

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004年2月5日 (05.02.2004)

PCT

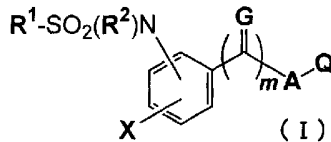
(10) 国際公開番号
WO 2004/011429 A1

- (51) 国際特許分類: C07D 209/48, 237/32, 239/52, 249/04, 249/12, 251/08, 253/06, 257/04, 277/34, 401/04, 403/04, A01N 43/38, 43/50, 43/54, 43/58, 43/64, 43/647, 43/653, 43/707, 43/713, 43/78, 47/02
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2003/009405
- (22) 国際出願日: 2003年7月24日 (24.07.2003)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2002-218452 2002年7月26日 (26.07.2002) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本農薬株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-8236 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 日野 智和 (HINO, Tomokazu) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 嶋岡 孝史 (SHIMAOKA, Takashi) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 三浦 友三 (MIURA, Yuzo) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 豆塚 弘毅 (MAMETSUKA, Koki) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 清川 貴弘 (KIYOKAWA, Takahiro) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 村田 伸治 (MURATA, Shinji) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP).

[続葉有]

(54) Title: NOVEL HALOALKYLSULFONANILIDE DERIVATIVES, HERBICIDES AND USAGE THEREOF

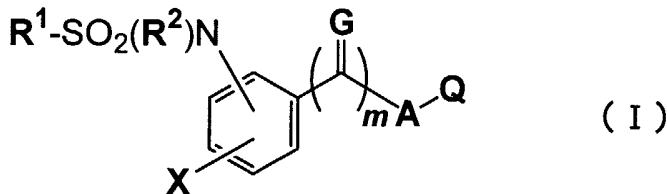
(54) 発明の名称: 新規なハロアルキルスルホンアニリド誘導体及び除草剤並びにその使用方法



(57) Abstract: Haloalkylsulfonanilide derivatives represented by the general formula (I) and salts thereof; herbicides containing the compounds; and usage thereof: (I) wherein R¹ is halo(C₁-C₆)alkyl; R² is H, C₁-C₆ alkyl or the like; A is C₁-C₆ alkylene or the like; G is OS, NR³, or the like; m is 0 or 1; X is substituted phenyl, phenoxy, or the like; and Q is an optionally substituted heterocycle having at least one ring-constituent nitrogen atom at which the heterocycle is bonded to A.

(57) 要約:

本発明は、一般式 (I) :



(式中、R¹はハロ (C₁-C₆) アルキル基 ; R²はH、 (C₁-C₆) アルキル基等 ; Aは (C₁-C₆) アルキル基等 ; GはOS、NR³等 ; mは0又は1 ; Xは置換フェニル基、フェノキシ基等 ; Qは構成原子の少なくとも1個がNであり、かつそのN原子がAとの結合部位である、置換されていてもよいヘテロ環を示す。) で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類及び当該化合物を

WO 2004/011429 A1



(74) 代理人: 浅村 皓, 外(ASAMURA,Kiyoshi et al.); 〒100-0004 東京都千代田区大手町2丁目2番1号新大手町ビル331 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

明 細 書

新規なハロアルキルスルホンアニリド誘導体及び除草剤並びにその使用方法

5 技術分野

スルホンアニリド誘導体又はその塩及び該化合物を有効成分とする除草剤並びにその使用方法に関するものである。

背景技術

従来、パーフルオロアルキルスルホニルアミノ基を置換基として有するジフェニルエーテル誘導体が除草剤又は抗炎症剤として有用であることが知られている（例えば、米国特許第3906024号明細書参照。）が、ジフェニルエーテル以外の骨格についてはなんらの記載も示唆もない。また、フェノキシ基、フェニルチオ基、フェニルスルホニル基等を置換基として有するパーフルオロアルキルスルホンアニリド誘導体が除草剤又は抗炎症剤として有用であること（例えば、
10 独国特許出願公開第21181903号明細書参照。）が、トリフルオロメタン
スルホニルアミノ基を置換基として有するウレア誘導体が除草剤として有用であること（例えば、特開昭60-87254号公報参照。）が、トリフルオロメタン
スルホニルアミノ基を有するピラジン誘導体が除草剤として有用であること
15 （例えば、米国特許第4345076号明細書参照。）が知られているが、本発
明の一般式（I）で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体は記載も示唆
もされておらず、本発明の一般式（I）で表されるハロアルキルスルホンアニリ
ド誘導体が有するようなイネと水田雑草間の選択除草性に関する記載もない。

また、トリフルオロメタンスルホンアニリド構造を有するヘテロ環誘導体が除草剤として有用であることが知られている（例えば、欧州特許出願公開第001
25 16935号明細書参照。）が、トリフルオロメタンスルホンアニリドとヘテロ環が直接結合した骨格であり、本発明の一般式（I）のようにハロアルキルスル
ホンアニリドとヘテロ環がアルキレン基等を介して結合した骨格の化合物は記載
も示唆もされていない。4位に2-ピリミジニルオキシ基を有するスルホンアニリ
ド誘導体及び該化合物を有効成分とする除草剤が知られており（例えば、特開

