラフィーあるいは再結晶等により精製することもできる。

【0127】

本発明化合物は、必要に応じて、融点、赤外線吸収スペクトル、¹H-NMR、¹³C-NMR、質量分析、X線構造解析などによって分析、確認、同定することができる。

【0128】

本発明化合物は、特に農園芸用の有害生物防除剤、特に殺虫・殺ダニ剤の活性成分とし

50

て有用である。

【0129】

本発明化合物は、広範囲の昆虫類、ダニ類、甲殻類、軟体動物及び線虫類に対しても、優れた防除活性を発揮しうる。農園芸用における具体例としては以下のものが挙げられる。

【0130】

例えば、昆虫類としては、シミ目のヤマトシミ (*Ctenolepisma villosa*)、セイヨウシミ (*Lepisma saccharina*)、マダラシミ (*Thermobia domestica*) など、

【0131】

ゴキブリ目のワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、ヒメチャバネゴキブリ (*Blattella lituricollis*) など、

【0132】

シロアリ目のアメリカカンザイシロアリ (*Incisitermes minor*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、タイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*) など、

バッタ目のクサキリ (*Ruspolia lineosa*)、エンマコオロギ (*Teleogryllus emma*)、ケラ (*Gryllotalpa orientalis*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*) など、

【0133】

チャタテムシ目のコチャタテ (*Trogium pulsatorium*)、ヒラタチャタテ (*Liposcelis bostrychophila*)、ウスグロチャタテ (*Liposcelis corrodens*) など、

【0134】

ハジラミ目のニワトリナガハジラミ (*Lipeurus caponis*)、ニワトリオオハジラミ (*Menacanthus stramineus*)、ウシハジラミ (*Damalinia bovis*)、ウマハジラミ (*Damalinia caprae*) など、

【0135】

シラミ目のウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、コロモジラミ (*Pediculus humanus capitis*)、アタマジラミ (*Pediculus humanus humanus*)、ケジラミ (*Pthirus pubis*) など、

【0136】

アザミウマ目のヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、クロトンアザミウマ (*Heliothrips haemorrhoidalis*)、ダイズアザミウマ (*Mycterothrips glycines*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、イネアザミウマ (*Stenchaetothrips biformis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、イネクダアザミウマ (*Haplothrips aculeatus*)、カキクダアザミウマ (*Ponticulothrips diospyrosi*) など、

【0137】

カメムシ目のフタテンヒメヨコバイ (*Arboridia apicalis*)、チャ

10

20

30

40

50

ノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)、ツماغロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、アオバハゴロモ (*Geisha distinctissima*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ブドウネアブラムシ (*Viteus vitifoliae*)、エンドウヒゲナガアブラムシ (*Acyrtosiphon pisum*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、リンゴアブラムシ (*Aphis pomi*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ムギミドリアブラムシ (*Schizaphis graminum*)、ナシアブラムシ (*Schizaphis piricola*)、コミカンアブラムシ (*Toxoptera aurantii*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricida*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、オンシツコナジラミ (*Trialeturodes vaporariorum*)、オオワラジカイガラムシ (*Drosicha corpulenta*)、イセリアカイガラムシ (*Icerya purchasi*)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*)、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*)、ナシマルカイガラムシ (*Diaspidiotus perniciosus*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)、アカホシカメムシ (*Creontiades coloripes*)、アカヒゲホソミドリカスミカメ (*Trigonotylus caelestialium*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyrioides*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris aeneus*)、オオトゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris lewisii*)、ツヤアオカメムシ (*Glaucias subpunctatus*)、アカスジカメムシ (*Graphosoma rubrolineatum*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha halys*)、アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、チャバネアオカメムシ (*Plautia crossotastali*)、カンシャコバネナガカメムシ (*Cavelerius saccharivorus*)、コバネヒョウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)、アカヒメヘリカメムシ (*Rhopalus maculatus*)、トコジラミ (*Cimex lectularis*) など、

【0138】

コウチュウ目のアオドウガネ (*Anomala albopilosa*)、ドウガネブイ (*Anomala cuprea*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、ハナムグリ (*Eucetonia pilifera*)、コアオハナムグリ (*Gametis jucunda*)、ナガチャコガネ (*Heptophylla pi*

cea)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、トビイロムナボソコメツキ(*Agriotes ogurae fuscicollis*)、カバイロコメツキ(*Ectinus sericeus sericeus*)、マルクビクシコメツキ(*Melanotus fortnumi fortnumi*)、ヒメマルカツオブシムシ(*Anthrenus verbasci*)、タバコシバンムシ(*Lasioderma serricornis*)、コクヌスト(*Tenebroides mauritanicus*)、ヒメヒラタケシキスイ(*Epuraea domina*)、インゲンテントウ(*Epilachna varivestis*)、ニジュウヤホシテントウ(*Henosepilachna vigintioctopunctata*)、チャイロコメノゴミムシダマシ(*Tenebrio molitor*)、コクヌストモドキ(*Tribolium castaneum*)、ゴマダラカミキリ(*Anoplophora malasiaca*)、マツノマダラカミキリ(*Monochamus alternatus endai*)、ブドウトラカミキリ(*Xylotrechus pyrrhoderus*)、アズキゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、カメノコハムシ(*Cassida nebulosa*)、テンサイトビハムシ(*Chaetocnema concinna*)、ウエスタンコーンルートワーム(*Diabrotica virgifera virgifera*)、サザンコーンルートワーム(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ(*Diabrotica* spp.)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、アリモドキゾウムシ(*Cylas formicarius*)、ワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*)、イモゾウムシ(*Euscepes postfasciatus*)、アルファルフアタコゾウムシ(*Hypera postica*)、ヤサイゾウムシ(*Listroderes costirostris*)、イネゾウムシ(*Echinocnemus bipunctatus*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhopterus oryzophilus*)、コクゾウムシ(*Sitophilus zeamais*)、シバオサゾウムシ(*Sphenophrus venatus vestitus*)、マツノクイムシ(*Tomicus pini perda*)、ヒラタキクイムシ(*Lyctus brunneus*)など、

【0139】

ノミ目のニワトリノミ(*Ceratophyllus gallinae*)、イヌノミ(*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ(*Ctenocephalides felis*)、ニワトリフトノミ(*Echidnophaga gallinacea*)、ヒトノミ(*Pulex irritans*)、ケオプスネズミノミ(*Xenopsylla cheopis*)など、

【0140】

ハエ目のダイズサヤタマバエ(*Asphondylia yushimai*)、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、シナハマダラカ(*Anopheles sinensis*)、アカイエカ(*Culex pipiens pallens*)、ネッタイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、コガタアカイエカ(*Culex tritaeniorhynchus*)、ウリミバエ(*Bactrocera cucurbitae*)、ミカンコミバエ(*Bactrocera dorsalis*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、ナモグリバエ(*Chromatomyia horticola*)、アシグロハモグリバエ(*Liriomyza huidobrensis*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、タマネギバエ(*Delia antiqua*)、タネバエ(*Delia platura*)、イエバエ(*Musca domestica*)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans*)など、

【0141】

チョウ目のチャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、リンゴ
 コカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、ミダレカ
 クモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*)、コドリガ (*Cyd
 ia pomonella*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molest
 a*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、マメシンクイガ (*Legum
 inivora glycinivorella*)、トビハマキ (*Pandemis hep
 arana*)、イガ (*Tinea translucens*)、モモハモグリガ (*L
 yonetia clerkella*)、ギンモンハモグリガ (*Lyonetia pr
 unifoliella malinella*)、チャノホソガ (*Caloptilia
 theivora*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringon
 iella*)、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)、
 コナガ (*Plutella xylostella*)、ブドウスカシバ (*Nokona
 regalis*)、コスカシバ (*Synanthedon hector*)、カキノヘタ
 ムシガ (*Stathmopoda masinissa*)、イモキバガ (*Helcyst
 ogramma triannulellum*)、ワタアカミムシ (*Pectinoph
 ora gossypiella*)、モモシンクイガ (*Carposina sasak
 ii*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cna
 phalocrocis medinalis*)、モモノゴマダラメイガ (*Conoge
 thes punctiferalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula un
 dalis*)、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、ヨーロピ
 アンコーンボーラー (*Ostrinia nubilalis*)、シロイチモジマダラメイ
 ガ (*Etiella zinckenella*)、アゲハ (*Papilio xuthu
 s*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、イチモンジ
 セセリ (*Parnara guttata guttata*)、ヨモギエダシャク (*As
 cotis selenaria*)、チャドクガ (*Arna pseudoconspe
 rsa*)、マイマイガ (*Lymantria dispar*)、アメリカシロヒトリ (*H
 yphantria cunea*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、
 カブラヤガ (*Agrotis segetum*)、タマナギンウワバ (*Autograp
 ha nigrisigna*)、オオタバコガ (*Helicoverpa armige
 ra*)、ヘリオチス (*Heliothis spp.*)、ヨトウガ (*Mamestra
 brassicae*)、アワヨトウ (*Mythimna separata*)、フタオビ
 コヤガ (*Naranga aenescens*)、シロイチモジヨトウ (*Spodopt
 era exigua*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) など
 、

10

20

30

【0142】

ハチ目のチュウレンジハバチ (*Arge pagana*)、カブラハバチ (*Athalia
 rosae ruficornis*)、クリタマバチ (*Dryocosmus kuriphilus*)、
 キイロスズメバチ (*Vespa simillima xanthoptera*)、クロヤマアリ
 (*Formica japonica*)、イエヒメアリ
 (*Monomorium pharaonis*)、ファイヤーアント (*Solenops
 is invicta*) などが挙げられる。

40

【0143】

ダニ類としては、ミツバチヘギイタダニ (*Varroa jacobsoni*)、ワク
 モ (*Dermanyssus gallinae*)、イエダニ (*Ornithonyssus
 bacoti*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylvialum*)、オオヤマダニ
 (*Amblyomma spp.*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、アミメ
 マダニ (*Dermacentor spp.*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、
 ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campanulata*)、フタトゲチマダニ
 (*Haemaphys*

50

alis longicornis)、ヤマトマダニ(Ixodes ovatus)、シュルツェマダニ(Ixodes persulcatus)、クリイロコイタマダニ(Rhipicephalus sanguineus)、ハクサイダニ(Penthalus erythrocephalus)、ムギダニ(Penthaleus major)、シクラメンホコリダニ(Phytonemus pallidus)、チャノホコリダニ(Polyphagotarsonemus latus)、スジブトホコリダニ(Tarsonemus bilobatus)、イヌニキビダニ(Demodex canis)、ネコニキビダニ(Demodex cati)、イネハダニ(Oligonychus shinkajii)、ミカンハダニ(Panonychus citri)、クワオオハダニ(Panonychus mori)、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)、ナミハダニ(Tetranychus urticae)、チャノナガサビダニ(Acaphylla theavagrans)、チューリップサビダニ(Aceria tulipae)、トマトサビダニ(Aculops lycopersici)、ミカンサビダニ(Aculops pelekassi)、リンゴサビダニ(Aculus schlechtendalii)、チャノサビダニ(Calacarus carinatus)、ナシサビダニ(Epitrimerus pyri)、ニセナシサビダニ(Eriophyes chibaensis)、シトラスラストマイルト(Phyllocoptruta oleivora)、ロビンネダニ(Rhizoglyphus robini)、ケナガコナダニ(Tyrophagus putrescentiae)、ハウレンソウケナコナダニ(Tyrophagus similis)、ニワトリヒゼンダニ(Knemidokoptes spp.)、ヒツジキュウセンダニ(Psoroptes ovis)、ネコシヨウセンコウヒゼンダニ(Notoedres cati)、センコウヒゼンダニ(Sarcoptes scabiei)、アカツツガムシ(Leptotrombidium akamushi)、ネコツメダニ(Cheyletiella blakei)、イヌツメダニ(Cheyletiella yasguri)、コナヒョウビダニ(Dermatophagoidea farinae)、セアカゴケグモ(Latrodectus hasseltii)などが挙げられる。

【0144】

甲殻類としては、オビヤスデ目のヤケヤスデ(Oxidus gracilis)など

【0145】

等脚目オカダンゴムシ(Armadillidium vulgare)など、

【0146】

十脚目のアメリカザリガニ(Procambarus clarkii)など、

【0147】

トビムシ目のキボシマルトビムシ(Bourletiella hortensis)などが挙げられる。

【0148】

軟体動物としては、原始紐舌目のスクミリングガイ(Pomacea canaliculata)など、

【0149】

有肺目のアフリカマイマイ(Achatina fulica)、ナメクジ(Meghimatium bilineatum)、チャコウラナメクジ(Lehmannina valentiana)、ウスカワマイマイ(Acusta despecta sieboldiana)などが挙げられる。

【0150】

線虫類としては、ティレンクス目のイチゴメセンチュウ(Nothotylenchus acris)、サツマイモネコブセンチュウ(Meloidogyne incog

10

20

30

40

50

nita)、ジャガイモシストセンチュウ(*Globodera rostochiensis*)、ダイズシストセンチュウ(*Heterodera glycines*)、ミカンネセンチュウ(*Tylenchulus semipenetrans*)、ミナミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus coffeae*)、キタネグサレセンチュウ(*Pratylenchus penetrans*)、ネグサレセンチュウ(*Pratylenchus yamagutii*)、ニセネグサレセンチュウ(*Aphelenchus avenae*)、イネシンガレセンチュウ(*Aphelenchoides besseyi*)、マツノザイセンチュウ(*Bursaphelenchus xylophilus*)などが挙げられる。

【0151】

その他、動物内部寄生生物として、回虫類等、ぎょう虫類等、フィラリア類等、肝臓ジストマ、肺臓ジストマ、横川吸虫、日本住血吸虫、有鉤条虫、無鉤条虫、エキノコックス、広節裂頭条虫などが挙げられる。

【0152】

本発明化合物は農園芸用有害生物防除剤性成分として用いることができる。また製剤化においては、農薬製剤ガイド(編集:日本農薬学会施用法研究会、発行:社団法人日本植物防疫協会)に記載される適当な担体、補助剤、界面活性剤、結合剤および安定剤などを配合してもよい。

【0153】

本発明化合物を含む農園芸用有害生物防除剤は、農園芸用有害生物防除剤の剤型として一般に使用されている任意の剤型に製剤化することができる。例えば、粉剤、粗粉剤、DL(ドリフトレス型)粉剤、フローダスト剤、微粒剤、細粒剤、粒剤、水和剤、顆粒水和剤、液剤、ゾル剤(フロアブル剤)、乳剤および油剤など通常用いられる剤型に製剤化することができるが、これらに限定されるものではない。

【0154】

本発明化合物の含有量は、製剤の剤型および使用方法により、適宜選択することができる。一般に好ましい含有量は、製剤全体量に対して0.0001~90重量%の範囲である。

【0155】

本発明化合物を、農園芸用有害生物防除剤として使用する場合には必要に応じて製剤時または散布時に、殺菌剤(殺かび剤、殺細菌剤、抗ウイルス剤、植物抵抗性誘導剤)、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、鳥類忌避剤、生長調整剤、肥料、土壌改良剤等から選ばれる1種以上の任意成分と混合製剤とし、あるいは散布時にタンクミックスで混用施用してもよい。

【0156】

上記任意成分のうち、殺菌剤および殺虫・殺ダニ剤の代表例を以下に示すが、これらのみ限定されるものではない。

【0157】

殺菌剤:

(1) 銅剤

塩基性塩化銅(*copper oxychloride*)、塩基性硫黄銅(*copper sulfate*)、水酸化第二銅(*copper hydroxide*)、硫酸銅(*copper sulfate*)、オキシ銅(*oxine-copper*)、ノニルフェノールスルホン銅(*copper nonylphenol sulfonate*)、DBEDCなど。

【0158】

(2) 無機殺菌剤

硫黄(*sulfur*)、石灰硫黄合剤(*calcium polysulfide*)、炭酸水素ナトリウム(*sodium hydrogen carbonate*)、炭酸水素カリウム(*potassium hydrogen carbonate*)、金属銀(

10

20

30

40

50

silver)など。

【0159】

(3) 有機硫黄殺菌剤

ジラム(ziram)、マンネブ(maneb)、マンコゼブ(mancozeb)、アンバム(ambam)、ポリカーバメート(polycarbamate)、プロピネブ(propineb)、チウラム(thiuram)、チアジアジン(thiadiazin)、ジネブ(zineb)など。

【0160】

(4) 有機リン系殺菌剤

IBP、EDDP、トルクロホスメチル(tolclofos-methyl)、ピラゾホス(pyrazophos)、ホセチル(fosetyl-aluminium)など。

10

【0161】

(5) ベンゾイミダゾール系殺菌剤

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

【0162】

(6) ジカルボキシイミド系殺菌剤

イプロジオン(iprodione)、プロシミドン(procymidone)、ビクロゾリン(vinclozolin)など。

20

【0163】

(7) カルボキサミド系殺菌剤

オキシカルボキシン(carboxin)、カルボキシン(carboxin)、メプロニル(mepronil)、フルトラニル(flutolanil)、ボスカリド(boscailid)、フルオピラム(flupyram)、フラメトピル(furametpyr)、チフルザミド(thifluzamide)、ペンチオピラド(penthiopyrad)、ビキサフェン(bixafen)、ペンフルフェン(penflufen)、フルキサピロキサド(fluxapyroxad)、イソピラザム(isopyrazam)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、セダキサン(sedaxane)など。

30

【0164】

(8) フェニルアמיד系殺菌剤

メタラキシル(metalaxyil)、メタラキシルM(metalaxyil-M)、オキサジキシル(oxadixyl)、フララキシル(furalaxyil)、オフラーズ(ofurace)、ベナラキシル(benalaxyil)、ベナラキシルM(benalaxyil-M)など。

【0165】

(9) カルボン酸アミド系殺菌剤

ジメトモルフ(dimethomorph)、フルモルフ(flumorph)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)、ベンチアバリカルブイソプロピル(benthiavalicarb-isopropyl)、マンジプロパミド(mandipropamid)、バリフェナレート(valifenalate)など。

40

【0166】

(10) SBI剤

トリフルミゾール(triflumizole)、プロクロラズ(prochloraz)、オキシポコナゾールフマル酸塩(oxpoconazole fumarate)、トリアジメホン(triadimefon)、ピテルタノール(bitertanol)、ミクロブタニル(myclobutanil)、フェンブコナゾール(fenbuconazole)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、テブコナゾール(tebuconazole)、プロピコナゾール(propiconazole)、プロ

50

チオコナゾール (prothioconazole)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、イブコナゾール (ipconazole)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、シメコナゾール (simeconazole)、メトコナゾール (metconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、イマザリル (imazalil)、フェナリモル (fenarimol)、トリホリン (triforine)、トリアジメノール (triadimenol)、フルトリアホル (flutriafol)、ピリフェノックス (pyrifenoxy)、トリデモルフ (tridemorph)、ドデモルフ (dodemorph)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンプロピジン (fenpropidin)、スピロキサミン (spiroxamine)、ピルイソキサゾール (pyrisoxazole)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、ピリブチカルブ (pyributicarb) など。

10

【0167】

(11) ストロビルリン系殺菌剤

アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クレソキシムメチル (kresoxim-methyl)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、メトミノストロビン (metominostrobin)、オリサストロビン (orysastrobin)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、エネストロブリン (enestroburin)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin) など。

20

【0168】

(12) アニリノピリミジン系殺菌剤

シプロジニル (cyprodinil)、メパニピリム (mepanipyrim)、ピリメタニル (pyrimethanil) など。

【0169】

(13) フェニルピロール系殺菌剤

フルジオキサニル (fludioxonil)、フェンピクロニル (fenpiclonil) など。

30

【0170】

(14) 抗生物質殺菌剤

カスガマイシン (kasugamycin)、ポリオキシシン (polyoxin)、バリダマイシン (validamycin)、ストレプトマイシン (streptomycin)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)、ブラストサイジン S (blasticidin-S) など。

【0171】

(15) その他の殺菌剤

DKF-1001 (コード番号)、IKF-5411 (コード番号)、MIF-1002 (コード番号)、NC-233 (コード番号)、S-2200 (コード番号)、SB-4303 (コード番号)、アシベンゾラル S メチル (acibenzolar-S-methyl)、アミスルブロム (amisulbrom)、アメトクトラジン (ametoctradin)、イソチアニル (isotianil)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イミノクタジンアルベシル酸塩 (iminooctadine tris(albesilate))、イミノクタジン酢酸塩 (iminooctadine triacetate)、エクロメゾール (echlomezol)、エタボキサム (ethaboxam)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、カプタホル (captafol)、カルプロパミド (carpropamid)、キノキシフェン (quinoxifen)、キノメチオナート (chinomethionat)、キ

40

50

ャブタン (captan)、クロロネブ (chloroneb)、クロロタロニル (chlorothalonil)、シアゾファミド (cyazofamid)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ジクロシメット (diclocymet)、ジクロメジン (diclomezine)、ジチアノン (dithianon)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、ジフルメトリム (diflumetorim)、シモキサニル (cymoxanil)、シルチオファミン (siltiofamin)、ゾキサミド (zoxamide)、ダゾメット (dazomet)、チアジニル (tiadinil)、テクロフタラム (teclofthalam)、テブフロキン (tebufloquin)、ドジン (dodine)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トルミファニド (tolnifanide)、ヒドロキシイソキサゾール (hydroxyisoxazole)、ピリオフェノン (pyriofenone)、ピロキロン (pyroquilon)、フェノキサニル (fenoxanil)、フェリムゾン (ferimzone)、フェンピラザミン (fenpyrazamine)、フサライド (phthalide)、ブピリメート (bupirimate)、ファミキサドン (famoxadone)、フェナミドン (fenamidone)、フルアジナム (fluazinam)、フルオピコリド (fluopicolide)、フルオルイミド (fluoroimide)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルチアニル (flutianil)、プロキナジド (proquinazid)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride)、プロベナゾール (probenazole)、ペンシクロン (penicycuron)、ホルベット (folpet)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、メトラフェノン (metrafenone)、ラミナリン (laminarin) など。