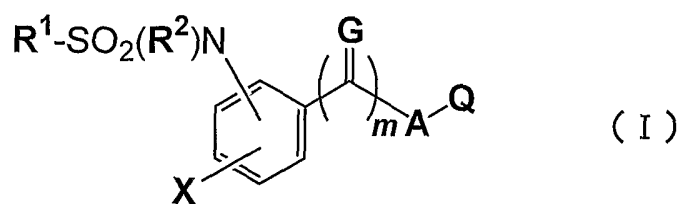
平8-193011号公報又は特開平8-291146号公報参照。)、イネに薬害がないことや水田への適用性等が記載されているが、本発明の一般式(I)で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体とは骨格が異なり、他の骨格について特段の記載も示唆もない。

- 5 更に、除草剤として有用な2位にピリミジニルオキシ基を有するスルホンアニリド誘導体(例えば、国際公開第93/09099号パンフレット、国際公開第96/41799号パンフレット又は特開平2-149567号公報参照。)が、ピリミジン2位とアニリン2位との結合にアミノメチレン基又はイミノメチレン基を有する除草剤として有用なスルホンアニリド誘導体化合物(例えば、特開平
- 10 11-60562号公報参照。)が、2位にピリミジニル基を持ち、更に6位にアルコキシアルキル基を有するトリフルオロメタンスルホンアニリド誘導体が哺乳動物に対する毒性の低い水田用除草剤として有用であること(例えば、特開2000-63360号公報参照。)が、2位にジメトキシピリミジニルヒドロキシメチル基を有するジフルオロメタンスルホンアニリド誘導体がイネに選択性を
- 15 有する除草剤として知られている(例えば、特開2000-44546号公報参照。)が、いずれもジメトキシピリミジニル基等を有することが必須の構造的特徴であり、本発明の一般式(I)で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体のように、ハロアルキルスルホンアニリドとヘテロ環がアルキレン基等を介して結合した骨格の化合物は記載も示唆もされていない。また、除草剤としての作
- 20 用性も異なっている。

- 本発明者等は、新規な除草剤を開発すべくスルホンアニリド構造を有する誘導体の合成とその生理活性について鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式(I)で表される新規なハロアルキルスルホンアニリド誘導体が文献未記載の新規化合物であり、先行技術に開示の化合物に比して顕著な除草効果、スルホニルウレア
- 25 系除草剤抵抗性雑草等の難防除雑草を含む多くの雑草種に対する広い適用性、効果の持続性、優れた作物-雑草間の選択性等の特性を兼ね備えており、除草剤特に水田用除草剤として有用なことを見出し、本発明を完成させたものである。

発明の開示

本発明は一般式(I)：



{式中、 R^1 はハロ (C_1-C_6) アルキル基を示す。

- R^2 は水素原子、(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) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシカルボニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基を示す。

Q は構成原子の少なくとも1個が窒素原子であり、かつその窒素原子が A との結合部位である置換されていても良いヘテロ環を示す。

- A は(C_1-C_6) アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、(C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はシアノ基から選択される1以上の置換基を有する置換(C_1-C_6) アルキレン基、(C_2-C_6) アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、(C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はシアノ基から選択される1以上の置換基を有する置換(C_2-C_6) アルケニレン基又は(C_2-C_6) アルキニレン基を示す。

- G は酸素原子、硫黄原子、 $N-R^3$ (式中、 R^3 は水素原子、(C_1-C_6) アルキル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。) 、 $N-OR^4$ (式中、 R^4 は水素原子、(C_1-C_6) アルキル基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y (Y は後記に示

- す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキル基を示す。) 又は $N-NR^5R^6$ (式中、 R^5 及び R^6 は同一又は異なっても良く、水素原子、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。又、
- 5 R^5 と R^6 は一緒になって (C_3-C_6) アルキレン基を示すこともできる。) を示す。
 m は 0 又は 1 の整数を示す。
- X は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ
- 10 (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記
- 15 に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、
- 20 Y (Y は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル
- 25 基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基、フェニル (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニ

ル (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1～4 個の置換基を示す。

Y は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (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、カルボキシ基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1～5 個の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (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、カルボキシ基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1～5 個の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シ

- クロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、
(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ
(C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル
5 スルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニ
ル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (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、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカル
ボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、
水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1~5 個の置換基を有
する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、
10 ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、
シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル
基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、
ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アル
キルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスル
15 ホニル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (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、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミ
ノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニ
ル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1~5 個の置換
基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異な
20 っても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6)
アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ
(C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) ア
ルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、
ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-
25 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、ハロ (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、カルボキシル基、モノ (C_1-
 C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキル
アミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される
1~5 個の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、(C_1-C_6) アルキルカルボ

- ニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6)
- 5 アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (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、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキル
- 10 アミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1～5 個の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、
- 15 (C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、(C_1-C_6) アルキルカ
- 20 ルボニル基、ハロ (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、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1～5 個の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基、フェニル (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一
- 25 又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、

- ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 ハロ (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、 カルボキシル基、 モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、 同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、 水酸基、 アミノ基、 シアノ基又はニトロ基から選
- 5 択される 1 ~ 5 個の置換基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、 水酸基、 アミノ基、 シアノ基又はニトロ基から選択される 1 ~ 5 個の置換基を示す。又、 Y はベンゼン環上の隣接する炭素原子と一緒にあって、 同一又は異なっても良く、 酸素原子、 硫黄原子又は窒素原子 (該窒素原子は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル
- 10 基、 (C_2-C_6) アルキニル基又はシクロ (C_3-C_6) アルキル基によって置換されていても良い。) から選択される 1 乃至 2 個のヘテロ原子により中断されても良い (C_1-C_4) アルキレン基により 5 乃至 6 員環を形成しても良い。 }

で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類及び該化合物を含有する除草剤並びにその使用方法に関するものである。

15 発明を実施するための形態

- 本発明のハロアルキルスルホンアニリド誘導体の一般式 (I) 及び Q-1 ~ Q-14 の定義において、「ハロゲン原子」とは塩素原子、 臭素原子、 沃素原子又はフッ素原子を示す。「(C_1-C_6) アルキレン基」はメチレン、 エチレン、 プロピレン、 トリメチレン、 ジメチルメチレン、 テトラメチレン、 イソブチレン、 ジメ
- 20 チルエチレン、 ヘキサメチレン等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルキレン基を示し、「(C_2-C_6) アルケニレン基」又は「(C_2-C_6) アルキニレン基」は同様に直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルケニレン基又はアルキニレン基を示す。「(C_1-C_6) アルキル基」とは、 例えばメチル、 エチル、 n-プロピル、 i-プロピル、 n-ブチル、 i-ブチル、 s-ブチル、 t-ブチル、 n-
- 25 ペンチル、 ネオペンチル、 n-ヘキシル等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルキル基を示す。「(C_1-C_6) ハロアルキル基」とは、 同一又は異なっても良い 1 以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ~ 6 個のアルキル基を示し、 例えばトリフルオロメチル、 ジフルオロメチル、 パーフルオロエチル、 パーフルオロイソプロピル、 クロロメチル、 ブロモメチル、 I

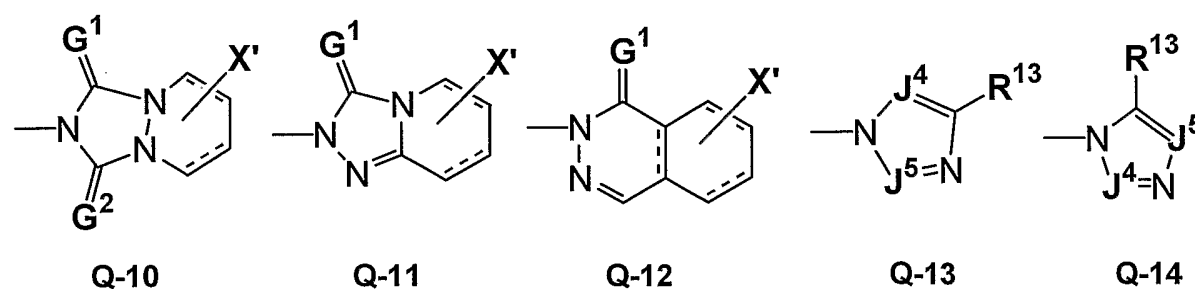
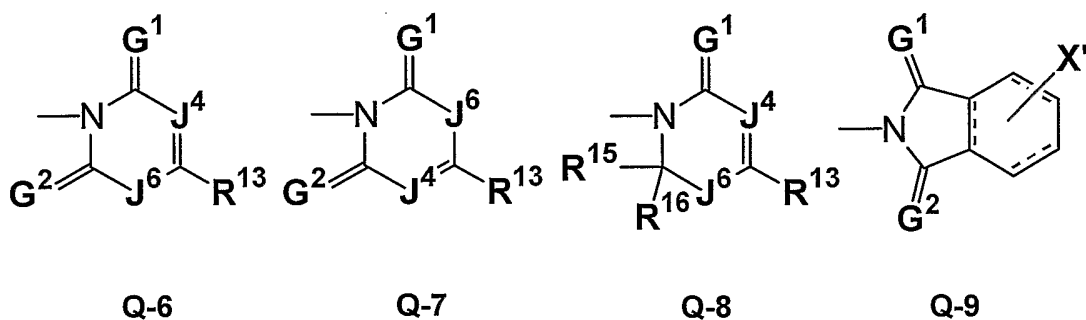
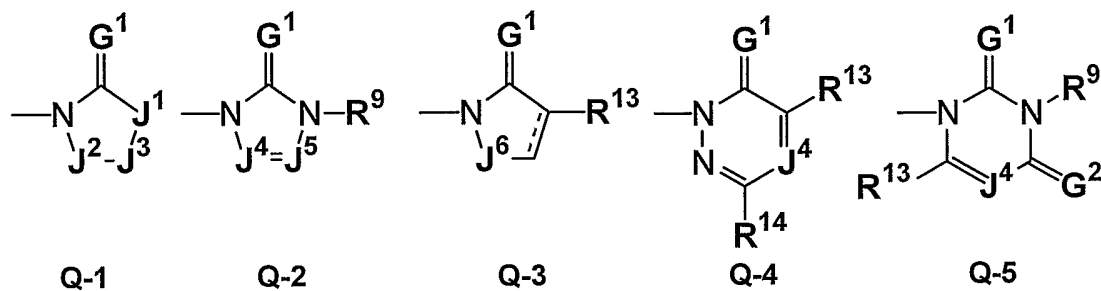
ーブロモエチル、2, 3-ジブロモプロピル等を示す。「(C₃-C₆)シクロアルキル基」とは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、2-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロペンチル等の炭素原子数3~6個の脂環式アルキル基を示す。