【0172】

殺虫剤：

(1) 有機リン系殺虫剤

アセフェート (acephate)、アジンホス - メチル (azinphos - methyl)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルピリホス - メチル (chlorpyrifos - methyl)、シアノホス (cyanophos)、ダイアジノン (diazinon)、ジクロフェンチオン (dichlofenthion)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジメトエート (dimethoate)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジスルホトン (disulfoton)、EPN、エチオン (ethion)、エトプロホス (ethoprophos)、フェナミホス (fenamiphos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェンチオン (fenthion)、イソフェンホス (isofenphos)、イソキサチオン (isoxathion)、馬拉チオン (malathion)、メチダチオン (methidathion)、メビンホス (mevinphos)、モノクロトホス (monocrotophos)、ナレド (naled)、オキシデメトン - メチル (oxydemeton - methyl)、パラチオン (parathion)、パラチオン - メチル (parathion - methyl)、フェントエート (phenthoate)、ホレート (phorate)、ホサロン (phosalone)、ホスメット (phosmet)、ホスファミドン (phosphamidon)、ホキシム (phoxim)、ピリミホスメチル (pirimiphos - methyl)、プロフェノホス (profenofos)、プロパホス (propaphos)、プロチオホス (prothiofos)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリダフェンチオン (pyridaphenthion)、キナルホス (quinalphos)、テブピリミホス (tebupirifos)、テムホス (temephos)、テルブホス (terbufos)、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos)、チオメトン (thiometon)、トリクロルホン (trichlorfon)、バミドチオン (vamidothion)

)など。

【0173】

(2) カーバメート系殺虫剤

アルジカルブ(aldicarb)、アラニカルブ(alanycarb)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocarb)、メチオカルブ(methiocarb)、メソミル(methomyl)、メトルカルブ(metolcarb)、オキサミル(oxamyl)、ピリミカルブ(pirimicarb)、プロボキスル(propoxur)、チオジカルブ(thiodicarb)、トリアザメート(triazamate)、XMC、キシリカルブ(xyllylcarb)など。

10

【0174】

(3) ピレスロイド系殺虫剤

アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリン(allethrin)、ピフェントリン(bifenthrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、ラムダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ガンマ-シハロトリン(gamma-cyhalothrin)、シベルメトリン(cypermethrin)、アルファ-シベルメトリン(alpha-cypermethrin)、ゼータ-シベルメトリン(etha-cypermethrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(etofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルバリネート(flualinate)、タウ-フルバリネート(tau-fluvalinate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、メトフルトリン(metofluthrin)、ペルメトリン(permethrin)、フェノトリン(phenothrin[(1R)-trans-isomer])、ピレトリン(pyrethrins)、レスメトリン(resmethrin)、シラフルオフエン(silaflofen)、テフルトリン(tefluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、トラロメトリン(tralomethrin)など。

20

30

【0175】

(4) ネライストキシン系殺虫剤

ベンスルタップ(bensultap)、カルタップ(cartap hydrochloride)、チオシクラム(thiocyclam)など。

【0176】

(5) ネオニコチノイド系殺虫剤

アセタミプリド(acetamiprid)、クロチアニジン(clothianidin)、ジノテフラン(dinotefuran)、イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)など。

40

【0177】

(6) ジアミド系殺虫剤

クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール(cyantraniliprole)、フルベンジアミド(flubendiamide)、シクラニリプロール(cyclaniliprole)など。

【0178】

50

(7) フェニルピラゾール系殺虫剤

アセトプロール (acetoprole)、エチプロール (ethiprole)、フィプロニル (fipronil)、フルフィプロール (flufiprole)、ピラフルプロール (pyrafluprole)、ピリプロール (pyriprole) など。

【0179】

(8) マクロライド系殺虫剤

アバメクチン (abamectin)、アベルメクチン (avermectin)、エマメクチンベンゾエート (emamectin benzoate)、レピメクチン (lepimectin)、ミルベメクチン (milbemectin)、スピネートラム (spinetoram)、スピノサド (spinosad) など。

【0180】

(9) ベンゾイルウレア系殺虫剤

ビストリフルロン (bistrifluron)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、フルアズロン (fluazuron)、フルシクロクスロン (flucycloxaduron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ルフエヌロン (lufenuron)、ノバルロン (novaluron)、ノビフルムロン (noviflumuron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、トリフルムロン (triflumuron) など。

【0181】

(10) ジアシルヒドラジン系殺虫剤

クロマフェノジド (chromafenozide)、ハロフェノジド (halofenozide)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、テブフェノジド (tebufenozide) など。

【0182】

(11) その他の殺虫剤有効成分

アザジラクチン (azadirachtin)、ブプロフェジン (buprofezin)、キノメチオネート (chinomethionat)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、シロマジン (cyromazine)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ジコホル (dicofol)、ジエノクロル (dienochlor)、エンドスルファン (endosulfan)、フロメトキン (flometquin)、フロニカミド (flonicamid)、フルフェネリム (flufennerim)、フルピラジフロン (flupyradifurone)、ヒDRAMETHYLNON (hydramethylnon)、ハイドロブレン (hydroprene)、インドキサカルブ (indoxacarb)、メタフルミゾン (metaflumizone)、メタアルデヒド (metaldehyde)、メトブレン (methoprene)、メトキシクロル (methoxychlor)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリダリル (pyridalyl)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazone)、ピリプロキシフェン (pyriproxifen)、ロテノン (rotenone)、スピロテトラマト (spirotetramat)、スルホキサフロル (sulfoxafloer)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トリフルメゾピリム (triflumezopyrim)、AKD-1193 (コード番号)、MIE-1209 (コード番号)、NA-89 (コード番号)、NC-515 (コード番号)、ME5382 (コード番号)、ZDI-2501 (コード番号)、オレイン酸ナトリウム、ケイソウ土、脂肪酸グリセリド、デンプン (starch)、なたね油、粘着剤 (polybutene)、プロピレングリコールモノ脂肪酸エステル、マシン油 (petroleum oil)、硫酸ニコチン (nicotine-sulfate)、燐酸第二鉄など。

【0183】

(12) 殺ダニ剤

10

20

30

40

50

アセキノシル(acequinocyl)、アミドフルメト(amidoflumet)、アミトラズ(amitraz)、ピフェナゼート(bifenazate)、プロモプロピレート(bromopropylate)、クロフェンテジン(clofentezine)、シエノピラフェン(cyenoxyrafen)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、シヘキサチン(cyhexatin)、エトキサゾール(etoxazole)、フェナザキン(fenazaquin)、酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フルアクリピリム(flucrypyrim)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)、プロパルギット(propargite)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、ピリダベン(pyridaben)、スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロメシフェン(spiromesifen)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、テトラジホン(tetradifon)など。

10

【0184】

(13) 殺線虫剤

アルドキシカルブ(aldoxycarb)、カズサホス(cadusafos)、カーバムナトリウム塩(carbam sodium)、1,3-ジクロロプロペン(1,3-dichloropropene)、DCIP、フルエンシルホン(fluensulfone)、ホスチアゼート(fosthiazate)、イミシアホス(imicyafos)、塩酸レバミゾール(levamisol hydrochloride)、メスルフェンホス(mesulfenfos)、メチルイソチオシアネート(methyl isothiocyanate)、酒石酸モランテル(morantel tartarate)、ネマデクチン(nemadectin)など。

20

【0185】

(14) その他

核多角体ウイルス(nuclear polyhedrosis virus, NPV)、顆粒病ウイルス(granulosis virus, GV)、細胞質多角体病ウイルス(cytoplasmic polyhedrosis virus, CPV)、昆虫ボックスウイルス(entomopoxvirus, EPV)などのウイルス剤、バチルス・チューリンゲンシス菌由来の生芽胞および産生結晶毒素、並びにそれらの混合剤、スタイナーネマ・カーポカプサエ(Steinernema carpocapsae)、パストーリア・ペネートランス(Pasteuria penetrans)等の殺虫・殺線虫剤として利用される微生物農薬、昆虫フェロモン剤、昆虫誘引剤など。

30

【0186】

本発明化合物を活性成分として含む農園芸用有害生物防除剤は、有害生物防除剤として通常用いられる方法で使用することができる。具体的には、水和剤、液剤、乳剤、ゾル剤(フロアブル剤)、顆粒水和剤、または油剤の場合は、水で50~10000倍に希釈して、一般に活性成分が1~10000ppm、好ましくは1~1000ppmの濃度の液になるように調製し、この希釈液を、水稲や果樹など作物形態により異なるが、農耕地10アール当たり50~1000L、通常は、100~600Lの範囲で植物の病害発生部位の茎葉に散布しうる。

40

【0187】

また、活性成分が所定の濃度となるよう水で希釈した薬液をヘリコプター(RCヘリコプターを含む)で散布する空中散布により、農園芸の有害生物に供することもできる。

【0188】

粉剤、粗粒剤、DL粉剤、フローダスト剤、微粒剤、細粒剤、または粒剤の場合は、10アール当たり0.3~50kgの剤(活性成分含有量は約5~500g)を、植物の害虫発生部位の茎葉、土壌表面、土壌中、または水面に施用してもよい。

【0189】

水稲などの育苗箱栽培においては、粒剤などを育苗箱(標準サイズ:30cm×60cm

50

m × 5 cm) 当り 10 ~ 100 g を、フロアブル剤などは希釈せずにそのままあるいは希釈して、30 ~ 1000 mL を、播種時前あるいは後から移植当日までの間に、土壌表面ないし土壌中に施用することができる。

【実施例】

【0190】

以下、1, 2, 3 - トリアゾール誘導体の合成例、製剤例および試験例により本発明を更に具体的に説明するが、本発明はそれらに何ら限定されるものではない。

【0191】

<合成例1>

(1) 2 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチニルトリメチルシランの合成

10

窒素雰囲気下、3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ブロモベンゼン(80.0 g、273.0 mmol)のトリエチルアミン(270 mL)溶液に塩化パラジウム(II)(2.4 g、13.7 mmol)、トリフェニルホスフィン(7.2 g、27.3 mmol)、よう化銅(I)(4.2 g、21.8 mmol)、を順次加え、氷冷下でトリメチルシリルアセチレン(32.2 g、327.6 mmol)を滴下した。滴下終了後、室温で一晩攪拌し、セライトろ過した。ろ液を減圧濃縮後、アンモニア水(30 mL)と水を加え、ヘキサンで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:ヘキサン)により精製して、橙色油状の標記化合物(83.1 g、収率98%)を得た。

20

¹H NMR スペクトル(CDC1₃) : 7.88 (2H, s), 7.79 (1H, s), 0.27 (9H, s) .

【0192】

(2) 1 - エチニル - 3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンゼンの合成

2 - [3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル]エチニルトリメチルシラン(83.1 g、267.7 mmol)のメタノール(70 mL)及びクロロホルム(70 mL)溶液に、炭酸カリウム(7.4 g、53.5 mmol)を添加し、室温で一晩攪拌した。溶媒を減圧留去後、溶液に水を加え、ジエチルエーテルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、粗生成物を減圧蒸留(82、100 mbar)により精製し、無色油状の標記化合物(48.7 g、収率76%)を得た。

30

¹H NMR スペクトル(CDC1₃) : 7.92 (2H, s), 7.84 (1H, s), 3.26 (1H, s) .

【0193】

(3) 2 - エチルスルファニルアニリンの合成

2 - アミノチオフェノール(15.0 g、119.8 mmol)のメタノール(25 mL)溶液に、28%ナトリウムメトキシド - メタノール溶液(27.7 g、143.8 mmol)を加え、加熱還流下でヨードエタン(18.7 g、119.8 mmol)のメタノール(15 mL)溶液を滴下した。滴下終了後、6時間加熱還流し、室温まで放冷後、溶媒を減圧留去した。得られた反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:酢酸エチル/ヘキサン = 1 : 20)により精製して、橙褐色油状の標記化合物(収量17.8 g、収率97%)を得た。

40

¹H NMR スペクトル(CDC1₃) : 7.37 (1H, dd, J₁ = 7.6 Hz, J₂ = 1.6 Hz), 7.11 (1H, td, J₁ = 7.7 Hz, J₂ = 1.8 Hz), 6.73 (1H, dd, J₁ = 8.0 Hz, J₂ = 1.1 Hz), 6.69 (1H, td, J₁ = 7.6 Hz, J₂ = 1.4 Hz), 4.34 (2H, br), 2.76 (2H, q, J = 7.3 Hz), 1.23 (3H, t, J = 7.3 Hz) .

50

【0194】

(4) 1-アジド-2-エチルスルファニルベンゼンの合成

2-エチルスルファニルアニリン(17.8g、115.8mmol)の35%塩酸(30mL)及び水(30mL)の混合溶液を-5℃に冷却し、亜硝酸ナトリウム(9.6g、139.0mmol)水溶液(35mL)を滴下した。滴下終了後、-5℃で30分攪拌し、ついでアジ化ナトリウム(11.3g、173.7mmol)水溶液(40mL)を滴下した。-5℃で60分、室温で4時間攪拌した。反応溶液に酢酸エチルを加えて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:酢酸エチル/ヘキサン=1:20)により精製して、黄色油状の標記化合物(19.3g、収率93%)を得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル(CDCl_3) : 7.30(1H, dd, $J_1 = 7.8\text{ Hz}$, $J_2 = 1.4\text{ Hz}$), 7.24-7.22(1H, m), 7.14(1H, dd, $J_1 = 7.8\text{ Hz}$, $J_2 = 0.9\text{ Hz}$), 7.10(1H, td, $J_1 = 7.6\text{ Hz}$, $J_2 = 1.4\text{ Hz}$), 2.94(2H, q, $J = 7.3\text{ Hz}$), 1.32(3H, t, $J = 7.3\text{ Hz}$) .

【0195】

(5) 4-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(2-エチルスルファニルフェニル)トリアゾール(1-75)の合成

1-アジド-2-エチルスルファニルベンゼン(4.5g、25.2mmol)のtert-ブタノール(36mL)及び水(18mL)の混合溶液に、1-エチニル-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゼン(6.0g、25.2mmol)、無水硫酸銅(II)(603mg、3.8mmol)、L-アスコルビン酸ナトリウム(2.0g、10.1mmol)を順次添加し、室温で一晩攪拌した。得られた反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:酢酸エチル/ヘキサン=1:4)により精製して、黄色固体の標記化合物(収量10.1g、収率96%)を得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル(CDCl_3) : 8.39(2H, s), 8.31(1H, s), 7.86(1H, s), 7.57-7.49(3H, m), 7.40(1H, td, $J_1 = 7.6\text{ Hz}$, $J_2 = 1.7\text{ Hz}$), 2.84(2H, q, $J = 7.5\text{ Hz}$), 1.25(3H, t, $J = 7.3\text{ Hz}$) .

【0196】

(6) 4-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(2-エチルスルフィニルフェニル)トリアゾール(1-354)の合成

4-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(2-エチルスルファニルフェニル)トリアゾール(350.0mg、0.84mmol)のクロロホルム(3mL)溶液に、氷冷下で77%メタクロロ過安息香酸(188.0mg、0.84mmol)を添加し、氷冷下で2時間攪拌した。反応溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注ぎ、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤:酢酸エチル/ヘキサン=1:1)により精製して、白色固体の標記化合物(収量350.2mg、収率96%)を得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル(CDCl_3) : 8.38(2H, br), 8.34(1H, s), 8.27(1H, dd, $J_1 = 8.0\text{ Hz}$, $J_2 = 1.6\text{ Hz}$), 7.91(1H, br), 7.80(1H, td, $J_1 = 7.7\text{ Hz}$, $J_2 = 1.2\text{ Hz}$), 7.71(1H, td, $J_1 = 7.7\text{ Hz}$, $J_2 = 1.5\text{ Hz}$), 7.56(1H, dd, $J_1 = 7.8\text{ Hz}$, $J_2 = 0.9\text{ Hz}$), 3.36-3.28(1H, m), 2.97-2.88(1H, m), 1.37(3H, t, $J = 7.3\text{ Hz}$) .

【0197】

10

20

30

40

50

(7) 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (2 - エチルスルホニルフェニル)トリアゾール(1 - 6 3 1)の合成

4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (2 - エチルスルファニルフェニル)トリアゾール(3 5 0 . 0 m g , 0 . 8 4 m m o l)のクロロホルム(3 m L)溶液に、氷冷下で77%メタクロロ過安息香酸(3 8 5 . 3 m g , 1 . 7 m m o l)を添加し、氷冷下で2時間攪拌した。反応溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注ぎ、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤 : 酢酸エチル / ヘキサン = 1 : 1)により精製して、白色固体の標記化合物(収量 3 6 3 . 1 m g , 収率 9 6 %)で得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル(CDCl_3) : 8 . 3 7 (2 H , s) , 8 . 3 4 (1 H , s) , 8 . 2 9 (1 H , d d , J 1 = 7 . 6 \text{ Hz} , J 2 = 1 . 6 \text{ Hz}) , 7 . 8 8 - 7 . 8 3 (3 H , m) , 7 . 5 8 (1 H , d d , J 1 = 7 . 3 \text{ Hz} , J 2 = 1 . 8 \text{ Hz}) , 3 . 2 1 (2 H , q , J = 7 . 5 \text{ Hz}) , 1 . 2 6 (3 H , t , J = 7 . 3 \text{ Hz}) .

【 0 1 9 8 】

< 合成例 2 >

(1) トリメチル - [2 - [4 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] エチニル] シランの合成

窒素雰囲気下、2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル) ピリジン(6 5 . 0 g , 3 5 8 . 0 m m o l)のトリエチルアミン(3 2 0 m L)溶液に塩化パラジウム(II)(3 . 1 7 g , 1 7 . 9 m m o l)、トリフェニルホスフィン(9 . 4 g , 3 5 . 8 m m o l)、よう化銅(I)(5 . 5 g , 2 8 . 6 m m o l)、を順次加え、氷冷下でトリメチルシリルアセチレン(4 2 . 2 g , 4 2 9 . 7 m m o l)を滴下した。滴下終了後、80で8時間攪拌し、セライトろ過した。ろ液を減圧濃縮後、アンモニア水(3 0 m L)と水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤 : 酢酸エチル / ヘキサン = 1 : 2 0)により精製して、橙色油状の標記化合物(8 2 . 2 g , 収率 9 4 . 4 %)で得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル(CDCl_3) : 8 . 7 5 (1 H , d , J = 5 . 0 \text{ Hz}) , 7 . 6 7 (1 H , s) , 7 . 4 4 (1 H , d d , J 1 = 5 . 0 \text{ Hz} , J 2 = 0 . 9 \text{ Hz}) , 0 . 2 9 (9 H , s) .

【 0 1 9 9 】

(2) 2 - エチニル - 4 - (トリフルオロメチル) ピリジンの合成

トリメチル - [2 - [4 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] エチニル] シラン(8 2 . 2 g , 3 3 7 . 9 m m o l)のメタノール(2 0 0 m L)及びクロロホルム(2 0 0 m L)溶液に、炭酸カリウム(2 . 3 g , 1 6 . 9 m m o l)を添加し、室温で1時間攪拌した。溶媒を減圧留去後、溶液に水を加え、ジエチルエーテルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶剤 : 酢酸エチル / ヘキサン = 1 : 1 0)により精製し、無色油状の標記化合物(4 5 . 8 g , 収率 7 9 %)を得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル(CDCl_3) : 8 . 7 9 (1 H , d , J = 5 . 0 \text{ Hz}) , 7 . 7 0 (1 H , s) , 7 . 4 9 (1 H , d d , J 1 = 5 . 0 \text{ Hz} , J 2 = 0 . 9 \text{ Hz}) , 3 . 2 7 (1 H , s) .

【 0 2 0 0 】

(3) 2 - クロロ - 4 - (ペンタフルオロ - ⁶ - スルファニル) アニリンの合成

4 - アミノフェニルサルファーペンタトリフルオロリド(6 . 0 0 g , 2 7 . 4 m m o l)のアセトニトリル溶液(2 4 m L)を60 に加熱し、N - クロロスクシンイミド(4 . 0 2 g , 3 0 . 1 m m o l)を加え、加熱還流下で3時間攪拌した。室温まで放冷後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣に5%水酸化ナトリウム水溶液30mLを加え、酢

10

20

30

40

50

酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：酢酸エチル/ヘキサン = 1 : 7）により精製して、赤褐色油状物の標記化合物（収量 6.40 g、収率 92%）で得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル (CDCl_3) : 7.66 (1H, d, $J = 2.7\text{ Hz}$), 7.45 (1H, dd, $J_1 = 8.9\text{ Hz}$, $J_2 = 2.5\text{ Hz}$), 6.72 (1H, d, $J = 9.2\text{ Hz}$), 4.42 (2H, br).

【0201】

(4) (4-アジド-3-クロロ-フェニル)-ペンタフルオロ- 6 -スルファンの合成

2-クロロ-4-(ペンタフルオロ- 6 -スルファニル)アニリン (6.40 g、25.2 mmol) の 35% 塩酸 (30 mL) 及び水 (30 mL) の混合溶液を -5 に冷却し、亜硝酸ナトリウム (2.09 g、30.3 mmol) 水溶液 (15 mL) を滴下した。滴下終了後、-5 で 30 分攪拌し、ついでアジ化ナトリウム (2.13 g、32.8 mmol) 水溶液 (15 mL) を滴下した。-5 で 60 分、室温で 4 時間攪拌した。反応溶液に酢酸エチルを加えて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：酢酸エチル/ヘキサン = 1 : 20）により精製して、橙色油状の標記化合物 (4.50 g、収率 64%) で得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル (CDCl_3) : 7.80 (1H, d, $J = 2.3\text{ Hz}$), 7.68 (1H, dd, $J_1 = 8.9\text{ Hz}$, $J_2 = 2.5\text{ Hz}$), 7.23 (1H, d, $J = 8.7\text{ Hz}$).