- 5 「(C₁-C₆)アルコキシ基」とは、例えばメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、ネオペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルコキシ基を示す。「ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換され
- 10 た直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示し、例えばジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ等を示す。「(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基」とは、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原
- 15 子数1~6個のアルコキシカルボニル基を示す。「(C₁-C₆)アルキルチオ基」とは、例えばメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、n-ペンチルチオ、イソペンチルチオ、n-ヘキシルチオ等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルチオ基を示す。「(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基」とは、例えばメチルス
- 20 ルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニル、t-ブチルスルフィニル、n-ペンチルスルフィニル、イソペンチルスルフィニル、n-ヘキシルスルフィニル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルスルフィニル基を示す。「(C₁-C₆)アルキルスルホニル基」とは、例えばメチルスル
- 25 ニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、s-ブチルスルホニル、t-ブチルスルホニル、n-ペンチルスルホニル、イソペンチルスルホニル、n-ヘキシルスルホニル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキルスルホニル基を示す。

Qの定義の「構成原子の少なくとも1個が窒素原子であり、かつその窒素原子

がAとの結合部位となるヘテロ環」とは、Aとの結合位置が窒素原子であってその窒素原子を含む4～13員ヘテロ環を示し、当該ヘテロ環は4～8員ヘテロ環にさらにベンゼン環又は4～7員ヘテロ環が縮合した縮合環を含む。また、ヘテロ環の構成原子には1又は複数の窒素原子の他に酸素原子、硫黄原子、リン原子等

5 他のヘテロ原子を含むことができる。Qとしては、例えば



10

{式中、G¹、G²は同一又は異なっても良く、酸素原子、硫黄原子、N-R^{3'}

(式中、R^{3'} は水素原子、(C₁-C₆)アルキル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル(C₁-C₆)アルキル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。)

15 から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル(C₁-C₆)アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から

- 選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。) 、 $N-OR^{4'}$
 (式中、 $R^{4'}$ は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキル基を示す。) 、 $N-$
 5 $NR^{5'}$ $R^{6'}$ (式中、 $R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ は同一又は異なっても良く、水素原子、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。又、 $R^{5'}$ と $R^{6'}$ は一緒になって (C_3-C_6) アルキレン基を示すこともできる。) 又は CR^7R^8 (式中、 R^7 及び R^8 は同一又は異なっても良く、水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6)
 10 アルコキシカルボニル基、シアノ基又はニトロ基を示す。) を示す。

- J^1 は酸素原子、硫黄原子又は $N-R^9$ (式中、 R^9 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル
 15 (C_1-C_6) アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基 (複素環基は請求項 2 に同じ。) 、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基 (複素環基は前記に同じ。) 、複素環 (C_1-C_6) アルキル基 (複素環基は前記に同じ。) 、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基
 20 を環上に有する置換複素環 (C_1-C_6) アルキル基 (複素環基は前記に同じ。) 、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基を示す。) を示す。

- 25 J^2 及び J^3 は同一又は異なっても良く、酸素原子、硫黄原子、 $N-R^9$ (式中、 R^9 は前記に同じ。) 、 $R^{10}-C-R^{11}$ (式中、 R^{10} 及び R^{11} は同一又は異なっても良く、水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、

(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル(C₁-C₆)アルキル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル(C₁-C₆)アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)

J⁴及びJ⁵は同一又は異なっても良く、C-R¹² (式中、R¹²は水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル(C₁-C₆)アルキル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有するフェニル(C₁-C₆)アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基又はシアノ基を示す。)

J⁶は酸素原子、硫黄原子、N-R⁹ (式中、R⁹は前記に同じ。) 又はR¹⁰-C-R¹¹ (式中、R¹⁰及びR¹¹は前記に同じ。) を示す。

R⁹は前記に同じ。

R¹³及びR¹⁴は同一又は異なっても良く水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル(C₁-C₆)アルキル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル(C₁-C₆)アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(複素環基は前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基(複素環基は前記に同じ。)、複素環(C₁-C₆)アルキル基(複素環基は前

記に同じ。) 、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換複素環(C₁-C₆)アルキル基(複素環基は前記に同じ。) 、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基又はシアノ基を示す。

R¹⁵及びR¹⁶は同一又は異なっても良く、水素原子又は(C₁-C₆)アルキル基を示す。

- 10 X' は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、シクロ(C₃-C₇)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、シクロハロ(C₃-₇)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、同一又は異なっても

良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基、フェニル (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1~4 個の置換基を示す。

Y' は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆) アルキル基、(C₂-C₆) アルケニル基、(C₂-C₆) アルキニル基、シクロ (C₃-C₆) アルキル基、ハロ (C₁-C₆) アルキル基、シクロハロ (C₃-C₆) アルキル基、(C₁-C₆) アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(C₁-C₆) アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆) アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、フェニル基、フェノキシ基、(C₁-C₆) アルキルカルボニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、(C₁-C₆) アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、ジ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1~5 個の置換基を示す。} で表される基を挙げる事ができる。

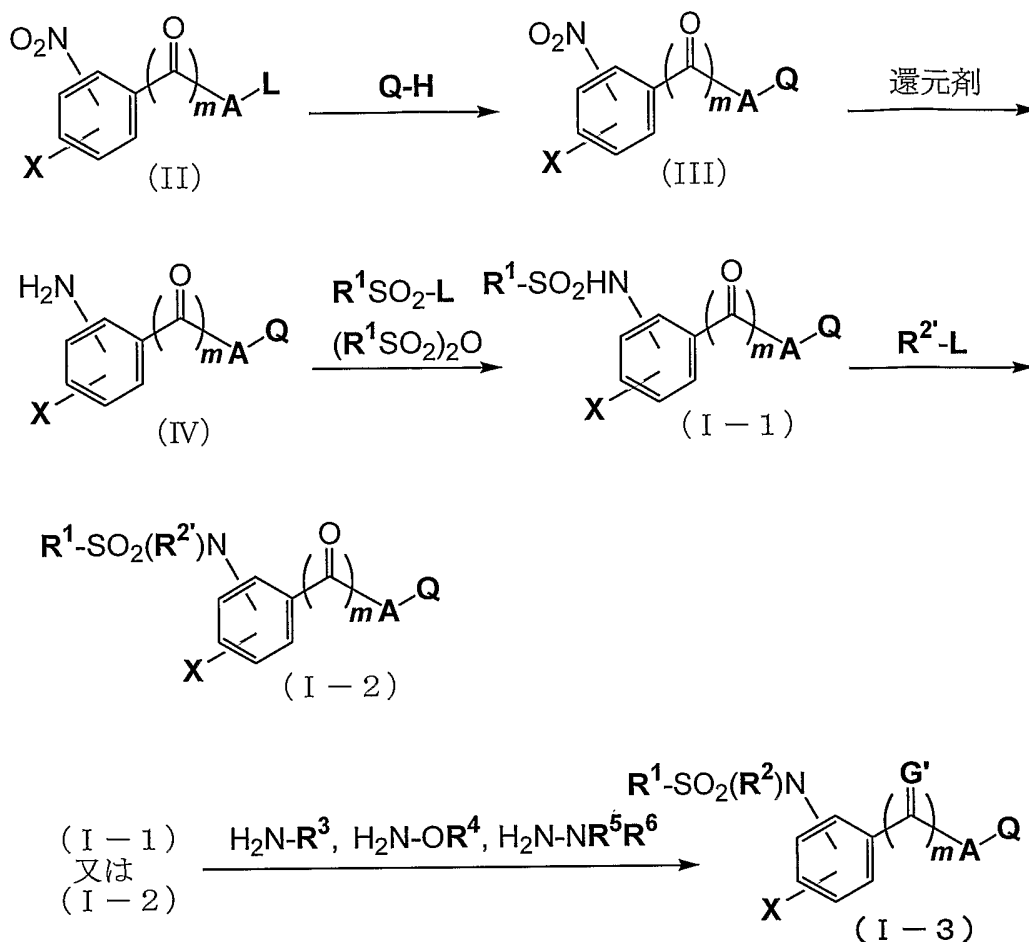
「複素環基」としては、例えばピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基、モルホリニル基等を挙げる事ができる。

本発明のハロアルキルスルホンアニリド誘導体の塩としては、農薬として適用するにあたり使用することができる塩であれば良く、例えば、リチウム塩、ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属との塩類、カルシウム、マグネシウム等のアルカリ土類との塩、鉄等の重金属との塩、その他アルミニウム、亜鉛等他の金属との塩等の無機金属類との塩類、アンモニウム塩等の有機塩基との塩類等を挙げる事ができ、これらは水和物を形成していても良い。

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

本発明のハロアルキルスルホンアニリド誘導体の好ましい態様としては、Q のヘテロ環としては、窒素原子を 1 ~ 4 個、酸素原子を 0 乃至 1 個及び硫黄原子を 0 乃至 1 個含む 5 員乃至 6 員ヘテロ環が良く、当該 5 員乃至 6 員ヘテロ環が縮合環を形成しているものも好ましい。特に好ましいのは Q-1、Q-2、Q-3 等である。Q 上の置換基として好適なものは、フェニル(C₁-C₆)アルキル基、置換フェニル(C₁-C₆)アルキル基、フェニル基、置換フェニル基、ピリジル基及び置換ピリジル基等である。R¹としてのハロアルキルは、フルオロメチルが好ましく、より好ましくはトリフルオロメチル又はジフルオロメチルが好ましく、その置換位置は 2 位が好ましい。R²は水素原子が好ましい。G 及び G¹は酸素原子が好ましい。m は 0 が好ましい。

本発明の一般式 (I) で表されるハロアルキルスルホンアミド誘導体は、例えば下記に図示する製造方法により製造することができる。
製造方法 1.



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 A 、 Q 、 X 及び m は前記に同じ。

$\text{R}^2\text{'}$ は $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ アルキル基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ アルキルカルボニル基、ハロ $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ アルキルカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は前記に同じ。)から選択される1以上の置換基を有するフェニルカルボニル基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ アルキルスルホニル基、ハロ $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ アルキルスルホニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y (Y は前記に同じ。)から選択される1以上の置換基を有するフェニルスルホニル基を示す。

10 G' は N-R^3 (式中、 R^3 は前記に同じ。)、 N-OR^4 (式中、 R^4 は前記に同じ。)又は $\text{N-NR}^5\text{R}^6$ (式中、 R^5 及び R^6 は前記に同じ。)を示す。

L はハロゲン原子等の脱離基を示す。)