【0202】

(5) [3-クロロ-4-[4-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]トリアゾール-1-イル]フェニル]-ペンタフルオロ- 6 -スルファンの合成

(4-アジド-3-クロロ-フェニル)-ペンタフルオロ- 6 -スルファン (490.2 mg、1.8 mmol) の N, N'-ジメチルホルムアミド (4 mL) 及び水 (1 mL) の混合溶液に、2-エチニル-4-(トリフルオロメチル)ピリジン (300.0 mg、1.8 mmol)、無水硫酸銅 (II) (42.0 mg、0.3 mmol)、L-アスコルビン酸ナトリウム (138.9 g、0.70 mmol) を順次添加し、室温で一晩攪拌した。得られた反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：酢酸エチル/ヘキサン = 1 : 6）により精製して、黄色固体の標記化合物 (収量 690.1 mg、収率 87%) で得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル (CDCl_3) : 8.81 (1H, d, $J = 5.0\text{ Hz}$), 8.74 (1H, s), 8.51 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.91 (2H, s), 7.51 (1H, d, $J = 5.0\text{ Hz}$).

【0203】

(6) [3-エチニルスルファニル-4-[4-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]トリアゾール-1-イル]フェニル]-ペンタフルオロ- 6 -スルファン (2-118) の合成

60% 水素化ナトリウム (71.4 mg, 1.8 mmol) の N, N'-ジメチルホルムアミド溶液 (5 mL) を氷冷し、次いでエタンチオール (110.8 mg, 1.8 mmol) を滴下し、10 分攪拌した。氷冷下で [3-クロロ-4-[4-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]トリアゾール-1-イル]フェニル]-ペンタフルオロ- 6 -スルファン (618.5 mg, 1.4 mmol) を添加し、室温で 2 時間攪拌した。反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶剤：酢酸エチル/ヘキサン = 1 : 6）により精製し、赤色

10

20

30

40

50

個体の標記化合物 (419.1 mg、収率 64%) を得た。

¹H NMR スペクトル (CDCl₃) : 8.81 (1H, d, J = 5.0 Hz), 8.63 (1H, s), 8.51 (1H, s), 7.87 (1H, d, J = 2.3 Hz), 7.76 (1H, dd, J₁ = 8.7 Hz, J₂ = 2.3 Hz), 7.67 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.49 (1H, d, J = 4.1 Hz), 2.93 (2H, q, J = 7.3 Hz), 1.29 (3H, t, J = 7.3 Hz).

【 0204 】

(7) [3 - エチルスルホニル - 4 - [4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] トリアゾール - 1 - イル] フェニル] - ペンタフルオロ - ⁶ - スルファン (2 - 398) の合成

[3 - エチルスルファニル - 4 - [4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] トリアゾール - 1 - イル] フェニル] - ペンタフルオロ - ⁶ - スルファン (974.0 mg、2.0 mmol) のクロロホルム (3 mL) 溶液に、氷冷下で 77% メタクロロ過安息香酸 (939.3 mg、4.2 mmol) を添加し、氷冷下で一晩攪拌した。反応溶液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注ぎ、クロロホルムで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤：酢酸エチル / ヘキサン = 1 : 1) により精製して、白色固体の標記化合物 (収量 490.0 mg、収率 47%) で得た。

¹H NMR スペクトル (CDCl₃) : 8.81 (1H, d, J = 5.0 Hz), 8.66 (1H, d, J = 2.7 Hz), 8.60 (1H, s), 8.48 (1H, s), 8.24 (1H, dd, J₁ = 8.7 Hz, J₂ = 2.7 Hz), 7.72 (1H, d, J = 8.7 Hz), 7.51 (1H, d, J = 6.0 Hz), 3.39 (2H, q, J = 7.5 Hz), 1.33 (3H, t, J = 7.3 Hz).

【 0205 】

< 合成例 3 >

(1) 2 - (1H - トリアゾール - 4 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ピリジンの合成

窒素雰囲気下、2 - エチニル - 4 - (トリフルオロメチル) ピリジン (4.0 g、23.4 mmol) の N, N' - ジメチルホルムアミド (9 mL) 及びメタノール (1 mL) の混合溶液に、よう化銅 (I) (223.0 mg、1.2 mmol)、アジドトリメチルシラン (4.0 g、35.1 mmol) を順次添加し、100 で 7 時間攪拌した。室温まで放冷後、セライト濾過し、ろ液を減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤：酢酸エチル / ヘキサン = 2 : 1) により精製して、茶色固体の標記化合物 (収量 2.0 g、収率 40%) で得た。

¹H NMR スペクトル (CDCl₃) : 8.83 (1H, d, J = 5.0 Hz), 8.36 (1H, s), 8.27 (1H, br), 7.50 (1H, d, J = 4.6 Hz).

【 0206 】

(2) 3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - [4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] トリアゾール - 1 - イル] ピリジン (2 - 387) の合成

2 - (1H - トリアゾール - 4 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ピリジン (200.0 mg、0.9 mmol) の N, N' - ジメチルホルムアミド (3 mL) 溶液に、炭酸カリウム (193.6 mg、1.4 mmol)、2, 3 - ビス (エチルスルホニル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン (464.1 mg、1.4 mmol、国際公開第 2016 / 020286 号を参考に合成した) を順次添加し、室温で一晩攪拌した。反応溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤：酢酸エチル / ヘキサン = 1 : 6) により精製し、白色個体の標

10

20

30

40

50

記化合物 (105.0 mg、収率 25%) を得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル (CDCl_3) : 9.14 (1H, m), 8.90 - 8.87 (2H, m), 8.62 (1H, s), 8.32 (1H, s), 7.57 (1H, dd, $J_1 = 5.0 \text{ Hz}$, $J_2 = 0.9 \text{ Hz}$), 3.99 (2H, q, $J = 7.5 \text{ Hz}$), 1.50 (3H, t, $J = 7.6 \text{ Hz}$) .

【 0207 】

< 合成例 4 >

1 - (2 - エチルスルファニルフェニル) - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] トリアゾール (1 - 26) の合成

3' - (トリフルオロメチル) アセトフェノン (400 mg, 2.1 mmol) のジメチルスルホキシド (4 mL) 溶液に、2 - エチルスルファニルアニリン (390.9 mg、2.6 mmol)、4 - メチルベンゼンスルホンヒドラジド (593.9 mg、3.2 mmol)、ヨウ素 (809.4 mg、3.2 mmol) を順次添加し、100 で 6 時間撹拌した。反応溶液に水を注ぎ、酢酸エチルで抽出し、有機層を 10% チオ硫酸ナトリウム水溶液ついで飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤 : 酢酸エチル / ヘキサン = 1 : 6) により精製して、褐色油状物の標記化合物 (収量 315.5 mg、収率 42%) を得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル (CDCl_3) : 8.24 (1H, s), 8.18 (1H, s), 8.14 (1H, d, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 7.64 - 7.59 (2H, m), 7.55 - 7.47 (3H, m), 7.39 (1H, td, $J_1 = 7.4 \text{ Hz}$, $J_2 = 1.5 \text{ Hz}$), 2.83 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.24 (3H, t, $J = 7.3 \text{ Hz}$) .

【 0208 】

< 合成例 5 >

1 - (2 - エチルスルファニルフェニル) - 5 - メチル - 4 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] トリアゾール (1 - 27) の合成

4 - メチルベンゼンスルホンヒドラジド (460.6 mg, 2.5 mmol) のメタノール (3 mL) 溶液に、3' - (トリフルオロメチル) プロピオフェノン (500 mg, 2.5 mmol) を順次滴下し、室温で 10 分間撹拌した。溶媒を減圧留去し、得られた白色個体にトルエン (5 mL)、酢酸銅 (II) (449.2 mg、2.5 mmol)、ピバル酸 (505.2 mg、4.9 mmol)、2 - エチルスルファニルアニリン (758.0 mg、4.9 mmol) を順次添加し、110 で 8 時間撹拌した。溶媒を減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶剤 : 酢酸エチル / ヘキサン = 1 : 6) により精製して、赤褐色油状物の標記化合物 (収量 383.5 mg、収率 43%) を得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル (CDCl_3) : 8.11 (1H, s), 8.05 (1H, dt, $J_1 = 4.5 \text{ Hz}$, $J_2 = 2.4 \text{ Hz}$), 7.65 - 7.61 (2H, m), 7.54 - 7.51 (2H, m), 7.41 - 7.35 (1H, m), 2.85 (2H, q, $J = 7.3 \text{ Hz}$), 1.25 (3H, t, $J = 7.6 \text{ Hz}$) .

【 0209 】

< 合成例 6 >

5 - [3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] - 3 - (2 - エチルスルファニルフェニル) トリアゾール - 4 - アミン (1 - 82) の合成

3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニルアセトニトリル (3.59 g、14.2 mmol)、2 - エチルスルファニルアニリン (2.54 g、14.2 mmol) のエタノール (10 mL) 溶液を氷冷し、ナトリウムメトキシド (1.2 g、21.3 mmol) のエタノール (10 mL) 溶液を順次滴下後、氷冷下で 72 時間撹拌した。反応溶液に水を注ぎ、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過して白色沈殿物を除去し、減圧濃縮後、得られた粗生成物をシリカゲルカラムク

10

20

30

40

50

ロマトグラフィー（溶出溶剤：酢酸エチル／ヘキサン＝1：6）により精製して、赤褐色油状物の標記化合物（収量5.3g、収率87%）で得た。

$^1\text{H NMR}$ スペクトル（ CDCl_3 ）：8.29（2H, s）, 7.79（1H, s）, 7.58 - 7.52（2H, m）, 7.44 - 7.39（2H, m）, 4.00（2H, br）, 2.87（2H, q, $J = 7.3\text{ Hz}$ ）, 1.27（3H, t, $J = 7.3\text{ Hz}$ ）。

【0210】

上記合成例および前記製造方法に基づき合成した本発明にかかる化合物の $^1\text{H NMR}$ スペクトル（ CDCl_3 ）（ppm）値を、表5に示す。 $^1\text{H NMR}$ データは、JNM-ECS400スペクトロメーター（日本電子株式会社製）により測定した。

【0211】

【表5 - 1】

化合物番号	$^1\text{H-NMR}$ スペクトル(CDCl_3) σ ppm:
1-16	8.18(1H,s),7.95-7.93(2H,m),7.54(2H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.50-7.45(3H,m),7.40-7.35(2H,m),2.81(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-21	8.18(1H,s),7.93(1H,t,J=1.8Hz),7.82(1H,dt,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),7.55-7.52(2H,m),7.48(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.42-7.32(3H,m),2.81(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-22	8.16(1H,s),7.87(2H,d,J=7.3Hz),7.54-7.36(6H,m),2.82(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-23	8.18(1H,s),8.08(1H,t,J=1.8Hz),7.87(1H,dt,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.55-7.51(2H,m),7.50-7.46(2H,m),7.38(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.35(2H,m),2.81(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-24	8.20(1H,s),7.86(1H,dt,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.81(1H,s),7.53(2H,td,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),7.49(2H,t,J=8.2Hz),7.38(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.22(1H,dt,J1=8.2Hz,J2=1.1Hz),2.82(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-25	8.23(1H,s),8.12(1H,d,J=7.3Hz),7.80(1H,d,J=7.8Hz),7.69(1H,t,J=7.6Hz),7.57-7.47(4H,m),7.39(1H,d,J=7.6Hz),2.79(2H,q,J=7.2Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-26	8.24(1H,s),8.18(1H,s),8.14(1H,d,J=7.3Hz),7.64-7.59(2H,m),7.55-7.47(3H,m),7.39(1H,td,J1=7.4Hz,J2=1.5Hz),2.83(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-27	8.11(1H,s),8.05(1H,dt,J1=4.5Hz,J2=2.4Hz),7.65-7.61(2H,m),7.54-7.51(2H,m),7.41-7.35(1H,m),2.85(2H,q,J=7.3Hz),1.25(3H,t,J=7.6Hz).
1-28	8.11(1H,s),8.02(1H,dt,J1=7.3Hz,J2=1.6Hz),7.63-7.60(2H,m),7.54-7.50(2H,m),7.38-7.37(2H,m),2.87(2H,q,J=7.3Hz),2.78(2H,q,J=7.8Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz),1.08(3H,t,J=7.8Hz).
1-29	8.39(1H,s),8.30(1H,d,J=7.3Hz),7.68-7.61(2H,m),7.58-7.57(2H,m),7.42-7.39(2H,m),2.89(2H,q,J=7.3Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-31	8.41(1H,s),8.31(1H,d,J=7.8Hz),7.69-7.61(2H,m),7.57(2H,d,J=3.7Hz),7.43-7.39(1H,m),7.35(1H,d,J=8.2Hz),2.90(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-38	8.24(1H,s),8.17-8.13(2H,m),7.78(1H,d,J=1.8Hz),7.75-7.72(1H,m),7.65-7.56(3H,m),2.96(2H,q,J=7.5Hz),1.33(3H,t,J=7.3Hz).
1-40	8.25(1H,s),8.05(2H,d,J=8.2Hz),7.72(2H,d,J=8.2Hz),7.56-7.48(3H,m),7.39(1H,t,J=7.6Hz),2.82(2H,q,J=7.2Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-53	8.16(1H,s),7.87(1H,d,J=8.2Hz),7.55-7.45(5H,m),7.37(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),2.78(2H,q,J=7.3Hz),1.22(3H,t,J=7.3Hz).
1-54	8.22(1H,s),8.01(2H,dt,J1=8.4Hz,J2=1.9Hz),7.71(2H,dt,J1=8.5Hz,J2=1.9Hz),7.67-7.65(2H,m),7.50-7.45(3H,m),7.41-7.35(2H,m),2.81(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-55	8.13(1H,s),7.90(2H,dt,J1=9.5Hz,J2=2.5Hz),7.53(2H,d,J=2.5Hz),7.47(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.40-7.34(3H,m),7.16-7.05(5H,m),2.81(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.6Hz).
1-56	8.27(1H,s),8.05(2H,dt,J1=8.4Hz,J2=1.6Hz),7.76(2H,dt,J1=8.4Hz,J2=1.8Hz),7.56-7.48(3H,m),7.39(1H,td,J1=7.3Hz,J2=1.7Hz),2.83(2H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.6Hz).
1-57	8.69(1H,s),8.55(1H,d,J=8.2Hz),7.76(1H,s),7.67(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.56(2H,d,J=7.8Hz),7.50(1H,td,J1=7.3Hz,J2=1.2Hz),7.40(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.1Hz),2.83(2H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.8Hz).

10

20

30

40

【表5 - 2】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-75	8.39(2H,s),8.31(1H,s),7.86(1H,s),7.57-7.49(3H,m),7.40(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),2.84(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-81	8.64(2H,s),7.93(1H,s),7.59-7.56(2H,m),7.44-7.40(1H,m),7.36-7.34(1H,m),2.91(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-82	8.29(2H,s),7.79(1H,s),7.58-7.52(2H,m),7.44-7.39(2H,m),4.00(2H,br),2.87(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-83	8.52(1H,s),7.96(1H,s),7.56-7.54(2H,m),7.44-7.42(2H,m),4.19(2H,q,J=7.2Hz),2.80(2H,q,J=7.3Hz),1.21(3H,t,J=7.3Hz),1.05(3H,t,J=7.1Hz).
1-84	8.63(2H,s),8.01(1H,s),7.64-7.63(2H,m),7.49-7.46(2H,m),2.93(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
1-85	8.38(2H,s),8.34(1H,s),7.87(1H,s),7.70(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),7.53(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.50-7.46(1H,m),2.67(2H,q,J=7.3Hz),1.05(3H,t,J=7.3Hz).
1-86	8.37(2H,s),8.28(1H,s),7.87(1H,s),7.47-7.45(2H,m),7.35(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.3Hz),2.89(2H,q,J=7.3Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
1-87	8.38(2H,s),8.33(1H,s),7.88(1H,s),7.58(1H,t,J=1.1Hz),7.49(2H,d,J=1.4Hz),2.82(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-88	8.41(2H,s),8.09(1H,s),7.87(1H,s),7.49-7.42(2H,m),7.39(1H,td,J1=8.5Hz,J2=3.1Hz),2.90(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
1-90	8.38(2H,s),8.36(1H,s),7.88(1H,s),7.75(1H,s),7.68(1H,d,J=8.2Hz),7.64(1H,dd,J1=8.2Hz,J=1.8Hz),2.94(2H,q,J=7.5Hz),1.30(3H,t,J=7.6Hz).
1-91	8.38(1H,br),8.32(1H,s),7.88(1H,br),7.77(1H,s),7.75(1H,d,J=8.7Hz),7.58(1H,d,J=8.2Hz),2.98(2H,q,J=7.5Hz),1.33(3H,t,J=7.6Hz).
1-197	8.27(1H,s),8.24(1H,s),8.11(1H,s),7.74(1H,s),7.55-7.46(3H,m),7.40-7.35(1H,m),2.82(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-210	8.70(1H,s),8.47(1H,s),8.32(1H,s),8.28(1H,s),7.56-7.48(3H,m),7.39(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.5Hz),4.00(3H,s),2.84(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-227	8.63(1H,s),8.33(2H,s),8.15(1H,s),8.00(1H,br),7.70(2H,d,J=7.8Hz),7.57-7.49(3H,m),7.44-7.38(3H,m),7.23-7.19(1H,m),2.85(2H,q,J=7.3Hz),1.25(3H,t,J=7.6Hz).
1-228	8.62(1H,s),8.32(1H,s),8.29(1H,s),8.14(1H,s),8.12(1H,br),7.69-7.65(2H,m),7.57-7.50(3H,m),7.42-7.36(3H,m),2.86(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-229	8.40(1H,s),8.38(2H,s),7.88(1H,s),7.61(1H,dd,J=8.7,5.5Hz),7.38(1H,dd,J=8.2,2.7Hz),2.74(2H,q,J=7.3Hz),1.18(3H,t,J=7.3Hz).
1-230	8.38(2H,s),8.32(1H,s),7.86(1H,s),7.48(1H,d,J=8.2Hz),7.38(1H,d,J=1.8Hz),7.32(1H,dd,J=8.5,1.6Hz),2.75(2H,q,J=7.3Hz),1.19(1H,t,J=7.3Hz).
1-231	8.40(1H,s),8.38(2H,s),7.87(1H,s),7.59(1H,d,J=8.7Hz),7.15(1H,d,J=2.7Hz),7.06(1H,dd,J=8.7,2.7Hz),3.88(3H,s),2.63(2H,q,J=7.3Hz),1.12(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【0213】