一般式 (II) で表される化合物を塩基の存在下、必要に応じて相関移動触媒を用いて、不活性溶媒の存在下又は非存在下に一般式 Q-H で表されるヘテロ環と

反応させることにより一般式 (III) で表される化合物とし、該化合物を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下又は非存在下に還元剤等を反応させることにより、一般式 (IV) で表されるアミノ化合物とし、該化合物を単離し又は単離せずして、塩基の存在下、不活性溶媒の存在下又は非存在下に R^1SO_2-L (式中、 R^1 及びLは前記に同じ。) あるいは $(R^1SO_2)_2O$ (式中、 R^1 は前記に同じ。) で表されるハロアルキルスルホニル誘導体を反応させることにより、一般式 (I-1) で表される本発明化合物を製造することができる。更に一般式 (I-1) で表される化合物を単離し又は単離せずして、塩基の存在下、不活性溶媒の存在下又は非存在下に一般式 R^2-L (式中、 R^2 及びLは前記に同じ。) で表される化合物を反応させることにより、一般式 (I-2) で表される本発明化合物を製造することができる。更に一般式 (I-1) 又は (I-2) で表される化合物を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下又は非存在下に一般式 H_2N-R^3 (式中、 R^3 は前記に同じ。) で表されるアミン誘導体、 H_2N-OR^4 (式中、 R^4 は前記に同じ。) で表されるオキシム誘導体又は $H_2N-NR^5R^6$ (式中、 R^5 及び R^6 は前記に同じ。) で表されるヒドラジン誘導体を反応させることにより、一般式 (I-3) で表される本発明化合物を製造することができる。

(1-1). 一般式 (II) → 一般式 (III)

出発物質である一般式 (II) の化合物は例えば、J. Chem. Soc. , 684 (1942)、Indian J. Chem. , 11, 609 (1973)、Beilsteins Handbuch der Organischen Chemie, 7, 290等に記載の方法又はこれらに準じて製造することができる。Q-Hで表されるヘテロ環は例えば、2,3-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン誘導体はWO98-38176号公報等に記載の方法又はこれに準じて、テトラゾール誘導体はJ. Heterocycl. Chem. , 35 (2), 405 (1998)等に記載の方法又はこれに準じて製造することができ、その他のQ-Hで表されるヘテロ環は国際特許公開WO91-3470号公報、J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 22, 2644 (1973)、特開平9-100271号公報、Liebig's Annalen der Chemie, 675, 180 (1964)、J. Chem. Soc. (C), 747 (1967)、US

P 5 7 2 8 8 3 4 号公報、J. Heterocycl. Chem. , 2 2, 4 0 9 (1 9 8 5) 、
特開昭 6 0 - 1 4 6 8 7 9 号公報、特開平 6 - 3 0 6 0 6 1 号公報、特開昭 6 3
- 4 1 4 6 6 号公報、Doklady Akademii Nauk SSSR (Dokl. Akad. Nauk SSSR) ,
1 5 8, 1 3 5 8 (1 9 6 4) 、WO 9 8 - 1 1 0 7 9 号公報、Drug Research
5 (Drug res.) , (1) , 1 8 9 (1 9 6 8) 、J. Heterocycl. Chem. , 1 5
(7) , 1 2 3 1 (1 9 7 8) 、J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2, 1 6 7 0
(1 9 7 9) 、J. Am. Chem. Soc. , 8 0, 3 9 0 8 (1 9 5 8) 、Journal
fuer Praktische Chemie, 3 1 1, 4 7 7 (1 9 6 9) 、Chemische Berichte,
8 8, 1 3 5 1 (1 9 5 5) 等に記載の方法又はこれらに準じて製造することが
10 できる。

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

本反応で使用できる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピル
エチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] - 7-ウンデセン、ピリ
ジン等の含窒素有機塩基類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウ
ム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、金属ナトリウム等
25 の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の有機塩基類、ナトリウムエト
キシド、カリウム t-ブトキシド等のアルコラート類等を例示することができる。
塩基の使用量は反応により発生する酸を中和できるだけの量があれば良いが、過
剰量使用することもできる。

本反応で使用できる相関移動触媒としては、例えばテトラ n-ブチルアンモニ

ウムブロミド、ベンジルトリエチルアンモニウムブロミド等の4級アンモニウム塩、18-クラウン-6-エーテル等のクラウンエーテル類等を例示することができる。相関移動触媒の使用量は一般式(II)で表される化合物に対して0.01倍モルから0.5倍モルの範囲から適宜選択すれば良い。

- 5 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は -20°C 乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

- 10 反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離し、必要に応じて再結晶法、蒸留法、カラムクロマトグラフィー法等で精製することにより目的物を製造することができる。又、本反応終了後に目的物を単離せずに次の反応に供することもできる。

(1-2). 一般式(III) → 一般式(IV)

- 15 本反応で使用できる不活性溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、水等を例示することができる。これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。また、次に示す還元剤として使用する酸の水溶液をそのまま不活性溶媒として使用することもできる。

- 20 本反応で使用できる還元剤としては、金属-酸、金属-塩等を例示することができ、金属としては、例えば鉄、スズ、亜鉛等を、酸としては、例えば塩酸、硫酸等の鉱酸類、酢酸等の有機酸類、塩化スズ等を、塩としては、例えば塩化アンモニウム等を例示することができる。また、これらを組み合わせて使用することも可能である。

- 25 還元剤の使用量は一般式(III)で表される化合物に対して、金属は1~10倍モル、酸および塩は0.05~10倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。反応温度は 0°C 乃至 150°C の範囲から選択すれば良く、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

又、還元反応は触媒の存在下、接触水素添加法によっても行うことができ、触

媒としては、例えばパラジウム炭素、白金、ラネーニッケル等を例示することができる。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離し、必要に応じて再結晶法、蒸留法、カラムクロマトグラフィー法等で精製することにより目的物を製造することができる。又、本反応終了後に目的物を単離せずに次の反応に供することもできる。

(1-3). 一般式 (IV) → 一般式 (I-1)

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

本反応で使用できる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン、ピリジン等の含窒素有機塩基類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、金属ナトリウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の有機塩基類、ナトリウムエトキシド、カリウム *t*-ブトキシド等のアルコラート類等を例示することができる。又、ピリジン等の含窒素有機塩基類を溶媒として使用することもできる。塩基の使用量は反応により発生する酸を中和できるだけの量があれば良いが、過剰量使用することもできる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は-20°C乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等によ

り一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離し、必要に応じて再結晶法、蒸留法、カラムクロマトグラフィー法等で精製することにより目的物を製造することができる。又、本反応終了後に目的物を単離せずに次の反応に

5 供することもできる。

(1-4). 一般式(I-1) → 一般式(I-2)

本反応は(1-3). に準じて行うことができる。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離し、必要に応じて再結晶法、蒸留法、カラムクロマトグラフィー法等で精製することにより目的

10 物を製造することができる。又、本反応終了後に目的物を単離せずに次の反応に供することもできる。

(1-5). 一般式(I-1) 又は一般式(1-2) → 一般式(I-3)

本反応は、必要に応じて触媒量の酸の存在下に反応することもできる。

不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例
15 えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンの鎖状又は環状エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

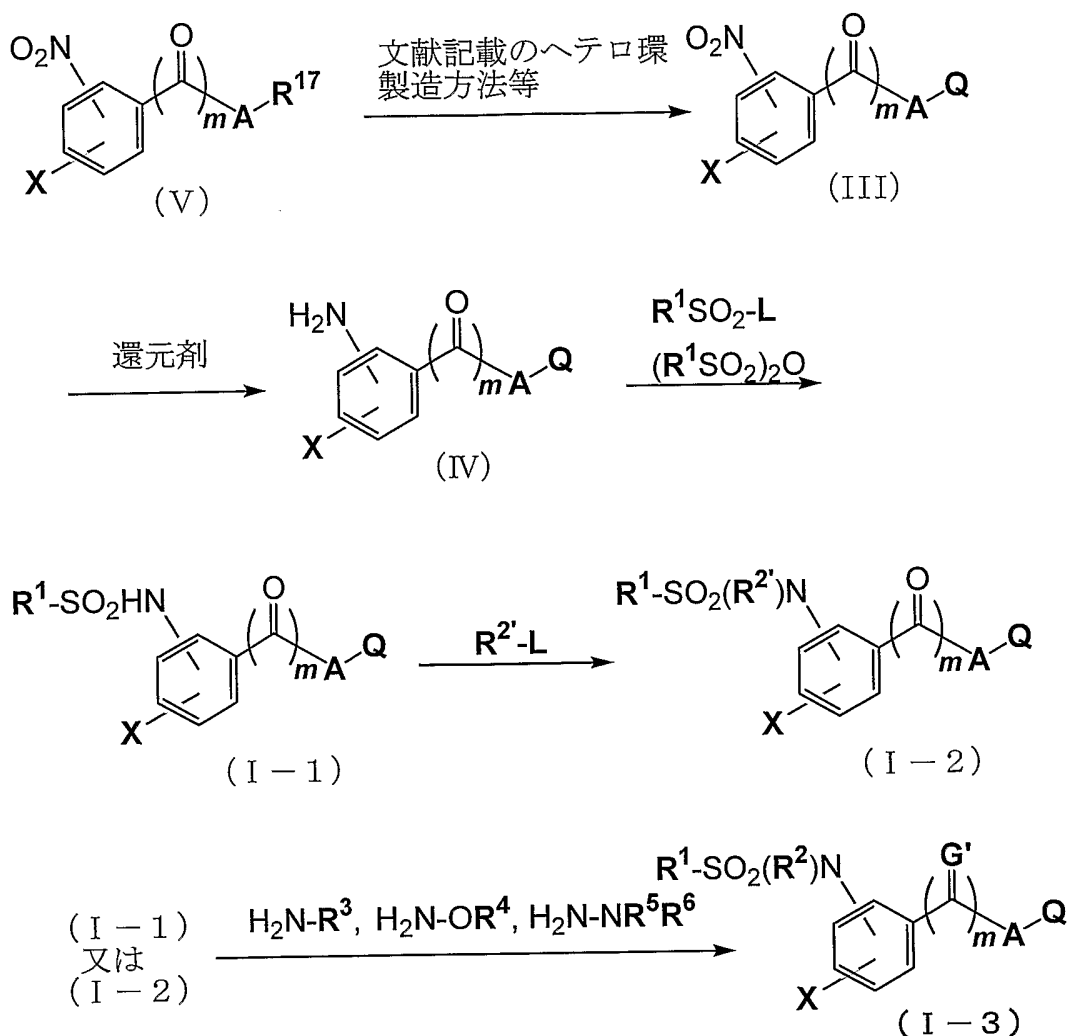
20 本反応で使用できる酸としては、例えば蟻酸、酢酸、プロピオン酸等の有機酸類、塩酸、硫酸等の鉱酸類を例示することができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は-20℃乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等によ

25 り一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

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

製造方法2.