【表 5 - 3】

化合物 番号	$^1\text{H-NMR}$ スペクトル(CDCl_3) σ ppm:
1-232	8.42(2H,s),8.31(1H,s),8.05(1H,s),7.84(1H,s),7.08(1H,d,J=0.9Hz),3.23(2H,q,J=7.3Hz),1.49(3H,t,J=7.6Hz).
1-233	8.25(1H,s),8.07(1H,d,J=8.7Hz),7.71(1H,d,J=8.2Hz),7.54(1H,dt,J1=8.1Hz,J2=1.7Hz),7.49(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.5Hz),7.39(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),2.81(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-234	8.37(1H,s),8.34(1H,s),8.29(1H,s),7.88(1H,s),7.56-7.49(3H,m),7.39(1H,td,J1=7.4Hz,J2=1.5Hz),6.48(1H,br),5.68(1H,br),2.84(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-235	8.39(2H,s),7.87(1H,s),7.62-7.56(2H,m),7.49-7.42(2H,m),2.89(2H,d,J=7.3Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-236	8.33(1H,s),8.24(1H,s),8.08(1H,d,J=7.8Hz),7.75(1H,d,J=8.2Hz),7.59-7.48(4H,m),7.39(1H,t,J=7.6Hz),2.83(2H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-237	8.67(1H,s),8.41(1H,s),8.32(1H,s),8.19(1H,s),7.57-7.49(3H,m),7.40(1H,td,J1=7.4Hz,J2=1.7Hz),2.85(2H,q,J=7.3Hz),2.73(3H,s),1.25(3H,t,J=7.6Hz).
1-238	8.35(1H,s),8.33(1H,s),8.29(1H,s),7.86(1H,s),7.56-7.49(3H,m),7.39(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.5Hz),6.58(1H,br),2.96(3H,d,J=5.0Hz),2.84(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-239	8.18(1H,s),7.82(2H,d,J=1.8Hz),7.55-7.46(3H,m),7.40-7.33(2H,m),2.81(2H,q,J=7.3Hz),1.22(3H,t,J=7.3Hz).
1-240	8.43(2H,s),8.34(1H,s),7.89(1H,s),7.57-7.51(3H,m),7.42-7.39(1H,m),2.85(2H,q,J=7.3Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-241	8.49(2H,d,J=6.9Hz),8.37(1H,s),8.01(1H,s),7.83(2H,dd,J=5.0,3.2Hz),7.62(1H,tt,J1=7.3,J2=1.5Hz),7.53-7.44(5H,m),7.33(1H,td,J1=7.6,J2=1.7Hz),2.83(2H,q,J=7.5Hz),1.22(3H,t,J=7.3Hz).
1-242	8.41(1H,s),8.33-8.29(3H,m),7.93(1H,s),7.59(2H,d,J=7.8Hz),7.52-7.50(3H,m),7.39-7.33(3H,m),7.19(1H,td,J1=7.3Hz,J2=1.1Hz),2.83(2H,q,J=7.5Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-243	8.29(1H,s),8.27(1H,s),8.25(1H,s),7.75(1H,s),7.53-7.50(3H,m),7.38(1H,td,J1=7.4Hz,J2=1.5Hz),2.84(2H,q,J=7.5Hz),2.01(3H,t,J=18.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-244	8.66(1H,s),8.40(1H,s),8.28(1H,s),8.19(1H,s),7.88-7.85(1H,m),7.60-7.52(3H,m),5.92(1H,dq,J1=55.3Hz,J2=6.3Hz),2.73(3H,s),1.63(3H,dd,J1=20.1Hz,J2=6.4Hz).
1-245	8.36(1H,s),8.28(1H,s),8.12(1H,s),7.82(1H,s),7.69-7.66(2H,m),7.56-7.46(5H,m),7.44-7.36(2H,m),2.82(2H,q,J=7.5Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-246	8.21(1H,s),7.88(2H,s),7.55-7.47(3H,m),7.40-7.36(1H,m),7.31(1H,s),2.82(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-247	8.39(2H,s),8.35(1H,s),7.86(1H,s),7.73(1H,d,J=1.4Hz),7.64-7.56(4H,m),7.53-7.42(3H,m),2.88(2H,q,J=7.3Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
1-248	8.38(2H,s),8.35(1H,s),7.86(1H,s),7.68(1H,d,J=1.8Hz),7.60(1H,d,J=8.2Hz),7.56-7.52(3H,m),7.49-7.45(2H,m),2.86(2H,q,J=7.3Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
1-249	8.37(2H,s),8.24(1H,s),7.85(1H,s),7.44-7.39(3H,m),7.23-7.18(1H,m),7.11-7.08(3H,m),6.90(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.7Hz),2.79(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【表5 - 4】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:	
1-250	8.39(1H,s),8.38(2H,s),7.89(1H,s),7.75(1H,d,J=0.9Hz),7.70-7.65(2H,m),2.96(2H,q,J=7.3Hz),1.33(3H,t,J=7.6Hz).	
1-251	8.36(2H,s),8.27(1H,s),7.86(1H,s),7.61(1H,d,J=1.8Hz),7.49(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.38(1H,d,J=8.2Hz),2.88(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).	
1-252	1H-NMR (DMSO-D6) δ : 12.82(1H,br),9.41(1H,s),8.62(2H,s),8.22(1H,s),8.13(1H,s),8.07(1H,d,J=8.2Hz),7.85(1H,d,J=8.2Hz),3.09(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.1Hz).	10
1-254	8.40(2H,s),8.38(1H,s),8.32(1H,d,J=1.4Hz),8.13(1H,dd,J=8.2Hz,1.8Hz),7.88(1H,s),7.66(1H,d,J=8.2Hz),4.46(3H,s),2.99(2H,q,J=7.3Hz),1.32(3H,t,J=7.6Hz).	
1-255	8.36(2H,s),8.25(1H,s),7.84(1H,s),7.38(1H,d,J=8.2Hz),7.24(1H,s),7.02(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),2.79(2H,q,J=7.3Hz),2.01-1.93(1H,m),1.21(3H,t,J=7.3Hz),1.11-1.05(2H,m),0.80-0.75(2H,m).	
1-256	8.26(1H,s),8.12(2H,s),7.58(1H,s),7.55-7.46(3H,m),7.37(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),3.89(2H,s),2.82(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).	
1-257	8.40-8.39(1H,m),8.24(1H,d,J=1.4Hz),8.08(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.88(1H,s),7.68(1H,d,J=7.8Hz),2.97(1H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.6Hz).	20
1-258	8.38(1H,s),8.30(1H,s),7.86(1H,s),7.57(1H,d,J=1.4Hz),7.51(1H,d,J=8.2Hz),7.36(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),4.83(2H,d,J=5.5Hz),2.86(2H,q,J=7.3Hz),1.88(1H,t,J=6.0Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).	
1-259	8.25(1H,s),8.04(2H,s),7.55-7.46(4H,m),7.37(1H,td,J1=7.4Hz,J2=1.7Hz),2.82(2H,q,J=7.5Hz),1.84(2H,dd,J1=8.0Hz,J2=5.3Hz),1.56(2H,dd,J1=8.0Hz,J2=5.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).	
1-261	8.36(2H,s),8.22(1H,s),7.84(1H,s),7.37-7.32(3H,m),7.18-7.04(3H,m),6.95(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.3Hz),6.77-6.67(2H,m),5.99(1H,s),2.75(2H,q,J=7.3Hz),1.22(3H,t,J=7.3Hz).	
1-265	8.38-8.35(3H,m),8.20(1H,s),8.04-8.01(1H,m),7.88(1H,s),7.63(1H,d,J=8.2Hz),4.45(2H,q,J=7.2Hz),2.94(2H,q,J=7.3Hz),1.45(3H,t,J=7.1Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).	30
1-266	8.38(2H,s),8.37(1H,s),7.99(1H,d,J=1.8Hz),7.88(1H,s),7.65(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.60(1H,d,J=8.2Hz),6.24(1H,br),3.08(3H,d,J=5.0Hz),2.93(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).	
1-267	8.38(2H,s),8.31(1H,s),7.87(1H,s),7.56(1H,d,J=7.8Hz),7.50(1H,d,J=1.4Hz),7.34(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),3.88(2H,s),2.89(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).	
1-268	8.38(2H,s),8.31(1H,s),7.87(1H,s),7.55-7.51(2H,m),7.18(1H,d,J=8.2Hz),2.89(2H,q,J=7.3Hz),1.90-1.86(2H,m),1.54-1.52(2H,m),1.28(3H,t,J=7.6Hz).	
1-269	8.40(2H,s),8.19(1H,s),7.90(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.86(1H,s),7.66-7.59(2H,m),4.13(2H,q,J=7.0Hz),2.88(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz),1.10(3H,t,J=7.1Hz).	
1-270	8.38(2H,s),8.19(1H,s),7.86(1H,s),7.60-7.53(2H,m),7.49(1H,dd,J1=6.9Hz,J2=1.8Hz),5.89(1H,br),2.90(2H,q,J=7.3Hz),2.75(3H,d,J=4.6Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).	40
1-271	8.40(2H,s),8.03(1H,s),7.86(1H,s),7.18(2H,s),2.88(4H,q,J=7.3Hz),1.29(6H,t,J=7.3Hz).	

【 0 2 1 5 】

【表 5 - 5】

化合物 番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-273	8.40(1H,s),8.39(2H,s),8.12(1H,d,J=1.4Hz),7.92(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),7.88(1H,s),7.68(1H,d,J=8.3Hz),2.95(2H,q,J=7.3Hz),2.69(3H,s),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
1-274	8.41(1H,s),8.40(2H,s),7.95(1H,d,J=1.4Hz),7.89-7.85(3H,m),7.73(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.69-7.65(2H,m),7.55(2H,t,J=7.6Hz),2.93(2H,q,J=7.3Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
1-275	8.74(1H,dd,J1=6.9Hz,J2=2.3Hz),8.37(1H,d,J=3.7Hz),7.63-7.59(1H,m),7.56-7.47(3H,m),7.39(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.5Hz),7.30(1H,d,J=9.6Hz),2.83(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-277	8.37(2H,s),8.28(1H,s),7.87(1H,s),7.82(1H,d,J=1.8Hz),7.71(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.24(1H,d,J=8.7Hz),2.87(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-278	8.38(2H,s),8.29(1H,s),7.88(1H,s),7.56(1H,d,J=8.7Hz),7.32(1H,d,J=2.3Hz),7.24-7.21(1H,m),2.91(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
1-279	8.30(1H,t,J=1.4Hz),8.11(2H,d,J=8.2Hz),7.99(1H,s),7.69(2H,d,J=8.2Hz),7.06(1H,d,J=1.8Hz),3.23(2H,q,J=7.3Hz),1.48(3H,t,J=7.3Hz).
1-280	8.61(1H,s),8.23(1H,s),7.66-7.58(2H,m),7.54(1H,dd,J=8.0Hz,J2=1.1Hz),7.44(1H,td,J1=7.4Hz,J2=1.7Hz),2.90(2H,q,J=7.3Hz),1.12(3H,t,J=7.3Hz).
1-281	8.42(2H,s),8.27(1H,s),8.25-8.23(1H,m),8.19-8.17(2H,m),7.92(2H,br),7.43-7.39(1H,m),2.91(2H,q,J=7.3Hz),1.11(3H,t,J=7.3Hz).
1-282	8.54(2H,s),7.92(1H,s),7.86(1H,br),7.60-7.53(2H,m),7.50-7.48(1H,m),7.41(1H,td,J1=7.3Hz,J2=1.8Hz),7.31-7.24(4H,m),7.16-7.12(1H,m),2.93(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.6Hz).
1-283	8.54(2H,s),7.94(1H,s),7.79(1H,br),7.61-7.54(2H,m),7.51-7.42(2H,m),7.27-7.20(4H,m),2.93(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.6Hz).
1-284	8.46(2H,s),7.91(1H,s),7.59-7.51(2H,m),7.46-7.39(2H,m),6.13(1H,br),2.90(2H,q,J=7.3Hz),2.81(3H,d,J=5.0Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
1-285	8.32(2H,s),7.90(1H,s),7.53(2H,dd,J1=4.8Hz,J2=1.1Hz),7.49(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),7.41-7.36(1H,m),3.00(3H,s),2.91(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-286	8.34(1H,br),8.28(2H,s),7.91(1H,s),7.62-7.56(2H,m),7.54-7.45(2H,m),2.82(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-287	8.39(2H,s),8.03(1H,br),7.85(1H,s),7.69(2H,d,J=7.3Hz),7.60-7.41(7H,m),2.80(2H,q,J=7.3Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-288	8.37(2H,s),8.03(1H,s),7.86(1H,s),7.66(1H,br),7.59-7.52(5H,m),7.46-7.39(2H,m),2.82(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-289	8.37(2H,s),8.01(1H,br),7.85(1H,s),7.64(2H,d,J=8.2Hz),7.58-7.51(3H,m),7.46-7.42(3H,m),2.79(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
1-290	8.22(2H,s),7.92(1H,s),7.55-7.53(2H,m),7.34-7.30(1H,m),7.27-7.25(1H,m),3.00(2H,q,J=7.3Hz),2.31(6H,s),1.30(3H,t,J=7.3Hz).

10

20

30

40

【 0 2 1 6 】

【表5 - 6】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:	
1-291	9.29(1H,s),8.80(1H,s),8.52(1H,s),8.16(1H,s),7.69-7.59(3H,m),7.45(1H,td,J1=7.4Hz,J2=1.5Hz),2.96(2H,q,J=7.2Hz),1.17(3H,t,J=7.3Hz).	
1-292	8.45(2H,s),8.03(1H,br),7.88(1H,s),7.58-7.49(4H,m),7.45-7.33(4H,m),2.79(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).	
1-295	8.25(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.17(1H,s),7.93-7.91(2H,m),7.76(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.69(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.55(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.51-7.47(2H,m),7.43-7.39(1H,m),3.36-3.27(1H,m),2.94-2.85(1H,m),1.35(3H,t,J=7.3Hz).	10
1-300	8.25(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),8.18(1H,s),7.92(1H,t,J=1.8Hz),7.81-7.75(2H,m),7.69(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.54(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),7.42(1H,t,J=7.6Hz),7.38(1H,dt,J1=7.9Hz,J2=1.7Hz),3.34-3.25(1H,m),2.94-2.85(1H,m),1.35(3H,t,J=7.6Hz).	
1-301	8.25(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),8.16(1H,s),7.87-7.83(1H,m),7.77(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.69(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.54(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),7.48-7.45(1H,m),3.36-3.27(1H,m),2.95-2.86(1H,m),1.36(1H,t,J=7.3Hz).	
1-302	8.25(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.17(1H,s),8.08(1H,t,J=1.6Hz),7.84(1H,dt,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.77(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.69(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.55-7.52(2H,m),7.36(1H,t,J=7.8Hz),3.34-3.25(1H,m),2.94-2.85(1H,m),1.35(3H,t,J=7.6Hz).	20
1-303	8.26(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.20(1H,s),7.84(1H,d,J=7.8Hz),7.80-7.76(2H,m),7.69(1H,td,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.56-7.50(2H,m),3.36-3.27(1H,m),2.96-2.87(1H,m),1.36(3H,t,J=7.3Hz).	
1-304	8.25(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.17(1H,s),8.04(1H,d,J=7.8Hz),7.82(1H,d,J=8.2Hz),7.78(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.70(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.58-7.54(2H,m),3.27-3.18(1H,m),2.87-2.78(1H,m),1.33(3H,t,J=7.3Hz).	
1-305	8.27-8.25(2H,m),8.18(1H,s),8.11(1H,d,J=7.3Hz),7.78(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.1Hz),7.70(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.66-7.60(2H,m),7.56(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),3.37-3.28(1H,m),2.96-2.87(1H,m),1.37(3H,t,J=7.3Hz).	
1-306	8.22(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.10(1H,s),7.99(1H,d,J=7.3Hz),7.84(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.74(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.68-7.61(2H,m),7.42(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),3.21-3.12(1H,m),2.87(1H,m),2.47(3H,s),1.27(3H,t,J=7.3Hz).	30
1-308	8.36(1H,s),8.27-8.22(2H,m),7.87(1H,td,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.75(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.72-7.63(2H,m),7.51(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),3.20-3.11(1H,m),2.88-2.79(1H,m),1.29(3H,t,J=7.3Hz).	
1-310	8.36(1H,s),8.27(1H,d,J=7.8Hz),8.22(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.87(1H,td,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.77-7.71(2H,m),7.65(1H,t,H=7.8Hz),7.47(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.13-3.04(1H,m),2.83-2.75(1H,m),1.25(3H,t,J=7.3Hz).	
1-317	8.43(1H,d,J=8.2Hz),8.33(1H,s),8.19(1H,s),8.12(1H,d,J=7.8Hz),8.02(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=1.1Hz),7.83(1H,s),7.70-7.62(2H,m),3.44-3.35(1H,m),3.00-2.91(1H,m),1.40(3H,t,J=7.3Hz).	
1-319	8.26(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.25(1H,s),8.04(2H,d,J=8.2Hz),7.80-7.68(4H,m),7.56(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.36-3.27(1H,m),2.96-2.87(1H,m),1.36(3H,t,J=7.6Hz).	40
1-332	8.24(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.14(1H,s),7.84(2H,dt,J1=8.9Hz,J2=2.2Hz),7.75(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.68(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.55(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),7.51(2H,dt,J1=8.7Hz,J2=2.1Hz),3.34-3.25(1H,m),2.93-2.84(1H,m),1.37(9H,s),1.34(3H,t,J=7.3Hz).	

【0217】

【表5 - 7】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-333	8.26(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),8.21(1H,s),7.99(2H,dt,J1=8.7Hz,J2=1.8Hz),7.79-7.65(6H,m),7.57(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),7.50-7.46(2H,m),7.41-7.36(1H,m),3.36-3.28(1H,m),2.95-2.86(1H,m),1.36(3H,t,J=7.3Hz).
1-334	8.25(1H,d,J=7.8Hz),8.12(1H,s),7.87(2H,d,J=7.8Hz),7.76(1H,t,J=7.6Hz),7.68(1H,t,J=7.8Hz),7.55(1H,d,J=7.8Hz),7.38(2H,t,J=7.6Hz),7.18-7.07(5H,m),3.36-3.27(1H,m),2.95-2.86(1H,m),1.36(3H,t,J=7.1Hz).
1-335	8.26(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.26(1H,s),8.03(1H,dt,J1=8.7Hz,J2=1.8Hz),7.81-7.77(3H,m),7.70(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.54(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),3.35-3.26(1H,m),2.96-2.87(1H,m),1.36(3H,t,J=7.6Hz).
1-336	8.69(1H,s),8.50(1H,d,J=7.8Hz),8.26(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.81-7.77(2H,m),7.73-7.68(2H,m),7.59(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),3.33-3.24(1H,m),2.94-2.85(1H,m),1.36(3H,t,J=7.6Hz).
1-354	8.38(2H,s),8.34(1H,s),8.27(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.91(1H,s),7.80(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.71(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.56(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),3.36-3.28(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.37(3H,t,J=7.3Hz).
1-360	8.59(2H,s),8.23(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.96(1H,s),7.89(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.77(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.47(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),3.14-3.05(1H,m),2.85-2.76(1H,m),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
1-361	8.25(2H,s),8.22(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.87-7.83(2H,m),7.76(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.52(1H,td,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),4.20(2H,s),3.25-3.16(1H,m),2.95-2.86(1H,m),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
1-362	8.50(2H,s),8.16(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.99(1H,s),7.85(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.71(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.45(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),4.22(2H,q,J=7.2Hz),3.05-2.96(1H,m),2.78-2.69(1H,m),1.24(3H,t,J=7.6Hz),1.06(3H,t,J=7.1Hz).
1-363	8.62(2H,s),8.30(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.05(1H,s),7.93(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.1Hz),7.82(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.67(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),3.32-3.23(1H,m),3.00-2.91(1H,m),1.38(3H,t,J=7.3Hz).
1-364	8.36(2H,s),8.28(1H,s),7.87(1H,s),7.68(1H,d,J=8.2Hz),7.61(1H,t,J=8.0Hz),7.41(1H,d,J=7.8Hz),3.71-3.62(1H,m),3.29-3.20(1H,m),1.41(3H,t,J=7.6Hz).
1-365	8.37(2H,s),8.32(1H,s),8.23(1H,d,J=2.3Hz),7.91(1H,s),7.67(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.51(1H,d,J=8.7Hz),3.39-3.30(1H,m),2.98-2.89(1H,m),1.39(3H,t,J=7.6Hz).
1-366	8.36(2H,s),8.34(1H,s),8.21(1H,d,J=8.7Hz),7.89(1H,s),7.80(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.60(1H,d,J=2.3Hz),3.21(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).
1-367	8.39(2H,s),8.29(1H,s),8.10(1H,dd,J1=5.7Hz,J2=3.4Hz),7.91(1H,s),7.79(1H,d,J=2.3Hz),3.27-3.18(1H,m),2.94-2.85(1H,m),1.32(3H,t,J=7.6Hz).
1-369	8.58(1H,d,J=1.8Hz),8.41(1H,s),8.39(1H,s),7.97(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.93(1H,s),7.72(1H,d,J=8.2Hz),3.45-3.36(1H,m),3.01-2.92(1H,m),1.42(3H,t,J=7.6Hz).
1-370	8.45-8.43(2H,m),8.39(1H,s),8.04(1H,d,J=8.2Hz),7.93(1H,s),7.83(1H,s),3.44-3.35(1H,m),3.01-2.92(1H,m),1.41(3H,t,J=7.3Hz).
1-475	8.29(1H,s),8.26-8.21(2H,m),8.09(1H,s),7.78-7.73(2H,m),7.68(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.53(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.34-3.25(1H,m),2.94-2.84(1H,m),1.34(3H,t,J1=7.6Hz).
1-488	8.70(1H,s),8.45(1H,s),8.34(1H,s),8.32(1H,s),8.27(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.79(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.71(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.56(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),4.01(3H,s),3.37-3.28(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.37(3H,t,J=7.3Hz).

10

20

30

40

【 0 2 1 8 】

【表5 - 8】

化合物番号	$^1\text{H-NMR}$ スペクトル(CDCl_3) σ ppm:
1-505	8.62(1H,s),8.36(1H,s),8.35(1H,s),8.27(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.17(1H,s),7.98(1H,br),7.80(1H,t,J=7.6Hz),7.74-7.68(3H,m),7.57(1H,d,J=7.8Hz),7.43(1H,t,J=8.0Hz),3.38-3.29(1H,m),2.98-2.89(1H,m),1.38(3H,t,J=7.3Hz).
1-506	8.60(1H,s),8.34(1H,s),8.32(1H,s),8.24(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.16(1H,br),7.77(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.2Hz),7.72(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),7.70-7.65(2H,m),7.55(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.40-7.36(2H,m),3.37-3.28(1H,m),2.98-2.89(1H,m),1.37(3H,t,J=7.3Hz).
1-507	8.38(2H,s),8.35(1H,s),8.27(1H,dd,J1=8.9Hz,J2=5.7Hz),7.92(1H,s),7.50(1H,ddd,J1=9.3Hz,J2=7.0Hz,J3=1.9Hz),7.33(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),3.37-3.28(1H,m),2.98-2.89(1H,m),1.38(3H,t,J=7.3Hz).
1-508	8.38(2H,s),8.33(1H,s),8.12(1H,d,J=8.2Hz),7.90(1H,s),7.59(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),7.37(1H,d,J=0.9Hz),3.32-3.23(1H,m),2.95-2.86(1H,m),2.54(3H,s),1.35(3H,t,J=7.6Hz).
1-509	8.38(2H,s),8.33(1H,s),8.14(1H,d,J=9.2Hz),7.90(1H,s),7.28(2H,dd,J1=8.9Hz,J2=2.5Hz),7.05(1H,d,J=2.3Hz),3.95(3H,s),3.27-3.20(1H,m),2.95-2.86(1H,m),1.34(3H,t,J=7.3Hz).
1-510	8.61(1H,s),8.38(2H,s),8.19(1H,s),7.92(1H,d,J=1.8Hz),7.89(1H,s),3.62-3.53(1H,m),3.39-3.30(1H,m),1.31(3H,t,J=7.3Hz).
1-511	8.25(1H,s),8.24(1H,d,J=9.6Hz),8.04(2H,d,J=7.3Hz),7.78-7.69(4H,m),3.34-3.25(1H,m),2.94-2.86(1H,m),1.34(3H,t,J=7.3Hz).
1-512	8.38(2H,s),8.27(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.91(1H,s),7.86(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.1Hz),7.76(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.55(1H,d,J=7.8Hz),3.31-3.22(1H,m),2.98-2.89(1H,m),1.36(3H,t,J=7.6Hz).
1-513	8.32(1H,t,J=1.8Hz),8.26(1H,s),8.26(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.06(1H,d,J=7.8Hz),7.79-7.77(2H,m),7.70(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.60(1H,t,J=8.0Hz),7.56(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.32(1H,td,J1=7.6Hz,J2=5.8Hz),2.92(1H,td,J1=7.3Hz,J2=6.0Hz),1.36(3H,t,J=7.3Hz).
1-514	8.58(1H,s),8.33(2H,s),8.18(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),8.13(1H,s),7.70(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.2Hz),7.63(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.50(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),3.26-3.22(1H,m),2.90-2.80(1H,m),2.65(3H,s),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
1-515	8.35(2H,s),8.33(1H,s),8.26(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.89(1H,s),7.79(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.71(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.56(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),6.60(1H,br),3.36-3.28(1H,m),2.97(3H,d,J=5.0Hz),2.96-2.87(1H,m),1.37(3H,t,J=7.3Hz).
1-516	8.24-8.21(1H,m),8.20(1H,s),7.80-7.65(4H,m),7.56-7.51(1H,m),7.37(1H,t,J=1.8Hz),3.33-3.23(1H,m),2.94-2.83(1H,m),1.34(3H,t,J=7.3Hz).
1-517	8.42(2H,s),8.38(1H,s),8.27(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.93(1H,s),7.81(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.1Hz),7.72(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.57(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),3.37-3.28(1H,m),2.98-2.89(1H,m),1.38(3H,t,J=7.6Hz).
1-518	8.46(2H,s),8.36(1H,s),8.25(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.05(1H,s),7.86-7.83(2H,m),7.78(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.72-7.65(2H,m),7.56-7.54(3H,m),3.35-3.30(1H,m),2.95-2.90(1H,m),1.36(3H,t,J=7.3Hz).
1-519	8.41(1H,s),8.35(3H,s),8.25(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.96(1H,s),7.77(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.2Hz),7.70(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.60(2H,dd,J1=8.9Hz,J2=1.1Hz),7.55(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),7.37(2H,t,J=8.0Hz),7.21(1H,tt,J1=7.6Hz,J2=1.3Hz),3.32(1H,dq,J1=17.9Hz,J2=5.0Hz),2.92(1H,dq,J1=17.7Hz,J2=5.0Hz),1.36(3H,t,J=7.3Hz).
1-520	8.42(1H,s),8.25-8.23(3H,m),7.76-7.75(2H,m),7.69(1H,t,J=7.8Hz),7.58(1H,d,J=7.8Hz),3.35-3.30(1H,m),2.94-2.90(1H,m),2.01(3H,t,J=18.3Hz),1.36(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【0219】

【表 5 - 9】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-522	8.34(1H,s),8.30(1H,s),8.25(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.11(1H,s),7.85(1H,s),7.79-7.74(1H,m),7.71-7.65(3H,m),7.56(1H,dd,J1=7.8,J2=1.4Hz),7.52-7.40(3H,m),3.37-3.27(1H,m),2.96-2.86(1H,m),1.36(3H,t,J=7.3Hz).
1-523	8.27-8.23(2H,m),7.88(1H,s),7.84(1H,s),7.77(1H,t,J=7.6Hz),7.69(1H,t,J=7.6Hz),7.55(1H,d,J=7.8Hz),7.35(1H,s),3.37-3.28(1H,m),2.96-2.87(1H,m),2.07-2.01(1H,m),1.36(3H,t,J=7.6Hz),1.12-1.07(2H,m),0.86-0.82(2H,m).
1-524	8.43(1H,s),8.41(1H,d,J=1.8Hz),8.36(2H,s),7.88-7.82(2H,m),7.66-7.59(3H,m),7.48-7.38(3H,m),3.41-3.31(1H,m),3.00-2.91(1H,m),1.39(3H,t,J=7.3Hz).
1-525	8.41(1H,d,J=1.8Hz),8.37(3H,s),7.90(1H,s),7.85(1H,dd,J1=8.2Hz,1.8Hz),7.65-7.61(3H,m),7.48(2H,d,J=8.2Hz),3.37(1H,m),2.96(1H,m),1.40(3H,t,J=7.3Hz).
1-526	8.35(2H,s),8.31(1H,s),7.87(1H,s),7.78(1H,d,J=2.7Hz),7.48-7.38(3H,m),7.25-7.18(2H,m),7.09(2H,d,J=7.8Hz),3.29-3.22(1H,m),2.90-2.82(1H,m),1.31(3H,t,J=7.6Hz).
1-527	8.61(1H,s),8.43(1H,s),8.38(2H,s),7.99(1H,d,J=8.2Hz),7.94(1H,s),7.72(1H,d,J=8.2Hz),3.48-3.39(1H,m),3.03-2.94(1H,m),1.43(3H,t,J=7.6Hz).
1-528	8.37-8.35(3H,m),8.33(1H,s),7.90(1H,s),7.81(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.43(1H,d,J=8.7Hz),3.39-3.29(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.38(3H,t,J=7.6Hz).
1-529	¹ H-NMR (DMSO-D ₆) δ : 12.55(1H,br),9.76(1H,s),8.76(1H,d,J=1.8Hz),8.62(2H,s),8.49(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),8.17(1H,s),8.13(1H,d,J=8.7Hz),3.30-3.26(1H,m),2.85-2.81(1H,m),1.20(3H,t,J=7.3Hz).
1-531	9.01(1H,d,J=1.4Hz),8.50(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=0.9Hz),8.42(1H,s),8.40(2H,s),7.92(1H,s),7.70(1H,d,J=8.2Hz),4.47(3H,s),3.41(1H,td,J1=14.1Hz,J2=6.7Hz),3.02(1H,td,J1=13.7Hz,J2=7.2Hz),1.43(3H,t,J=7.3Hz).
1-532	8.35(2H,s),8.32(1H,s),7.86(2H,s),7.41-7.28(2H,m),3.30-3.20(1H,m),2.90-2.80(1H,m),2.09-2.01(1H,m),1.32(3H,t,J=7.6Hz),1.16-1.10(1H,m),0.88-0.79(1H,m).
1-536	8.31(1H,s),8.24(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.06(2H,s),7.79-7.74(1H,m),7.71-7.66(1H,m),7.56-7.53(2H,m),3.36-3.26(1H,m),2.96-2.86(1H,m),1.87-1.84(2H,m),1.58-1.54(2H,m),1.35(3H,t,J=7.3Hz).
1-537	8.97(1H,d,J=1.8Hz),8.42(1H,s),8.40-8.38(3H,m),7.92(1H,s),7.69(1H,d,J=8.2Hz),3.45-3.36(1H,m),3.06-2.97(1H,m),1.43(3H,t,J=7.3Hz).
1-538	8.35(2H,s),8.21(1H,s),7.87(1H,s),7.71(1H,d,J=2.3Hz),7.39-7.32(3H,m),7.26-7.18(3H,m),7.10(1H,t,J=7.6Hz),6.53(1H,s),3.29-3.21(1H,m),2.92-2.84(1H,m),1.34(3H,t,J=7.6Hz).
1-542	8.91(1H,d,J=1.4Hz),8.41(1H,s),8.39-8.36(3H,m),7.92(1H,s),7.66(1H,d,J=8.2Hz),4.48(2H,q,J=7.0Hz),3.45-3.36(1H,m),3.03-2.94(1H,m),1.48-1.42(6H,s).
1-543	¹ H-NMR (DMSO-D ₆) δ : 9.70(1H,s),8.86(1H,d,J=4.6Hz),8.61(2H,s),8.55(1H,d,J=1.8Hz),8.24(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),8.17(1H,s),7.99(1H,d,J=8.2Hz),3.27-3.18(1H,m),2.85(3H,d,J=4.6Hz),2.83-2.76(1H,m),1.18(3H,t,J=7.3Hz).
1-545	8.38(2H,s),8.34(1H,s),7.91-7.86(3H,m),7.58(1H,d,J=7.8Hz),3.39-3.30(1H,m),2.93-2.84(1H,m),1.95-1.91(2H,m),1.66-1.62(2H,m),1.37(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【 0 2 2 0 】

【表5 - 10】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-547	8.36(2H,s),8.34(1H,s),8.25(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.89-7.83(3H,m),5.83(1H,s),3.09(1H,td,J1=14.2Hz,J2=6.9Hz),2.80(3H,d,J=5.0Hz),2.79-2.72(1H,m),1.26(3H,t,J=7.6Hz).
1-550	8.81(1H,s),8.43(1H,s),8.39(2H,s),8.30(1H,d,J=8.2Hz),7.93(1H,s),7.70(1H,d,J=8.2Hz),3.47-3.39(1H,m),3.03-2.94(1H,m),2.77(3H,s),1.44(3H,t,J=7.6Hz).
1-551	8.64(1H,s),8.45(1H,s),8.40(2H,s),8.17(1H,d,J=8.2Hz),7.93(1H,s),7.85(2H,d,J=7.8Hz),7.73(1H,d,J=8.2Hz),7.68(1H,t,J=8.0Hz),7.56(2H,t,J=7.3Hz),3.46-3.38(1H,m),3.05-2.96(1H,m),1.42(3H,t,J=7.6Hz).
1-552	8.71(1H,dd,J1=6.9Hz,J2=2.3Hz),8.39(1H,d,J=3.2Hz),8.26(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.78(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.70(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.68-7.64(1H,m),7.57(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),7.33(1H,t,J=9.4Hz),3.36-3.28(1H,m),2.96-2.87(1H,m),1.37(3H,t,J=7.3Hz).
1-554	8.54(1H,d,J=1.8Hz),8.37(2H,s),8.32(1H,s),8.03(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.91(1H,s),7.28(1H,d,J=8.2Hz),3.40-3.31(1H,m),2.98-2.89(1H,m),1.40(3H,t,J=7.3Hz).
1-555	8.38(2H,s),8.34(1H,s),8.12(1H,d,J=2.3Hz),7.92(1H,s),7.63(1H,d,J=8.7Hz),7.54(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.7Hz),3.40-3.31(1H,m),2.98-2.90(1H,m),1.38(3H,t,J=7.3Hz).
1-556	8.60(1H,t,J=1.4Hz),8.12(1H,s),8.08(2H,d,J=7.8Hz),7.88(1H,d,J=1.8Hz),7.72(2H,d,J=8.2Hz),3.62-3.53(1H,m),3.40-3.41(1H,m),1.30(3H,t,J=7.6Hz).
1-559	9.83(1H,s),8.55(2H,s),7.90(1H,s),7.81(1H,dd,J1=5.7Hz,J2=3.4Hz),7.72(2H,dd,J1=5.7Hz,J2=3.4Hz),7.56(1H,dd,J1=6.0Hz,J2=3.2Hz),7.45-7.42(2H,m),7.30-7.26(2H,m),7.14-7.10(1H,m),3.42-3.26(2H,m),1.30(3H,t,J=7.6Hz).
1-560	10.31(1H,s),8.47(2H,s),7.91(1H,s),7.84-7.82(1H,m),7.72-7.68(2H,m),7.60-7.58(1H,m),7.41-7.38(2H,m),7.23-7.20(2H,m),3.28-3.18(1H,m),3.15-3.07(1H,m),1.17(3H,t,J=7.6Hz).
1-561	8.46(2H,s),7.96(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.91(1H,s),7.79(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.73(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.54(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.04(1H,br),3.30(2H,m),2.79(3H,d,J=5.0Hz),1.31(3H,t,J=7.6Hz).
1-562	8.35(2H,s),8.22(1H,d,J=8.7Hz),7.92(1H,s),7.82(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.1Hz),7.69(1H,td,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.61(1H,br),3.41(1H,dd,J1=14.2Hz,J2=7.8Hz),3.08(1H,dd,J1=13.5Hz,J2=7.6Hz),3.02(3H,s),2.67(3H,s),1.41(3H,t,J=7.3Hz).
1-563	8.31-8.28(3H,m),7.95-7.92(3H,m),7.62-7.60(1H,m),3.07-3.00(1H,m),2.93-2.87(1H,m),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-564	8.44(2H,s),7.86-7.83(4H,m),7.72-7.69(2H,m),7.64-7.61(2H,m),7.57-7.53(1H,m),7.44-7.40(2H,m),2.97-2.80(2H,m),1.13(3H,t,J=7.6Hz).
1-565	8.43(2H,s),7.89-7.84(3H,m),7.76(1H,d,J=7.3Hz),7.72-7.69(2H,m),7.62-7.60(1H,m),7.54-7.51(1H,m),7.36(1H,t,J=8.0Hz),2.93-2.81(2H,m),1.09(3H,t,J=7.3Hz).
1-566	9.96(1H,br),8.42(2H,s),7.86-7.84(2H,m),7.70(2H,d,J=8.7Hz),7.74-7.71(2H,m),7.64-7.62(1H,m),7.36(1H,d,J=8.7Hz),2.89-2.80(2H,m),1.11(3H,t,J=7.3Hz).
1-567	8.27(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.20(2H,s),7.96(1H,s),7.86(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.1Hz),7.69(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.35(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),3.51-3.42(1H,m),3.17-3.08(1H,m),2.61(3H,s),1.95(3H,s),1.43(3H,t,J=7.3Hz).

10

20

30

40

【0221】

【表5 - 11】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-569	9.21(1H,br),8.49(1H,s),7.91(1H,s),7.81(1H,s),7.75-7.73(2H,m),7.69-7.66(1H,m),7.45-7.38(2H,m),7.36-7.32(1H,m),2.88-2.81(1H,m),2.79-2.71(1H,m),1.06(3H,t,J=6.9Hz).
1-572	8.27(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.22(1H,s),7.93-7.90(2H,m),7.85(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.79(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.58(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.49-7.45(2H,m),7.41-7.36(1H,m),3.16(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-577	8.28(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.21(1H,s),7.93(1H,t,J=1.6Hz),7.85(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.82-7.77(2H,m),7.57(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.40(1H,t,J=7.6Hz),7.35(1H,dt,J1=8.4Hz,J2=1.6Hz),3.16(2H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.6Hz).
1-578	8.27(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),8.20(1H,s),7.88-7.78(4H,m),7.57(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),7.46-7.43(2H,m),3.17(2H,q,J=7.5Hz),1.24(1H,t,J=7.6Hz).
1-579	8.27(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.21(1H,s),8.09(1H,t,J=1.8Hz),7.87-7.78(3H,m),7.56(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.51(1H,dq,J1=7.9Hz,J2=1.0Hz),7.33(1H,t,J=7.8Hz),3.16(2H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-580	8.28(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.23(1H,s),7.88-7.79(4H,m),7.57(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),7.49(1H,t,J=8.2Hz),7.25-7.22(1H,m),3.18(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-581	8.28(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.22(1H,s),8.02(1H,d,J=7.8Hz),7.86(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.83-7.78(2H,m),7.68(1H,t,J=7.3Hz),7.60(1H,td,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.54(1H,t,J=7.6Hz),3.18(2H,q,J=7.5Hz),1.26(3H,t,J=7.6Hz).
1-582	8.29-8.27(2H,m),8.20(1H,s),8.10(1H,d,J=7.3Hz),7.89-7.80(2H,m),7.65-7.57(3H,m),3.19(2H,q,J=7.3Hz),1.25(3H,t,J=7.1Hz).
1-583	8.29(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),8.11(1H,s),8.00(1H,d,J=7.3Hz),7.89(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.8Hz),7.84(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.5Hz),7.66-7.59(2H,m),7.47(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),3.27(2H,q,J=7.5Hz),2.39(3H,s),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
1-584	8.29(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),8.12(1H,s),7.99(1H,d,J=7.3Hz),7.91-7.82(2H,m),7.66-7.59(2H,m),7.50(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),3.32(2H,br),2.83(2H,br),1.26(3H,t,J=7.3Hz),1.11(3H,t,J=7.6Hz).
1-585	8.37(1H,s),8.29-8.25(2H,m),7.94-7.85(2H,m),7.69-7.61(2H,m),7.54(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.37(2H,q,J=7.5Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
1-587	8.38(1H,s),8.28(2H,d,J=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.91(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.86(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.69(1H,d,J=7.8Hz),7.63(1H,t,J=7.8Hz),7.51(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),3.36(2H,br),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
1-594	8.43(1H,d,J=8.2Hz),8.31(1H,s),8.20(1H,s),8.10-8.06(2H,m),7.85(1H,d,J=1.4Hz),7.67-7.59(2H,m),3.24(2H,q,J=7.5Hz),1.28(3H,t,J=7.6Hz).
1-596	8.28(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.8Hz),8.28(1H,s),8.04(2H,d,J=8.2Hz),7.87(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.8Hz),7.82(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.73(2H,d,J=7.8Hz),7.58(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.17(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
1-609	8.27(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.20(1H,s),7.87-7.82(3H,m),7.79(1H,td,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.58(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.49(2H,dt,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),3.13(2H,q,J=7.5Hz),1.36(9H,s),1.26(3H,t,J=7.1Hz).
1-610	8.28(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.26(1H,s),8.00(2H,dt,J1=8.7Hz,J2=1.8Hz),7.86(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.80(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.71(2H,dt,J1=8.4Hz,J2=1.9Hz),7.67-7.65(2H,m),7.59(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.49-7.45(2H,m),7.40-7.36(1H,m),3.17(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).

10

20

30

40

【0222】

【表5 - 12】

化合物番号	$^1\text{H-NMR}$ スペクトル(CDCl_3) σ ppm:
1-611	8.27(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),8.17(1H,s),7.90-7.86(2H,m),7.85-7.83(1H,m),7.79(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.57(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.39-7.35(2H,m),7.16-7.06(5H,m),3.17(2H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-612	8.29-8.27(2H,m),8.03(2H,d,J=8.7Hz),7.87(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.83(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.76(2H,d,J=8.7Hz),7.57(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.8Hz),3.17(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.5Hz).
1-613	8.71(1H,s),8.51(1H,d,J=8.2Hz),8.28(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),7.88(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.82(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.77(1H,s),7.67(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.61(1H,d,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),3.23(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-631	8.37(2H,s),8.34(1H,s),8.29(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.88-7.83(3H,m),7.58(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.8Hz),3.21(2H,q,J=7.5Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
1-637	8.60(2H,s),8.29(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.95-7.86(3H,m),7.51(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),3.35(2H,dd,J1=20.4Hz,J2=7.1Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
1-638	8.30(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),8.25(2H,s),7.93(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.87(1H,td,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.82(1H,s),7.55(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),4.08(2H,br),3.20(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).
1-639	8.50(2H,s),8.23(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.97(1H,s),7.89-7.85(2H,m),7.57(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),4.19(2H,q,J=7.8Hz),3.10(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.8Hz),1.04(3H,t,J=7.3Hz).
1-640	8.61(2H,s),8.32-8.30(1H,m),8.02(1H,s),8.00-7.93(2H,m),7.66-7.64(1H,m),3.35(2H,q,J=7.5Hz),1.33(3H,t,J=7.6Hz).
1-641	8.37(2H,s),8.24(1H,s),7.87(1H,s),7.85(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.72(1H,t,J=8.0Hz),7.43(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),3.57(2H,q,J=7.5Hz),1.41(3H,t,J=7.6Hz).
1-642	8.36(2H,s),8.32(1H,s),8.26(1H,d,J=2.7Hz),7.89(1H,s),7.83(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.5Hz),7.52(1H,d,J=8.2Hz),3.21(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
1-643	8.38(2H,s),8.36(1H,s),8.21(1H,d,J=8.2Hz),7.91(1H,s),7.75(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.60(1H,d,J=1.8Hz),3.38-3.29(1H,m),2.98-2.89(1H,m),1.38(3H,t,J=7.3Hz).
1-644	8.39(2H,s),8.24(1H,s),8.19(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.94(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.89(1H,s),7.79(1H,t,J=8.0Hz),3.21(2H,q,J=7.5Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
1-646	8.55(1H,d,J=1.8Hz),8.37(3H,s),8.14(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),7.90(1H,s),7.74(1H,d,J=8.2Hz),3.27(2H,q,J=7.5Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
1-647	8.44(1H,d,J=8.2Hz),8.39(1H,s),8.38(2H,br),8.10(1H,d,J=8.2Hz),7.90(1H,s),7.85(1H,s),3.27(2H,q,J=7.3Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
1-752	8.27-8.24(3H,m),8.09(1H,s),7.88-7.78(2H,m),7.75(1H,s),7.55(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),3.18(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.6Hz).
1-765	8.70(1H,s),8.45(1H,s),8.34(1H,s),8.30(1H,s),8.28(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.88(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.8Hz),7.83(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.58(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),3.21(2H,q,J=7.5Hz),1.26(3H,t,J=7.6Hz).
1-782	8.54(1H,s),8.33(1H,s),8.31(1H,s),8.26(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),8.15(1H,s),8.09(1H,br),7.87(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.8Hz),7.82(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.70(2H,d,J=7.8Hz),7.57(1H,d,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),7.40(2H,t,J=7.8Hz),7.19(1H,t,J=7.1Hz),3.26(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【0223】

【表5 - 13】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-783	8.49(1H,s),8.32(1H,s),8.28(1H,s),8.25(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.17(1H,br),8.13(1H,s),7.87(1H,td,J1=7.4Hz,J2=1.7Hz),7.82(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.69-7.65(2H,m),7.56(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.38-7.35(2H,m),3.27(2H,q,J=7.5Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
1-784	8.37(2H,s),8.36(1H,s),8.31(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=5.5Hz),7.89(1H,s),7.53(1H,ddd,J1=9.4Hz,J2=6.9Hz,J3=2.1Hz),7.34(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=2.7Hz),3.20(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-785	8.37(2H,s),8.32(1H,s),8.14(1H,d,J=7.8Hz),7.87(1H,s),7.61(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.38(1H,d,J=1.4Hz),3.16(2H,q,J=7.5Hz),2.56(3H,s),1.24(3H,t,J=7.5Hz).
1-786	8.37(2H,s),8.34(1H,s),8.17(1H,d,J=8.7Hz),7.88(1H,s),7.25(1H,dd,J1=9.2Hz,J2=2.7Hz),7.04(1H,d,J=2.3Hz),3.97(3H,s),3.15(2H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
1-787	8.75(1H,s),8.42(1H,s),8.24(1H,s),8.19(1H,s),7.91(1H,s),3.92(2H,q,J=7.5Hz),1.38(3H,t,J=7.6Hz).
1-788	8.29(1H,s),8.28(1H,d,J=6.4Hz),8.06(2H,d,J=6.9Hz),7.87(1H,t,J=7.3Hz),7.82(1H,t,J=7.6Hz),7.72(2H,d,J=8.2Hz),7.58(1H,d,J=7.8Hz),3.15
1-790	8.37(2H,s),8.29(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.8Hz),7.96-7.90(2H,m),7.88(1H,s),7.61(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.8Hz),3.32(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
1-791	8.34(1H,t,J=1.8Hz),8.29(1H,s),8.23(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),7.99(1H,d,J=7.8Hz),7.86-7.72(3H,m),7.57-7.52(2H,m),3.24(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-792	8.63(1H,s),8.38(1H,s),8.36(1H,s),8.26(1H,dd,J1=7.8,J2=1.8Hz),8.19(1H,s),7.87(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.82(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.58(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),3.25(2H,q,J=7.5Hz),2.72(3H,s),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-793	8.33(2H,s),8.32(1H,s),8.28(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),7.90-7.85(2H,m),7.83(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.57(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),6.57(1H,br),3.22(2H,q,J=7.5Hz),2.96(3H,d,J=5.0Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).
1-794	8.24-8.21(1H,m),8.20(1H,s),7.86-7.76(4H,m),7.53(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.33(1H,t,J=2.1Hz),3.16(2H,q,J=7.3Hz),1.22(3H,t,J=7.3Hz)
1-795	8.42(2H,d,J=8.7Hz),8.36(1H,s),8.29(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.91-7.83(3H,m),7.58(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.8Hz),3.22(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-796	8.45(2H,d,J=6.4Hz),8.32(1H,s),8.26(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),8.03(1H,s),7.89-7.80(4H,m),7.65(1H,tt,J1=7.3Hz,J2=1.5Hz),7.58-7.52(3H,m),3.24(2H,q,J=7.5Hz),1.26(3H,t,J=7.6Hz).
1-797	8.37-8.25(5H,m),7.93(1H,s),7.86-7.81(2H,m),7.60(2H,d,J=7.8Hz),7.56(1H,d,J=7.8Hz),7.36(2H,q,J=7.6Hz),7.19(1H,q,J=6.9Hz),3.27-3.20(2H,m),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
1-798	8.32(1H,s),8.26(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.23(2H,s),7.86(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.81(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.5Hz),7.75(1H,s),7.57(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),3.24(2H,q,J=7.3Hz),2.00(3H,t,J=18.3Hz),1.26(3H,t,J=7.6Hz).
1-800	8.32(1H,s),8.31(1H,s),8.27(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),8.13(1H,s),7.88-7.78(3H,m),7.68-7.65(2H,m),7.58(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.51-7.47(2H,m),7.43-7.40(1H,m),3.20(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-801	8.29-8.23(2H,m),7.91-7.81(4H,m),7.58-7.54(1H,m),7.32-7.30(1H,m),3.19(2H,q,J=7.5Hz),2.05-1.98(1H,m),1.25(3H,t,J=7.3Hz),1.08-1.03(2H,m),0.84-0.79(2H,m).

10

20

30

40

【0224】

【表 5 - 1 4】

化合物 番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-802	8.45(1H,d,J=2.3Hz),8.37(3H,s),8.03(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.86(1H,s),7.70-7.67(2H,m),7.62(1H,d,J=8.2Hz),7.56-7.46(3H,m),3.25(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
1-803	8.38(1H,s),8.36(1H,d,J=2.3Hz),8.32(2H,s),7.98(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),7.83(1H,s),7.62-7.56(3H,m),7.47(2H,d,J=8.2Hz),3.29(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
1-804	8.35(2H,s),8.28(1H,s),7.86(1H,s),7.81(1H,d,J=2.7Hz),7.48-7.44(3H,m),7.34-7.24(2H,m),7.12(2H,d,J=7.8Hz),3.16(2H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.6Hz).
1-805	8.58(1H,s),8.38(1H,s),8.37(2H,s),8.15(1H,d,J=8.2Hz),7.91(1H,s),7.74(1H,d,J=8.2Hz),3.29(2H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.3Hz).
1-806	8.35(1H,d,J=1.8Hz),8.32(3H,br),7.96(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.84(1H,s),7.42(1H,d,J=8.2Hz),3.23(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).
1-808	8.63(1H,d,J=1.8Hz),8.43(1H,s),8.39-8.38(3H,m),7.91(1H,s),7.83(1H,d,J=8.2Hz),4.34(3H,s),3.33(2H,q,J=7.5Hz),1.32(3H,t,J=7.6Hz).
1-809	9.02(1H,d,J=1.8Hz),8.64(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),8.39(3H,s),7.89(1H,s),7.71(1H,d,J=8.2Hz),4.49(3H,s),3.28(2H,q,J=7.5Hz),1.32(3H,t,J=7.6Hz).
1-810	8.35(2H,s),8.27(1H,s),7.89(1H,d,J=1.8Hz),7.85(1H,s),7.48-7.39(2H,m),3.15(2H,q,J=7.5Hz),2.14-2.06(1H,m),1.24(3H,t,J=7.3Hz),1.23-1.17(2H,m),0.90-0.85(2H,m).
1-814	8.29(1H,s),8.13(1H,dd,J=7.8,1.4Hz),7.97(1H,s),7.90(1H,s),7.78(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.71(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.2Hz),7.51-7.48(2H,m),3.25(2H,q,J=7.3Hz),1.77(2H,dd,J1=7.8Hz,J2=5.5Hz),1.50(2H,dd,J1=7.8Hz,J2=5.5Hz),1.20(3H,t,J=7.3Hz).
1-815	8.96(1H,s),8.54(1H,d,J=8.2Hz),8.40(1H,s),8.38(2H,s),7.88(1H,s),7.69(1H,d,J=8.2Hz),3.30(2H,q,J=7.5Hz),2.73(3H,s),1.31(3H,t,J=7.6Hz).
1-816	8.33(2H,s),8.21(1H,s),7.83(1H,s),7.70(1H,d,J=2.3Hz),7.39-7.32(2H,m),7.30(1H,s),7.20-7.10(3H,m),6.62(1H,s),3.18(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.6Hz).
1-817	8.35(2H,s),8.27(1H,s),8.00(1H,d,J=1.8Hz),7.87(1H,s),7.59-7.58(2H,m),7.49-7.48(3H,m),7.45(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.36(1H,d,J=8.2Hz),3.15(2H,q,J=7.5Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
1-818	8.42(1H,d,J=1.8Hz),8.34(2H,s),8.31(1H,s),8.23(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),7.88(1H,s),7.75-7.74(2H,m),7.69(1H,d,J=8.2Hz),7.56-7.56(3H,m),3.21(2H,q,J=7.5Hz),1.21(3H,t,J=7.3 Hz).
1-819	8.78(1H,d,J=2.3Hz),8.42(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),8.34(2H,s),8.32(1H,s),8.04(2H,d,J=7.8 Hz),7.89(1H,s),7.72-7.69(2H,m),7.62(2H,t,J=7.6Hz),3.25(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-820	8.89(1H,d,J=1.8Hz),8.52(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=1.6Hz),8.37(3H,s),7.89(1H,s),7.67(1H,d,J=7.8 Hz),4.51(2H,d,J=7.2Hz),3.27(2H,q,J=7.5Hz),1.47(3H,t,J=6.9Hz),1.30(3H,t,J=7.6Hz).
1-821	1H-NMR (DMSO-D6) δ : 9.45(1H,s),8.97(1H,d,J=5.0Hz),8.61(2H,s),8.58(1H,d,J=1.8Hz),8.41(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1 Hz),8.15(1H,s),8.00(1H,d,J=8.2Hz),3.51(2H,q,J=7.5Hz),2.86(3H,d,J=4.6Hz),1.18(3H,t,J=7.3 Hz).

10

20

30

40

【 0 2 2 5 】

【表5 - 15】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-823	8.37(2H,s),8.31(1H,s),7.96-7.94(2H,m),7.89(1H,s),7.59(1H,d,J=7.8Hz),3.20(2H,q,J=7.5Hz),2.01-1.98(2H,m),1.65-1.62(2H,m),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
1-825	8.36-8.33(4H,m),8.00(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),7.89(1H,t,J=7.8Hz),7.88(1H,s),5.77(1H,s),3.13(2H,q,J=7.5Hz),2.75(3H,d,J=4.6Hz),1.26(3H,t,J=7.6Hz).
1-827	8.52(2H,s),8.39(1H,s),8.37(2H,s),7.90(1H,s),3.16-3.07(2H,m),3.03-2.94(2H,m),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
1-828	8.79(1H,s),8.43(1H,d,J=8.2Hz),8.38(3H,s),7.90(1H,s),7.70(1H,d,J=7.8Hz),3.28(2H,q,J=7.5Hz),2.77(3H,s),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
1-829	8.64(1H,s),8.40-8.39(3H,m),8.28(1H,d,J=7.8Hz),7.91(1H,s),7.85(1H,d,J=8.2Hz),7.71(1H,t,J=7.8Hz),7.58(1H,t,J=7.6Hz),3.29(2,q,J=7.2Hz),1.31(3H,t,J=7.3Hz).
1-830	8.71(1H,dd,J1=6.6Hz,J2=2.1Hz),8.39(1H,d,J=3.7Hz),8.28(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.87(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.82(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.65-7.61(1H,m),7.58(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.30(1H,t,J=9.4Hz),3.27(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.6Hz).
1-831	8.99(1H,d,J=1.8Hz),8.55(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),8.38(2H,s),8.36(1H,s),8.15(1H,s),7.88(1H,s),7.63(1H,d,J=8.2Hz),4.04(3H,s),3.26(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
1-832	8.58(1H,d,J=1.8Hz),8.36(2H,s),8.31(1H,s),8.20(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.88(1H,s),7.28(1H,d,J=7.8Hz),3.21(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.6Hz).
1-833	8.37(2H,s),8.34(1H,s),8.12(1H,d,J=2.3Hz),7.90(1H,s),7.72-7.69(1H,m),7.65(1H,d,J=8.2Hz),3.23(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
1-834	8.74(1H,s),8.17(1H,s),8.14(1H,s),8.13(2H,d,J=7.8Hz),7.73(2H,d,J=8.2Hz),3.93(2H,q,J=7.5Hz),1.37(3H,t,J=7.6Hz).
1-837	9.05(1H,s),8.59(2H,s),8.27(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=2.3Hz),7.92(1H,s),7.90-7.82(2H,m),7.58(1H,dd,J1=7.1Hz,J2=1.6Hz),7.37(2H,d,J=7.8Hz),7.29-7.25(2H,m),7.11(1H,d,J=7.3Hz),3.54(2H,dd,J1=27.2Hz,J2=6.2Hz),1.39(3H,t,J=7.6Hz).
1-838	9.15(1H,s),8.58(2H,s),8.28-8.26(1H,m),7.93(1H,s),7.91-7.83(2H,m),7.58-7.56(1H,m),7.36-7.32(2H,m),7.24-7.21(2H,m),3.54(2H,dd,J1=26.3Hz,J2=7.1Hz),1.39(3H,t,J=7.6Hz).
1-839	8.50(2H,s),8.27-8.24(1H,m),7.92-7.85(3H,m),7.59-7.56(1H,m),7.00(1H,br),3.47(2H,br),2.74(3H,d,J=4.6Hz),1.35(3H,t,J=7.6Hz).
1-840	8.29(2H,s),8.20(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.92(1H,s),7.90-7.79(3H,m),3.56(2H,br),2.99(3H,s),2.75(3H,s),1.36(3H,t,J=7.3Hz).
1-841	8.37(2H,s),7.93(1H,s),7.82-7.74(3H,m),7.53-7.49(1H,m),2.92-2.80(2H,m),1.12(3H,t,J=7.3Hz).
1-842	8.39(2H,s),8.31(1H,s),8.26(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.8Hz),7.90-7.82(3H,m),7.72-7.67(3H,m),7.57(1H,t,J=7.3Hz),7.45(2H,t,J=7.8Hz),3.06(1H,br),2.95(1H,br),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-843	8.36(2H,s),8.29-8.26(2H,m),7.91-7.83(3H,m),7.72(1H,t,J=1.8Hz),7.68-7.66(1H,m),7.56-7.53(2H,m),7.39(1H,t,J=7.8Hz),3.05(1H,br),2.91(1H,br),1.25(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【0226】

【表5 - 16】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
1-844	8.36(2H,s),8.33(1H,s),8.28-8.25(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=2.1Hz),7.90-7.82(3H,m),7.67-7.65(3H,m),7.44-7.41(2H,m),3.05(1H,br),2.91(1H,br),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
1-845	8.32-8.27(1H,m),8.21(2H,s),7.94(1H,m),7.86-7.82(1H,m),7.55-7.51(1H,m),3.70(2H,q,J=7.3Hz),2.36(6H,br),1.39(3H,t,J=7.6Hz).
1-847	8.45(2H,s),8.27(1H,d,J=7.3Hz),8.10(1H,s),7.94-7.86(3H,m),7.73(1H,d,J=6.9Hz),7.47-7.39(2H,m),7.36-7.31(2H,m),3.09-2.98(2H,m),1.24(3H,t,J=6.9Hz).
1-853	8.21(1H,d,J=1.8Hz),8.20(1H,s),8.04(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.81(1H,d,J=1.8Hz),7.70(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.60(1H,d,J=8.2Hz),7.23(1H,d,J=8.2Hz),2.85(2H,q,J=7.3Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
1-855	8.22(1H,d,J=2.3Hz),8.20(1H,s),8.05(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.61(1H,d,J=8.7Hz),7.55(1H,d,J=8.7Hz),7.31(1H,d,J=2.3Hz),7.23-7.19(1H,m),2.89(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
1-860	8.52(1H,d,J=1.8Hz),8.22(2H,s),8.02(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.63(1H,d,J=8.2Hz),7.29(1H,d,J=7.8Hz),3.38-3.29(1H,m),2.96-2.88(1H,m),1.39(3H,t,J=7.6Hz).
1-862	8.24(1H,s),8.23(1H,d,J=2.3Hz),8.11(1H,d,J=2.3Hz),8.03(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.64(1H,d,J=8.2Hz),7.61(1H,d,J=8.7Hz),7.52(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),3.38-3.29(1H,m),2.96-2.87(1H,m),1.36(3H,t,J=7.3Hz).
1-867	8.57(1H,d,J=1.8Hz),8.24(1H,d,J=1.8Hz),8.23(1H,s),8.18(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),8.00(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.61(1H,d,J=8.2Hz),7.27(1H,d,J=8.7Hz),3.19(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).
1-869	8.25-8.24(2H,m),8.11(1H,d,J=2.7Hz),8.01(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.71-7.68(1H,m),7.65-7.61(2H,m),3.20(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).
2-14	8.62(1H,d,J=3.2Hz),8.52(1H,s),8.28(1H,d,J=7.8Hz),7.82(1H,t,J=7.8Hz),7.55-7.47(3H,m),7.37(1H,t,J=7.6Hz),2.83(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
2-30	8.79(1H,s),7.98(1H,s),7.85(1H,d,J=1.4Hz),7.73(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.27(1H,d,J=8.2Hz),2.88(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
2-32	8.80(1H,s),7.99(1H,s),7.59(1H,d,J=8.7Hz),7.34(1H,d,J=1.8Hz),7.25-7.22(1H,m),2.92(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
2-33	8.88(1H,s),8.01(1H,s),7.90(1H,d,J=2.3Hz),7.79(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.3Hz),7.71(1H,d,J=8.7Hz),2.95(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
2-90	8.93(1H,dd,J1=4.6Hz,J2=0.9Hz),8.42(1H,s),8.14(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),7.59-7.56(2H,m),7.51-7.44(2H,m),7.40(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),2.78(2H,q,J=7.5Hz),1.22(3H,t,J=7.3Hz).
2-91	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.56(1H,s),8.52(1H,s),7.56-7.48(3H,m),7.47(1H,d,J=5.0Hz),7.39(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.5Hz),2.84(2H,q,J=7.5Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
2-95	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.58(1H,s),8.52(1H,s),7.69(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),7.53(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.49-7.45(2H,m),2.68(2H,q,J=7.3Hz),1.05(3H,t,J=7.3Hz).
2-96	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.53(1H,s),8.51(1H,s),7.48-7.45(3H,m),7.34(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),2.88(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【0227】

【表5 - 17】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
2-97	8.80(1H,d,J=5.5Hz),8.59(1H,s),8.51(1H,s),7.59-7.58(1H,m),7.48-7.47(3H,m),2.82(2H,q,J=7.3Hz),1.22(3H,t,J=7.3Hz).
2-98	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.55(1H,s),8.34(1H,d,J=8.7Hz),7.48-7.37(4H,m),2.89(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
2-99	8.79(1H,d,J=5.5Hz),8.52(1H,s),8.50(1H,s),7.50-7.47(2H,m),7.19(1H,dd,J1=9.2Hz,J2=2.7Hz),7.05(1H,ddd,J1=9.6Hz,J2=6.9Hz,J3=1.8Hz),2.88(2H,q,J=7.3Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz)
2-100	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.54(1H,s),8.51(1H,s),7.63(1H,s),7.51-7.47(2H,m),7.39(1H,d,J=8.2Hz),2.88(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
2-102	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.54(1H,s),8.51(1H,s),7.82(1H,d,J=1.8Hz),7.70(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.47(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),7.24(1H,d,J=8.2Hz),2.86(2H,q,J=7.3Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
2-103	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.52-8.51(2H,m),7.46(1H,d,J=5.0Hz),7.40(1H,d,J=8.2Hz),7.35(1H,s),7.18(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),2.81(2H,q,J=7.3Hz),2.45(3H,s),1.22(3H,t,J=7.3Hz).
2-104	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.64(1H,s),8.51(1H,s),7.75(1H,d,J=1.4Hz),7.69-7.63(2H,m),7.49(1H,dd,J1=5.5Hz,J2=1.4Hz),2.94(2H,q,J=7.3Hz),1.31(3H,t,J=7.3Hz).
2-107	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.62(1H,s),8.52(1H,s),7.74(1H,s),7.68(1H,d,J=8.2Hz),7.62(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.49(1H,d,J=5.0Hz),2.93(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
2-109	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.64(1H,s),8.52(1H,s),7.73(1H,s),7.70(1H,d,J=8.2Hz),7.61(1H,d,J=8.2Hz),7.49(1H,d,J=4.6Hz),2.91(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
2-110	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.62(1H,s),8.52(1H,s),7.63(1H,d,J=8.2Hz),7.56(1H,s),7.49(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),7.44(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),4.25-4.13(1H,m),2.89(2H,q,J=7.5Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
2-111	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.64(1H,s),8.52(1H,s),7.73(1H,s),7.67(2H,d,J=8.2Hz),7.60(1H,d,J=8.2Hz),7.49(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.58(3H,s),2.89(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
2-112	8.80(1H,d,J=5.5Hz),8.54(1H,s),8.52(1H,d,J=0.9Hz),7.56(1H,d,J=8.7Hz),7.48(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.1Hz),7.31(1H,d,J=2.3Hz),7.21(1H,ddd,J1=8.6Hz,J2=1.2Hz,J3=0.6Hz),2.90(2H,q,J=7.3Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
2-113	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.61(1H,s),8.51(1H,s),7.76(1H,s),7.64(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.60(1H,d,J=8.2Hz),7.48(1H,d,J=5.0Hz),2.92(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
2-118	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.63(1H,s),8.51(1H,s),7.87(1H,d,J=2.3Hz),7.76(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.3Hz),7.67(1H,d,J=8.7Hz),7.49(1H,d,J=4.1Hz),2.93(2H,q,J=7.3Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
2-120	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.58(1H,s),8.50(1H,s),7.98(1H,s),7.64(1H,s),7.48(1H,d,J=5.0Hz),2.84(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
2-121	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,s),8.51(1H,s),7.65(1H,d,J=8.2Hz),7.48(2H,d,J=8.2Hz),2.69(2H,q,J=7.5Hz),1.06(3H,t,J=7.3Hz).
2-122	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,s),8.51(1H,s),7.82(1H,d,J=8.2Hz),7.48(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),7.41(1H,d,J=8.7Hz),2.69(2H,q,J=7.5Hz),1.06(3H,t,J=7.3Hz).

10

20

30

40

【0228】

【表5 - 18】

化合物 番号	$^1\text{H-NMR}$ スペクトル(CDCl_3) σ ppm:
2-123	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,s),8.51(1H,d,J=0.9Hz),7.56(1H,d,J=8.2Hz),7.50(1H,d,J=2.3Hz),7.48(1H,dd,J1=5.5Hz,J2=1.4Hz),7.33(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),3.87(2H,s),2.88(2H,q,J=7.3Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
2-125	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.56(1H,s),8.52(1H,s),7.55(1H,d,J=1.8Hz),7.53(1H,d,J=7.8Hz),7.47(1H,d,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),7.39(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),4.65(2H,s),2.87(2H,q,J=7.5Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
2-126	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.55(1H,s),8.52(1H,s),7.56(1H,d,J=1.4Hz),7.51(1H,d,J=8.2Hz),7.47(1H,d,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),7.36(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),4.82(2H,s),2.86(2H,q,J=7.3Hz),1.91(1H,br),1.24(3H,t,J=7.6Hz).
2-127	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.51(1H,s),7.46(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.1Hz),7.40(1H,d,J=7.8Hz),7.03(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),2.80(2H,q,J=7.5Hz),2.01-1.95(1H,m),1.21(3H,t,J=7.3Hz),1.11-1.06(2H,m),0.81-0.77
2-128	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.56(1H,s),8.51(1H,d,J=0.9Hz),7.54(1H,d,J=2.3Hz),7.52(1H,d,J=8.2Hz),7.47(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),7.17(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),2.88(2H,q,J=7.5Hz),1.86(2H,dd,J1=7.8Hz,J2=5.0Hz),1.51(2H,dd,J1=8.0Hz,J2=5.7Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
2-129	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.61(1H,s),8.52(1H,s),8.28(1H,d,J=1.8Hz),8.13(1H,s),8.08(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.60(1H,d,J=8.2Hz),7.47(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.1Hz),4.02(3H,s),2.96(2H,q,J=7.3Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
2-131	8.78(1H,d,J=5.0Hz),8.61(1H,s),8.50(1H,br),8.21(1H,d,J=1.8Hz),8.06-8.02(1H,m),7.64(1H,d,J=8.2Hz),7.46(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),2.95(2H,q,J=7.5Hz),2.68(3H,s),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
2-132	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,s),8.51(1H,d,J=0.9Hz),7.58(1H,d,J=8.2Hz),7.56(1H,d,J=2.3Hz),7.48(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.1Hz),7.43(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),5.93(2H,s),2.87(2H,q,J=7.5Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz). $^{19}\text{F NMR}$: -63.48(3F,s),-64.84(3F,s).
2-134	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,s),7.71(1H,s),7.63(1H,d,J=8.2Hz),7.48(1H,d,J=8.2Hz),7.44(1H,d,J=4.1Hz),2.93(2H,q,J=7.3Hz),2.62(3H,s),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
2-135	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,s),7.43(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),7.38(1H,d,J=8.7Hz),7.30-7.28(1H,m),7.22-7.19(1H,m),2.89(2H,q,J=7.3Hz),2.61(3H,s),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
2-140	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,s),8.51(1H,s),7.57-7.48(3H,m),7.45(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.1Hz),7.39(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),2.84(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
2-143	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.55(1H,s),8.50(1H,s),7.82(1H,d,J=1.8Hz),7.70(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.46(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),7.24(1H,d,J=8.2Hz),2.86(2H,q,J=7.3Hz),1.26(3H,t,J=7.6Hz).
2-145	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.55(1H,s),8.51(1H,s),7.55(1H,d,J=8.2Hz),7.47(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),7.31(1H,d,J=2.3Hz),7.23-7.20(1H,m).
2-147	8.87(1H,d,J=2.3Hz),8.59(1H,s),8.40(1H,d,J=8.2Hz),8.05(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.56-7.48(3H,m),7.39(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),2.85(2H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
2-148	8.57(1H,s),8.44(1H,d,J=8.2Hz),7.97(1H,t,J=7.6Hz),7.61(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),7.54-7.46(3H,m),7.38-7.33(1H,m),2.84(2H,q,J=7.3Hz),1.23(3H,t,J=7.3Hz).
2-153	9.11(1H,s),8.66(1H,d,J=5.0Hz),8.30-8.25(3H,m),7.79(1H,t,J=7.6Hz),7.71(1H,t,J=7.6Hz),7.56(1H,d,J=7.8Hz),7.44(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=4.8Hz),3.38-3.28(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.37(3H,t,J=7.1Hz).
2-169	8.81(1H,s),8.55(1H,d,J=1.8Hz),8.04(1H,dd,J1=8.9Hz,J2=2.5Hz),8.03(1H,s),7.31(1H,d,J=8.2Hz),3.42-3.33(1H,m),3.02-2.93(1H,m),1.40(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【表5 - 19】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
2-171	8.83(1H,s),8.13(1H,d,J=2.3Hz),8.04(1H,s),7.67(1H,d,J=8.7Hz),7.55(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),3.42-3.33(1H,m),3.02-2.93(1H,m),1.38(3H,t,J=7.3Hz).
2-172	8.90(1H,s),8.68(1H,d,J=2.7Hz),8.10(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.3Hz),8.05(1H,s),7.75(1H,d,J=8.2Hz),3.48-3.39(1H,m),3.07-2.98(1H,m),1.41(3H,t,J=7.3Hz).
2-229	8.92(1H,d,J=4.6Hz),8.39(1H,s),8.25(1H,d,J=7.8Hz),8.17(1H,d,J=7.8Hz),7.78(1H,t,J=7.8Hz),7.69(1H,t,J=7.6Hz),7.57(1H,d,J=7.8Hz),7.50(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=4.8Hz),3.30(1H,m),2.90-2.81(1H,m),1.33(3H,t,J=7.3Hz).
2-230	8.78(1H,d,J=5.0Hz),8.58(1H,s),8.46(1H,s),8.24(1H,d,J=7.8Hz),7.77-7.65(2H,m),7.56-7.47(2H,m),3.36-3.26(1H,m),2.94-2.84(1H,m),1.35(3H,t,J=7.6Hz).
2-234	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.51(1H,s),8.48(1H,s),7.67(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.60(1H,t,J=8.0Hz),7.48(1H,dd,J1=5.5Hz,J2=1.4Hz),7.41(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.82-3.73(1H,m),3.37-3.28(1H,m),1.45(3H,t,J=7.6Hz).
2-235	8.81(1H,d,J=5.5Hz),8.58(1H,s),8.48(1H,s),8.23(1H,d,J=2.3Hz),7.66(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.5Hz),7.53-7.51(2H,m),3.40-3.31(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.39(3H,t,J=7.6Hz).
2-236	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.62(1H,s),8.48(1H,s),8.21(1H,d,J=8.7Hz),7.74(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.60(1H,d,J=1.8Hz),7.52(1H,d,J=5.0Hz),3.38-3.29(1H,m),2.96-2.88(1H,m),1.38(3H,t,J=7.6Hz).
2-237	8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.55(1H,s),8.50(1H,s),8.10-8.08(1H,m),7.78-7.76(2H,m),7.51(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.1Hz),3.26-3.17(1H,m),2.91-2.82(1H,m),1.31(3H,t,J=7.6Hz).
2-238	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.56(1H,s),8.48(1H,s),7.97(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.7Hz),7.57(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=4.1Hz),7.52(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),7.38(1H,ddd,J1=9.4Hz,J2=6.6Hz,J3=2.1Hz),3.37-3.28(1H,m),2.94-2.85(1H,m),1.37(3H,t,J=7.3Hz).
2-239	8.78(1H,d,J=5.0Hz),8.58(1H,s),8.44(1H,s),8.33(1H,d,J=2.3Hz),7.78(1H,dd,J=8.5,2.1Hz),7.50-7.48(1H,m),7.43(1H,d,J=8.7Hz),3.37-3.28(1H,m),2.94-2.85(1H,m),1.36(3H,t,J=7.3Hz).
2-241	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.58(1H,s),8.53(1H,d,J=2.3Hz),8.48(1H,s),8.02(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.52(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),7.29(1H,d,J=8.7Hz),3.40-3.32(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.40(3H,t,J=7.3Hz).
2-242	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.55(1H,s),8.49(1H,s),8.03(1H,s),7.51-7.43(3H,m),3.36-3.27(1H,m),2.94-2.85(1H,m),2.56(3H,s),1.37(3H,t,J=7.6Hz).
2-243	8.83(1H,d,J=5.0Hz),8.69(1H,s),8.60(1H,d,J=2.3Hz),8.49(1H,s),7.98(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.72(1H,d,J=8.2Hz),7.55(1H,d,J=5.5Hz),3.48-3.39(1H,m),3.01-2.93(1H,m),1.42(3H,t,J=7.3Hz).
2-245	8.91(1H,d,J=1.8Hz),8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.67(1H,s),8.49(1H,s),8.36(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.66(1H,d,J=8.2Hz),7.53(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),4.48(2H,q,J=7.0Hz),3.45-3.36(1H,m),3.02-2.93(1H,m),1.47-1.42(6H,m).
2-246	8.83(1H,d,J=5.0Hz),8.68(1H,s),8.58(1H,d,J=1.8Hz),8.49(1H,s),7.96(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.73(1H,d,J=8.2Hz),7.54(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),3.46-3.37(1H,m),3.00-2.91(1H,m),1.42(3H,t,J=7.6Hz).
2-248	8.83(1H,d,J=5.0Hz),8.68(1H,s),8.56(1H,d,J=1.8Hz),8.50(1H,s),7.95(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.75(1H,d,J=8.2Hz),7.54(1H,d,J=3.7Hz),3.44-3.35(1H,m),3.01-2.92(1H,m),1.37(3H,t,J=7.3Hz).
2-249	8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.67(1H,s),8.49(1H,s),8.29(1H,d,J=1.8Hz),7.83(1H,d,J=8.2Hz),7.69(1H,d,J=8.2Hz),7.53(1H,d,J=4.1Hz),4.41-4.29(1H,m),3.43-3.34(1H,m),2.99-2.90(1H,m),1.36(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【0230】

【表5 - 20】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
2-250	8.83(1H,d,J=5.0Hz),8.68(1H,s),8.52-8.50(2H,m),7.92(1H,d,J=8.2Hz),7.71(1H,d,J=8.2Hz),7.53(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.61(3H,s),3.43-3.34(1H,m),3.01-2.02(1H,m),1.36(3H,t,J=7.3Hz).
2-251	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.51(1H,s),8.48(1H,s),7.71(1H,d,J=2.7Hz),7.50(1H,d,J=5.0Hz),7.46(1H,d,J=8.7Hz),7.16(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.7Hz),3.98(3H,s),3.33-3.24(1H,m),2.91-2.83(1H,m),1.35(3H,t,J=7.6Hz).
2-252	8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.60(1H,s),8.49(1H,s),7.63(1H,d,J=8.7Hz),7.54-7.51(2H,m),3.40-3.31(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.38(3H,t,J=7.6Hz).
2-253	8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.66(1H,s),8.54(1H,s),8.49(1H,s),7.97(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.65(1H,d,J=8.2Hz),7.53(1H,d,J=5.0Hz),3.44-3.36(1H,m),3.02-2.93(1H,m),1.40(3H,t,J=7.6Hz).
2-258	8.83(1H,d,J=5.0Hz),8.68(1H,s),8.67(1H,d,J=2.3Hz),8.49(1H,s),8.08(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.3Hz),7.71(1H,d,J=8.7Hz),7.54(1H,d,J=5.0Hz),3.47-3.38(1H,m),3.02-2.93(1H,m),1.42(3H,t,J=7.3Hz).
2-260	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.63-8.46(3H,m),7.68(1H,s),7.53(1H,d,J=4.1Hz),3.42-3.32(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.40(3H,t,J=7.3Hz).
2-261	8.78(1H,d,J=5.0Hz),8.48(1H,s),8.47(1H,s),7.77(1H,d,J=8.7Hz),7.48(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),7.37(1H,d,J=8.7Hz),3.85-3.76(1H,m),3.38-3.29(1H,m),1.46(3H,t,J=7.6Hz).
2-262	8.78(1H,d,J=8.7Hz),8.48(1H,s),8.47(1H,s),7.94(1H,d,J=8.2Hz),7.48(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),7.29(1H,d,J=8.7Hz),3.84-3.75(1H,m),3.38-3.29(1H,m),1.46(3H,t,J=7.6Hz).
2-263	8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.62(1H,s),8.49(1H,s),8.18(1H,d,J=1.8Hz),7.76(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.63(1H,d,J=7.8Hz),7.53(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.97(2H,s),3.43-3.33(1H,m),2.96-2.87(1H,m),1.40(3H,t,J=7.6Hz).
2-267	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.53(1H,s),8.49(1H,s),7.91(1H,d,J=1.8Hz),7.50(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),7.42(1H,d,J=7.8Hz),7.33(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),3.34-3.25(1H,m),2.92-2.83(1H,m),2.13-2.07(1H,m),1.36(3H,t,J=7.6Hz),1.17-1.13(2H,m),0.92-0.83(2H,m).
2-268	8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.60(1H,s),8.49(1H,s),7.91(1H,d,J=2.3Hz),7.86(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.59(1H,d,J=5.0Hz),7.52(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.39-3.30(1H,m),2.92-2.83(1H,m),1.94-1.90(2H,m),1.65-1.61(2H,m),1.37(3H,t,J=7.3Hz).
2-271	8.93(1H,d,J=1.8Hz),8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.66(1H,s),8.46(1H,s),8.34(1H,dd,J=8.2Hz,1.8Hz),7.67(1H,d,J=8.2Hz),7.49(1H,d,J=5.0Hz),3.43-3.33(1H,m),3.02-2.92(1H,m),2.67(3H,s),1.40(3H,t,J=7.6Hz).
2-272	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.62(1H,s),8.48(1H,s),8.38(1H,d,J=1.8Hz),7.71(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),7.64(1H,d,J=7.8Hz),7.52(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),6.04(2H,s),3.43-3.34(1H,m),2.98-2.89(1H,m),1.38(3H,t,J=7.6Hz).
2-275	8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.53(1H,s),8.05(1H,d,J=1.8Hz),7.57-7.54(1H,m),7.49-7.46(2H,m),3.21-3.12(1H,m),2.86-2.77(1H,m),1.27(3H,t,J=7.6Hz).
2-283	8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.59(1H,s),8.53(1H,d,J=1.8Hz),8.46(1H,s),8.02(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.50(1H,d,J=3.7Hz),7.29(1H,d,J=8.2Hz),3.41-3.32(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.40(3H,t,J=7.3Hz).
2-285	8.83(1H,d,J=5.0Hz),8.61(1H,s),8.47(1H,s),8.12(1H,d,J=2.3Hz),7.63(1H,d,J=8.7Hz),7.54-7.51(2H,m),3.41-3.32(1H,m),2.97-2.88(1H,m),1.38(3H,t,J=7.6Hz).
2-288	8.65(1H,s),8.40(1H,d,J=8.2Hz),8.26-8.23(1H,m),8.00(1H,t,J=7.8Hz),7.78-7.73(1H,m),7.70-7.64(2H,m),7.59-7.56(1H,m),3.37-3.27(1H,m),2.95-2.86(1H,m),1.35(3H,t,J=7.6Hz).

10

20

30

40

【0231】

【表5 - 21】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:	
2-294	8.71(1H,s),8.69(1H,s),8.28(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.86(1H,s),7.80(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.2Hz),7.71(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.60(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.39-3.30(1H,m),2.98-2.90(1H,m),1.39(3H,t,J=7.3Hz).	
2-297	8.67(1H,s),8.62(1H,s),8.57(1H,d,J=2.3Hz),8.19(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.83(1H,s),7.30-7.27(1H,m),3.36(2H,q,J=7.3Hz),1.32(3H,t,J=7.3Hz).	
2-299	8.68(1H,s),8.65(1H,s),8.12(1H,d,J=2.7Hz),7.84(1H,s),7.70(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.5Hz),7.65(1H,d,J=8.7Hz),3.38(2H,q,J=7.5Hz),1.32(3H,t,J=7.3Hz).	10
2-309	8.77(1H,s),8.58(1H,d,J=1.8Hz),8.21(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),8.00(1H,s),7.30(1H,d,J=8.2Hz),3.32(2H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.6Hz).	
2-311	8.80(1H,s),8.12(1H,d,J=2.7Hz),8.01(1H,s),7.73-7.70(1H,m),7.67(1H,d,J=8.7Hz),3.33(2H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.3Hz).	
2-312	8.83(1H,s),8.67(1H,d,J=2.3Hz),8.27(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.5Hz),8.02(1H,s),7.76(1H,d,J=8.7Hz),3.39(2H,q,J=7.5Hz),1.34(3H,t,J=7.3Hz).	
2-322	8.73(1H,s),8.52(1H,s),8.51(1H,s),8.39(1H,d,J=2.3Hz),7.98(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.44(1H,d,J=8.7Hz),3.30(2H,q,J=7.5Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).	20
2-325	8.74(1H,s),8.54(1H,s),8.52(1H,s),8.11(1H,d,J=2.3Hz),7.70(1H,dd,J1=8.9Hz,J2=2.1Hz),7.64(1H,d,J=8.7Hz),3.30(2H,q,J=7.5Hz),1.30(3H,t,J=7.6Hz).	
2-329	8.57(1H,s),8.40-8.39(2H,m),7.98(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.52(1H,s),7.42(1H,d,J=8.2Hz),3.33(2H,q,J=7.3Hz),1.31(3H,t,J=7.3Hz).	
2-332	8.58(1H,s),8.39(1H,s),8.11(1H,d,J=2.3Hz),7.71-7.68(1H,m),7.62(1H,d,J=8.7Hz),7.53(1H,s),3.34(2H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.6Hz).	
2-357	8.48(1H,s),8.40(1H,d,J=2.3Hz),8.03(1H,s),7.97(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.45(1H,d,J=8.2Hz),6.95(1H,s),4.01(3H,s),3.28(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.6Hz).	
2-369	8.91(1H,dd,J1=4.6Hz,J2=0.9Hz),8.45(1H,s),8.28(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.16(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.1Hz),7.86(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.81(1H,dd,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.61(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),7.48(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=4.8Hz),3.13(1H,q,J=7.5Hz),1.24(3H,t,J=7.6Hz).	30
2-370	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.56(1H,s),8.48(1H,s),8.28(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.87(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.8Hz),7.82(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.57(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.1Hz),7.49-7.48(1H,m),3.30(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).	
2-374	8.78(1H,d,J=5.0Hz),8.49(1H,s),8.48(1H,s),7.83(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.71(1H,t,J=8.0Hz),7.47(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),7.43(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.60(2H,q,J=7.5Hz),1.43(3H,t,J=7.3Hz).	
2-375	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.54(1H,s),8.47(1H,s),8.25(1H,d,J=2.7Hz),7.82(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.52(1H,d,J=8.2Hz),7.49(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.31(2H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.6Hz).	
2-376	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,s),8.47(1H,s),8.21(1H,d,J=8.7Hz),7.78(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.59(1H,d,J=2.3Hz),7.49(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.1Hz),3.30(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).	40
2-377	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.51(1H,s),8.49(1H,s),8.18(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.93(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.77(1H,t,J=8.2Hz),7.49(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),3.25(2H,q,J=7.5Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).	

【0232】

【表5 - 2 2】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
2-378	8.80(1H,d,J=5.5Hz),8.54(1H,s),8.47(1H,s),7.99(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=2.7Hz),7.60-7.52(2H,m),7.49(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.29(2H,q,J=7.5Hz),1.30(3H,t,J=7.6Hz).
2-379	8.77(1H,J=5.0Hz),8.52(1H,s),8.45(1H,s),8.38(1H,d,J=2.3Hz),7.96(1H,dd,J1=8.2,J2=2.3Hz),7.48-7.46(1H,m),7.42(1H,d,J=8.2Hz),3.29(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
2-381	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,d,J=1.8Hz),8.53(1H,s),8.46(1H,s),8.18(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.49(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),7.28(1H,d,J=8.2Hz),3.31(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.6Hz).
2-382	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.52(1H,s),8.47(1H,s),8.06(1H,d,J=1.4Hz),7.63(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.47(1H,d,J=5.0Hz),7.44(1H,d,J=8.2Hz),3.27(2H,q,J=7.5Hz),2.59(3H,s),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
2-383	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.61(1H,s),8.58(1H,d,J=1.8Hz),8.47(1H,d,J=0.9Hz),8.14(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.73(1H,d,J=8.2Hz),7.51(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.6Hz),3.40(2H,q,J=7.5Hz),1.33(3H,t,J=7.3Hz).
2-384	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.50(1H,s),8.47(1H,s),7.84(1H,br),7.70(1H,d,J=2.7Hz),7.50(1H,d,J=5.0Hz),7.40(1H,d,J=8.7Hz),7.24(1H,d,J=3.2Hz),3.27(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.3Hz).
2-385	8.89(1H,d,J=1.8Hz),8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.60(1H,s),8.50(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.48(1H,s),7.66(1H,d,J=7.6Hz),7.50(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),4.50(2H,q,J=7.2Hz),3.37(2H,q,J=7.5Hz),1.47(3H,t,J=7.1Hz),1.32(3H,t,J=7.3Hz).
2-386	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.61(1H,s),8.55(1H,d,J=1.8Hz),8.48(1H,s),8.13(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.74(1H,d,J=8.2Hz),7.51(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),3.37(2H,q,J=7.5Hz),1.32(3H,t,J=7.6Hz).
2-387	9.14(1H,m),8.90-8.87(2H,m),8.62(1H,s),8.32(1H,s),7.57(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.99(2H,q,J=7.5Hz),1.50(3H,t,J=7.6Hz).
2-388	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.63(1H,s),8.53(1H,d,J=2.3Hz),8.49(1H,s),8.12(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.76(1H,d,J=8.2Hz),7.52-7.50(1H,m),3.38(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
2-389	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.61(1H,s),8.48(1H,s),8.31(1H,d,J=2.3Hz),7.98(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.69(1H,d,J=8.2Hz),7.50(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),4.41-4.29(1H,m),3.35(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.3Hz).
2-390	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.61(1H,s),8.50(2H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),8.09(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.71(1H,d,J=8.7Hz),7.50(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.64(3H,s),3.37(2H,q,J=7.5Hz),1.30(3H,t,J=7.6Hz).
2-391	8.79(1H,s),8.51(1H,s),8.47(1H,s),7.73(1H,d,J=3.2Hz),7.48-7.46(2H,m),7.29(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=3.2Hz),3.98(3H,s),3.24(2H,q,J=7.5Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
2-392	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.56(1H,s),8.47(1H,s),8.12(1H,d,J=2.7Hz),7.71-7.68(1H,m),7.64(1H,d,J=8.7Hz),7.50(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),3.32(2H,q,J=7.5Hz),1.30(3H,t,J=7.6Hz).
2-393	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.60(1H,d,J=0.9Hz),8.53(1H,d,J=1.8Hz),8.48(1H,s),8.13(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.64(1H,d,J=7.3Hz),7.50(1H,d,J=4.6Hz),3.36(2H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.6Hz).
2-394	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.52(1H,s),8.47(1H,s),8.02(1H,d,J=2.3Hz),7.60(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.48(1H,d,J=5.0Hz),7.43(1H,d,J=8.2Hz),3.27(2H,q,J=7.5Hz),2.62(3H,s),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
2-395	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.60(1H,s),8.48(1H,s),8.42(1H,d,J=1.8Hz),8.25(1H,m,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.78(1H,d,J=8.2Hz),7.50(1H,d,J=3.7Hz),3.36(2H,q,J=7.2Hz),2.89(3H,s),1.32(3H,t,J=7.3Hz).

10

20

30

40

【 0 2 3 3 】

【表5 - 23】

化合物番号	¹ H-NMRスペクトル(CDCl ₃) σ ppm:
2-396	8.83-8.80(2H,m),8.62(1H,s),8.49(1H,s),8.44(1H,d,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),7.80(1H,d,J=7.8Hz),7.52(1H,d,J=3.7Hz),3.42(2H,q,J=7.5Hz),3.22(3H,s),1.35(3H,t,J=7.3Hz).
2-397	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.59(1H,s),8.47(1H,s),8.18(1H,d,J=2.7Hz),7.79(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.7Hz),7.71(1H,d,J=8.2Hz),7.51(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.36(2H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.6Hz).
2-398	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.66(1H,d,J=2.7Hz),8.60(1H,s),8.48(1H,s),8.24(1H,dd,J1=8.7Hz,J2=2.7Hz),7.72(1H,d,J=8.7Hz),7.51(1H,d,J=6.0Hz),3.39(2H,q,J=7.5Hz),1.33(3H,t,J=7.3Hz).
2-399	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.51(1H,s),8.47(1H,s),7.87(1H,dd,J1=2.3Hz,J2=0.9Hz),7.48-7.46(3H,m),5.33(2H,s),3.54(3H,s),3.25(2H,q,J=7.5Hz),1.28(3H,t,J=7.3Hz).
2-400	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.68(1H,s),8.56(1H,s),8.45(1H,s),7.64(1H,s),7.49(1H,d,J=4.6Hz),3.31(2H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.3Hz).
2-401	8.78(1H,d,J=5.5Hz),8.48(1H,s),8.47(1H,s),7.91(1H,d,J=8.2Hz),7.48(1H,d,J=5.0Hz),7.39(1H,d,J=8.7Hz),3.63(2H,q,J=7.5Hz),1.44(3H,t,J=7.6Hz).
2-402	8.78(1H,d,J=5.0Hz),8.48(1H,s),8.47(1H,s),8.09(1H,d,J=8.2Hz),7.48(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.6Hz),7.31(1H,d,J=8.7Hz),3.63(2H,q,J=7.5Hz),1.44(3H,t,J=7.3Hz).
2-403	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.56(1H,s),8.47(1H,s),8.21(1H,d,J=2.3Hz),7.91(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=2.1Hz),7.63(1H,d,J=8.0Hz),7.49(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),4.00(2H,s),3.32(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
2-404	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.63(1H,s),8.59-8.57(1H,m),8.48(1H,s),8.18(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.80(1H,d,J=8.2Hz),7.51(1H,d,J=5.0Hz),3.39(2H,q,J=7.5Hz),1.34(3H,t,J=7.3Hz).
2-407	8.79(1H,d,J=5.0Hz),8.51(1H,s),8.47(1H,s),7.91(1H,s),7.48-7.47(2H,m),7.41(1H,d,J=8.2Hz),3.26(2H,d,J=7.0Hz),2.14-2.08(1H,m),1.28(3H,t,J=7.3Hz),1.23-1.18(2H,m),0.91-0.87(2H,m).
2-408	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.54(1H,s),8.47(1H,s),7.97(1H,s),7.93(1H,d,J=8.2Hz),7.58(1H,d,J=8.2Hz),7.49(1H,d,J=5.0Hz),3.29(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
2-409	8.98(1H,d,J=1.8Hz),8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.59(1H,s),8.54(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),8.48(1H,s),8.15(1H,s),7.62(1H,d,J=7.8Hz),7.48(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),4.04(3H,s),3.35(2H,q,J=7.5Hz),1.33(3H,t,J=7.3Hz).
2-410	9.01(1H,d,J=2.3Hz),8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.64-8.62(2H,m),8.48(1H,s),7.71(1H,d,J=8.2Hz),7.49(1H,d,J=5.0Hz),4.48(3H,s),3.38(2H,q,J=7.5Hz),1.34(3H,t,J=7.6Hz).
2-411	8.90(1H,d,J=1.8Hz),8.76(1H,d,J=5.0Hz),8.59(1H,s),8.49(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),8.43(1H,s),7.66(1H,d,J=8.2Hz),7.45(1H,dd,J=4.1Hz),3.35(2H,q,J=7.3Hz),2.69(3H,s),1.30(3H,t,J=7.3Hz).
2-412	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.56(1H,s),8.47(1H,d,J=0.9Hz),8.37(1H,d,J=2.3Hz),7.89(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.64(1H,d,J=8.2Hz),7.49(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.1Hz),6.05(2H,s),3.33(2H,q,J=7.3Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
2-414	8.55-8.52(1H,m),8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.15(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.4Hz),7.63(1H,d,J=8.2Hz),7.45(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=1.4Hz),3.38(2H,q,J=7.3Hz),2.64(3H,s),1.31(3H,t,J=7.3Hz).
2-415	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.51(1H,s),8.12(1H,d,J=2.3Hz),7.73-7.70(1H,m),7.54(1H,d,J=8.7Hz),7.44(1H,dd,J1=5.0Hz,J2=0.9Hz),3.35(2H,q,J=7.3Hz),1.30(3H,t,J=7.3Hz).

10

20

30

40

【0234】

【表5 - 24】

化合物番号	$^1\text{H-NMR}$ スペクトル(CDCl_3) σ ppm:
2-416	8.82(1H,d,J=5.0Hz),8.55(1H,d,J=0.9Hz),8.07(1H,d,J=2.3Hz),7.74(1H,d,J=8.7Hz),7.70-7.67(1H,m),7.48(1H,dd,J1=5.3Hz,J2=1.1Hz),4.97(2H,br),3.39(2H,q,J=7.5Hz),3.31(3H,s),1.31(3H,t,J=7.3Hz).
2-420	8.80(1H,d,J=5.5Hz),8.57(1H,s),8.47(1H,s),8.28(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.87(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.8Hz),7.82(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.57(1H,dd,J1=7.3Hz,J2=1.4Hz),7.47(1H,d,J=5.0Hz),3.31(2H,q,J=7.5Hz),1.29(3H,t,J=7.6Hz).
2-423	8.80(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,d,J=1.8Hz),8.54(1H,s),8.45(1H,s),8.18(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.47(1H,d,J=3.7Hz),7.27(1H,d,J=8.2Hz),3.31(2H,q,J=7.5Hz),1.30(3H,t,J=7.6Hz).
2-425	8.81(1H,d,J=5.0Hz),8.57(1H,s),8.46(1H,s),8.12(1H,d,J=2.3Hz),7.69(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=1.6Hz),7.63(1H,d,J=8.7Hz),7.48(1H,d,J=5.0Hz),3.32(2H,q,J=7.5Hz),1.31(3H,t,J=7.6Hz).
2-427	8.87(1H,d,J=2.3Hz),8.59(1H,s),8.36(1H,d,J=8.2Hz),8.28(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),8.06(1H,dd,J1=8.5Hz,J2=2.1Hz),7.87(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.82(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.57(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),3.31(2H,q,J=7.5Hz),1.28(3H,t,J=7.6Hz).
2-428	8.59(1H,s),8.39(1H,d,J=8.2Hz),8.24(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.6Hz),7.97(1H,t,J=7.8Hz),7.86-7.76(2H,m),7.62(1H,d,J=6.9Hz),7.55(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.35(2H,q,J=7.5Hz),1.27(3H,t,J=7.6Hz).
2-434	8.87(1H,d,J=1.8Hz),8.60(1H,s),8.40(1H,d,J=8.2Hz),8.05(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.57-7.48(3H,m),7.38(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),2.78(2H,t,J=7.3Hz),1.58(2H,sext,J=7.3Hz),0.94(3H,t,J=7.3Hz).
2-445	8.89(1H,d,J=2.3Hz),8.63(1H,s),8.37(1H,d,J=8.2Hz),8.29(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),7.78(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.70(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.7Hz),7.57(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),3.30-3.23(1H,m),2.91-2.84(1H,m),2.06-1.93(1H,m),1.93-1.77(1H,m),1.09(3H,t,J=7.3Hz).
2-447	8.88(1H,s),8.59(1H,s),8.36(1H,d,J=8.2Hz),8.27(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),8.06(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.86(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.82(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.57(1H,d,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.25(2H,t,J=7.8Hz),1.74(2H,sext,J=7.8Hz),1.00(3H,t,J=7.3Hz).
2-484	8.88(1H,s),8.56(1H,s),8.40(1H,d,J=8.2Hz),8.07(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=2.3Hz),7.82-7.80(1H,m),7.58-7.56(3H,m),3.34(2H,q,J=9.5Hz).
2-485	8.90(1H,dd,J1=2.3Hz,J2=0.9Hz),8.70(1H,s),8.44(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),8.40(1H,d,J=8.2Hz),8.09(1H,dd,J1=8.2Hz,J2=1.8Hz),7.84(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.5Hz),7.79(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.64(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),4.37-4.26(1H,m),3.64-3.53(1H,m).
3-14	9.10(1H,d,J=2.3Hz),8.62(1H,d,J=5.0Hz),8.31(1H,d,J=8.2Hz),8.26(1H,s),7.56-7.48(3H,m),7.43-7.37(2H,m),2.84(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
3-15	9.29(1H,d,J=1.8Hz),8.88(1H,d,J=1.4Hz),8.55(1H,t,J=1.8Hz),8.33(1H,s),7.57-7.50(3H,m),7.40(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),2.85(2H,q,J=7.3Hz),1.25(3H,t,J=7.3Hz).
3-29	8.64(1H,d,J=4.6Hz),8.57(1H,s),7.85(1H,t,J=8.0Hz),7.76(1H,t,J=7.6Hz),7.69(1H,t,J=7.6Hz),7.56(1H,d,J=7.8Hz),7.31(1H,dd,J1=7.6Hz,J2=4.8Hz),3.39-3.30(1H,m),2.96-2.87(1H,m),1.37(3H,t,J=7.6Hz).
3-30	9.29(1H,d,J=1.8Hz),8.92(1H,d,J=0.9Hz),8.54(1H,s),8.36(1H,s),8.27(1H,dd,J1=8.0Hz,J2=1.6Hz),7.80(1H,td,J1=7.7Hz,J2=1.2Hz),7.72(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.57(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=0.9Hz),3.32(1H,m),2.93(1H,m),1.37(3H,t,J=7.6Hz).
3-45	9.26(1H,d,J=1.8Hz),8.86(1H,d,J=1.4Hz),8.49(1H,s),8.43(1H,s),8.22(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.8Hz),7.86(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.7Hz),7.81(1H,td,J1=7.6Hz,J2=1.4Hz),7.59(1H,dd,J1=7.8Hz,J2=1.4Hz),3.27(2H,q,J=7.5Hz),1.26(3H,t,J=7.3Hz).
4-10	8.71(1H,s),8.32(1H,s),8.32(1H,s),7.83(1H,d,J=5.0Hz),7.56-7.49(3H,m),7.39(1H,t,J=7.6Hz),2.83(2H,q,J=7.3Hz),1.24(3H,t,J=7.3Hz).
4-25	8.74(2H,d,J=5.0Hz),8.31(1H,s),8.26(1H,d,J=8.2Hz),7.81-7.79(3H,m),7.71(1H,t,J=7.6Hz),7.55(1H,d,J=8.2Hz),3.35-3.26(1H,m),2.96-2.87(1H,m),1.36(3H,t,J=7.3Hz).

10

20

30

40

【0235】

< 製剤化 >

次に、本発明化合物を農園芸用殺虫・殺ダニ剤として製剤化する方法の具体例を製剤例1～5に示す。

【0236】

50

製剤例 1 粉剤

合成例 1 の化合物 (1 - 6 3 1) (2 重量部)、P A P (イソプロピルリン酸エステル) (1 重量部) およびクレ - (9 7 重量部) の混合物を、均一に粉碎混合して、活性成分を 2 重量 % 含有する粉剤を得ることができる。さらに、合成例 1 の化合物に替えて、表 1 ~ 表 4 に記載の各化合物を用いること以外は、同様の方法により、それぞれの粉剤を得ることができる。

【 0 2 3 7 】

製剤例 2 水和剤

合成例 1 の化合物 (1 - 6 3 1) (2 0 重量部)、アルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム (3 重量部)、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエ - テル (5 重量部) および白土 (7 2 重量部) の混合物を均一に粉碎混合することにより、活性成分を 2 0 重量 % 含有する水和剤を得ることができる。さらに、合成例 1 の化合物に替えて、表 1 ~ 表 4 に記載の各化合物を用いること以外は、同様の方法により、それぞれ水和剤を得ることができる。

【 0 2 3 8 】

製剤例 3 乳剤

合成例 1 の化合物 (1 - 6 3 1) (3 0 重量部)、メチルナフタレン (4 0 重量部) およびポリオキシエチレンアルキルフェニルエ - テル (3 0 重量部) 混合して溶解することにより、活性成分を 3 0 重量 % 含有する乳剤を得ることができる。さらに、合成例 1 の化合物に替えて、表 1 ~ 表 4 に記載の各化合物を用いること以外は、同様の方法により、それぞれ乳剤を得ることができる。

【 0 2 3 9 】

製剤例 4 フロアブル剤

合成例 1 の化合物 (1 - 6 3 1) (2 5 重量部)、ポリオキシエチレンアルキルエ - テル (1 重量部)、アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム (1 重量部)、キサンタンガム (1 重量部) および水 (7 2 重量部) の混合物を均一に混合することにより、活性成分を 2 5 重量 % 含有するフロアブル剤を得ることができる。さらに、合成例 1 の化合物に替えて、表 1 ~ 表 4 に記載の各化合物を用いること以外は、同様の方法により、それぞれのフロアブル剤を得ることができる。

【 0 2 4 0 】

製剤例 5 粒剤

合成例 1 の化合物 (1 - 6 3 1) (5 重量部)、ラウリル硫酸ナトリウム (1 重量部)、リグニンスルホン酸カルシウム (5 重量部)、ベントナイト (3 0 重量部) およびクレ - (5 9 重量部) の混合物に、さらに水 (1 5 重量部) を加えて混練機で混練し、造粒機で造粒後更に、流動乾燥機で乾燥して、活性成分を 5 重量 % 含有する粒剤を得ることができる。さらに、合成例 1 の化合物 (1 - 6 3 1) に替えて、表 1 ~ 表 4 に記載の各化合物を用いること以外は、同様の方法により、それぞれの粒剤を得ることができる。

【 0 2 4 1 】

上記により得られた本発明に係る有害生物防除剤を用いて防除効果の評価の具体例を試験例 1 ~ 5 に示す。

【 0 2 4 2 】

試験例 - 1 ハスモンヨトウに対する防除試験

セルトレイで栽培したキャベツ苗をタ - ンテ - ブル上に乗せ、スプレ - ガンにより製剤例 3 に準じて調製した乳剤希釈液 (5 0 0 p p m) 3 0 m L を均一に散布した。風乾後、蓋に空気穴を開けたプラスチック製容器に入れ、ハスモンヨトウ 2 齢幼虫を 5 頭ずつ放虫し、2 5 恒温室内 (1 6 時間照明) に静置した。放虫 4 日後に生存虫数を調べ、下記計算式 (a) により死虫率 (%) を算出した。試験は 2 連制で実施した。

【 0 2 4 3 】

10

20

30

40

式 (a)

$$\text{死虫率 (\%)} = \left(1 - \frac{\text{処理区の調査日の生存虫数}}{\text{無処理区の調査日の生存虫数}} \right) \times 100$$

【0244】

代表例として、前記化合物番号 1 - 75、1 - 81、1 - 82、1 - 83、1 - 85、1 - 86、1 - 87、1 - 88、1 - 91、1 - 197、1 - 229、1 - 236、1 - 243、1 - 251、1 - 255、1 - 278、1 - 305、1 - 310、1 - 319、1 - 336、1 - 354、1 - 360、1 - 361、1 - 363、1 - 364、1 - 365、1 - 366、1 - 367、1 - 369、1 - 370、1 - 475、1 - 507、1 - 513、1 - 520、1 - 528、1 - 536、1 - 552、1 - 554、1 - 555、1 - 562、1 - 587、1 - 596、1 - 631、1 - 637、1 - 638、1 - 639、1 - 640、1 - 641、1 - 642、1 - 643、1 - 644、1 - 646、1 - 647、1 - 752、1 - 784、1 - 786、1 - 790、1 - 791、1 - 798、1 - 802、1 - 805、1 - 806、1 - 809、1 - 810、1 - 815、1 - 820、1 - 823、1 - 830、1 - 831、1 - 832、1 - 833、1 - 860、1 - 862、1 - 867、1 - 869、2 - 30、2 - 32、2 - 33、2 - 91、2 - 96、2 - 97、2 - 99、2 - 100、2 - 102、2 - 107、2 - 112、2 - 113、2 - 127、2 - 134、2 - 135、2 - 140、2 - 143、2 - 145、2 - 147、2 - 169、2 - 171、2 - 172、2 - 230、2 - 234、2 - 235、2 - 236、2 - 238、2 - 239、2 - 241、2 - 246、2 - 252、2 - 261、2 - 262、2 - 267、2 - 275、2 - 283、2 - 285、2 - 295、2 - 297、2 - 299、2 - 309、2 - 311、2 - 312、2 - 322、2 - 323、2 - 325、2 - 329、2 - 330、2 - 332、2 - 351、2 - 353、2 - 367、2 - 370、2 - 374、2 - 375、2 - 376、2 - 377、2 - 378、2 - 379、2 - 381、2 - 386、2 - 388、2 - 389、2 - 392、2 - 393、2 - 397、2 - 398、2 - 401、2 - 402、2 - 407、2 - 408、2 - 409、2 - 410、2 - 411、2 - 414、2 - 415、2 - 420、2 - 423、2 - 425、2 - 427、3 - 14、3 - 15、3 - 29、3 - 30、3 - 45、4 - 10、4 - 25

の化合物が死虫率 80% 以上を示した。

【0245】

試験例 - 2 トビイロウンカに対する防除試験

プラスチック製カップで栽培したイネ芽出し苗をタ-ンテ-ブル上に乗せ、スプレ-ガンにより製剤例 3 に準じて調製した乳剤希釈液 (500 ppm) 30 mL を均一に散布した。風乾後、蓋にナイロンゴ-スを張ったポリカ-ボネ-ト製プラスチック容器に入れ、トビイロウンカ 4 齢幼虫を 10 頭ずつ放虫し、25 恒温室内 (16 時間照明) に静置した。放虫 5 日後に生存虫数を調べ、下記計算式 (a) により死虫率 (%) を算出した。試験は 2 連制で実施した。

【0246】

式 (a)

$$\text{死虫率 (\%)} = \left(1 - \frac{\text{処理区の調査日の生存虫数}}{\text{無処理区の調査日の生存虫数}} \right) \times 100$$

【0247】

代表例として、前記化合物番号 1 - 56、1 - 83、1 - 488、1 - 578、2 - 147、2 - 409、2 - 414、2 - 427、3 - 14、4 - 25 の化合物が死虫率 80% 以上を示した。

【0248】

試験例 - 3 マメアブラムシに対する防除試験

プラスチック製カップで栽培したそらまめ苗に対しマメアブラムシ無翅成虫を3頭ずつ放虫した。放虫1日後にこのそらまめ苗をタ-ンテ-ブル上に乗せ、スプレ-ガンにより製剤例3に準じて調製した乳剤希釈液(500ppm)30mLを均一に散布した。処理後、25℃恒温室内(16時間照明)に置き、処理4日後に寄生している成虫および幼虫数を調べ、下記計算式(b)により防除価(%)を算出した。試験は2連制で実施した。

【0249】

式(b)

$$\text{防除価}(\%) = \left(1 - \frac{\text{処理区の調査日の寄生虫数}}{\text{無処理区の調査日の寄生虫数}}\right) \times 100$$

10

【0250】

代表例として、前記化合物番号

1-26、1-232、1-275、1-510、2-91、2-100、2-140、2-230、2-370、2-375、2-379、2-407、2-408、2-420、2-423、3-15、3-45

の化合物が防除価80%以上を示した。

20

【0251】

試験例 - 4 ナミハダニに対する防除試験

プラスチック製カップで栽培したいんげん苗に対しナミハダニ雌成体を10頭ずつ放虫した。放虫1日後にこのいんげん苗をタ-ンテ-ブル上に乗せ、スプレ-ガンにより製剤例3に準じて調製した乳剤希釈液(500ppm)30mLを均一に散布した。処理後、25℃恒温室内(16時間照明)に置き、処理8日後に寄生している生存虫数を調べ、計算式(b)により防除価(%)を算出した。試験は2連制で実施した。

【0252】

式(b)

$$\text{防除価}(\%) = \left(1 - \frac{\text{処理区の調査日の寄生虫数}}{\text{無処理区の調査日の寄生虫数}}\right) \times 100$$

30

【0253】

代表例として、前記化合物番号

1-834

の化合物が防除価80%以上を示した。

【産業上の利用可能性】

【0254】

本発明によれば、優れた殺虫・殺ダニ効果を奏する新規な1,2,3-トリアゾール誘導体、及び上記1,2,3-トリアゾール誘導体を含有する殺虫・殺ダニ剤を提供することができる。

40

【0255】

本発明を詳細にまた特定の実施態様を参照して説明したが、本発明の精神と範囲を逸脱することなく様々な変更や修正を加えることができることは当業者にとって明らかである。

本出願は、2015年11月30日出願の日本特許出願(特願2015-233791)に基づくものであり、その内容はここに参照として取り込まれる。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 6 1 P 33/14	(2006.01)	A 6 1 K	31/4439
C 0 7 D 401/04	(2006.01)	A 6 1 K	31/4196
C 0 7 D 403/08	(2006.01)	A 6 1 K	31/4245
C 0 7 D 413/08	(2006.01)	A 6 1 P	33/14
C 0 7 D 249/08	(2006.01)	C 0 7 D	401/04 C S P
C 0 7 D 401/14	(2006.01)	C 0 7 D	403/08
C 0 7 D 413/14	(2006.01)	C 0 7 D	413/08
A 0 1 P 7/02	(2006.01)	C 0 7 D	249/08 5 3 7
A 0 1 P 7/04	(2006.01)	C 0 7 D	401/14
A 0 1 N 43/647	(2006.01)	C 0 7 D	413/14
A 0 1 N 43/713	(2006.01)	A 0 1 P	7/02
A 0 1 N 43/836	(2006.01)	A 0 1 P	7/04
A 0 1 N 53/14	(2006.01)	A 0 1 N	43/647
A 0 1 N 47/02	(2006.01)	A 0 1 N	43/713
A 0 1 N 43/653	(2006.01)	A 0 1 N	43/836
		A 0 1 N	53/14
		A 0 1 N	47/02
		A 0 1 N	43/653 A

- (72)発明者 尾上 真治
 神奈川県厚木市戸田 2 1 6 5 番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内
- (72)発明者 岩崎 克彦
 神奈川県厚木市戸田 2 1 6 5 番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内
- (72)発明者 大 高 聡仁
 神奈川県厚木市戸田 2 1 6 5 番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内
- (72)発明者 土居 勇人
 神奈川県厚木市戸田 2 1 6 5 番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内
- (72)発明者 松尾 英子
 神奈川県厚木市戸田 2 1 6 5 番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内
- (72)発明者 尾上 美和
 神奈川県厚木市戸田 2 1 6 5 番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内
- (72)発明者 沖本 麻子
 神奈川県厚木市戸田 2 1 6 5 番地 北興化学工業株式会社 開発研究所内

審査官 東 裕子

- (56)参考文献 国際公開第 2 0 1 2 / 1 7 5 4 7 4 (W O , A 1)
 国際公開第 2 0 1 5 / 0 6 7 6 4 8 (W O , A 1)
 特開 2 0 1 2 - 1 8 8 4 1 8 (J P , A)
 国際公開第 2 0 1 5 / 1 4 4 8 2 6 (W O , A 1)
 国際公開第 2 0 1 6 / 2 0 4 2 7 0 (W O , A 1)
 HOHLOCH,Stephan , European Journal of Inorganic Chemistry , 2 0 1 1 年 , No.20 , p.3067-3075
 XU, Jiabin , Organic Letters , 2 0 1 4 年 , Vol.16, No.15 , p.3942-3945
 SCHWEINFURTH,David , Organometallics , 2 0 1 3 年 , Vol.32, No.20 , p.5834-5842

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

C07D

CAplus/REGISTRY(STN)