(式中、 R^1 、 R^2 、 $\text{R}^{2'}$ 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 A 、 G' 、 L 、 Q 、 X 及び m は前記
5 す。)

一般式 (V) で表されるアミン誘導体、2-ヒドロキシエチルアミン誘導体又はヒドラジン誘導体を出発物質として、特開平8-151364号、Bull. Korean Chem. Soc. 22 (7), 761~764 (2001) 又はSynth. Commun., 16 (2), 163~167等に記載のヘテロ環合成法又はこれに準
10 じて化合物 (III) を製造し、該化合物を単離し又は単離せずして、製造方法1. と同じ方法で一般式 (I-1) ~ (I-3) で表される本発明化合物を製造することができる。

出発物質である一般式 (V) で表される化合物は例えば、J. Chem. Soc., 1

800 (1925)、J. Chem. Soc. , 2348 (1926) 等に記載の製造法又はこれに準じて製造することができる。

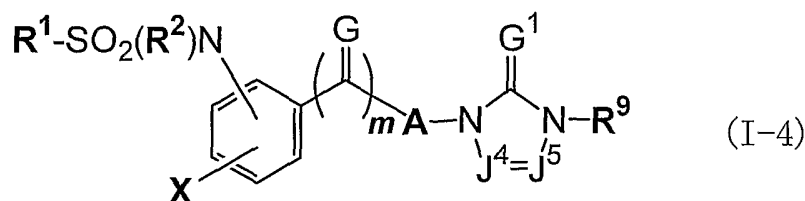
以下に本発明の一般式 (I) で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体の代表例を第1表乃至第13表に例示するが、本発明はこれらに限定されるもの
5 ではない。尚、物性は融点 (°C) 又は屈折率を示す。

以下の表において、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Pen」はペンチル基を、

「Hex」はヘキシル基を、「Ph」はフェニル基を、「Pyn」はピリジル基を、「Pym」はピリミジル基を、「Pyd」はピリダジル基を、「Ac」はア
10 セチル基を、「n-」はノルマルを、「i-」はイソを、「s-」はセカンダリ
ーを、「t-」はターシャリーを、「c-」は脂環式炭化水素基を示す。

「置換位置」とはハロアルキルスルホニルアミノ基の置換位置を示す。

一般式 (I-4)

第1表 (m=0、A=-CH₂-、G¹=O、J⁴=N)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
1-1	2	CF ₃	H	H	CH	Me	
1-2	2	CF ₃	H	H	CH	Et	87-88
1-3	2	CF ₃	H	H	CH	n-Pr	
1-4	2	CF ₃	H	H	CH	i-Pr	
1-5	2	CF ₃	H	H	CH	c-Pr	
1-6	2	CF ₃	H	H	CH	n-Bu	
1-7	2	CF ₃	H	H	CH	t-Bu	
1-8	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -Ph	130-132
1-9	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -(2-Cl-Ph)	
1-10	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -(3-Cl-Ph)	
1-11	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -(4-Cl-Ph)	
1-12	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -(2,6-Cl ₂ -Ph)	
1-13	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-Ph	
1-14	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-(2-Cl-Ph)	
1-15	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-(3-Cl-Ph)	
1-16	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-(4-Cl-Ph)	
1-17	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-(2,6-Cl ₂ -Ph)	
1-18	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
1-19	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -(2-Cl-Ph)	
1-20	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -(3-Cl-Ph)	
1-21	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -(4-Cl-Ph)	
1-22	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -(2,6-Cl ₂ -Ph)	
1-23	2	CF ₃	H	H	CH	Ph	141-142
1-24	2	CF ₃	H	H	CH	2-F-Ph	
1-25	2	CF ₃	H	H	CH	3-F-Ph	
1-26	2	CF ₃	H	H	CH	4-F-Ph	
1-27	2	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-Ph	129-131
1-28	2	CF ₃	H	H	CH	3-Cl-Ph	133-135
1-29	2	CF ₃	H	H	CH	4-Cl-Ph	171.8
1-30	2	CF ₃	H	H	CH	2-Br-Ph	128-130
1-31	2	CF ₃	H	H	CH	3-Br-Ph	
1-32	2	CF ₃	H	H	CH	4-Br-Ph	145-147

第1表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
1-33	2	CF ₃	H	H	CH	2-I-Ph	
1-34	2	CF ₃	H	H	CH	3-I-Ph	
1-35	2	CF ₃	H	H	CH	4-I-Ph	
1-36	2	CF ₃	H	H	CH	2-Me-Ph	51-53
1-37	2	CF ₃	H	H	CH	3-Me-Ph	
1-38	2	CF ₃	H	H	CH	4-Me-Ph	154-156
1-39	2	CF ₃	H	H	CH	2-Et-Ph	
1-40	2	CF ₃	H	H	CH	2-i-Pr-Ph	48-50
1-41	2	CF ₃	H	H	CH	2-OMe-Ph	140.6
1-42	2	CF ₃	H	H	CH	3-OMe-Ph	
1-43	2	CF ₃	H	H	CH	4-OMe-Ph	176-178
1-44	2	CF ₃	H	H	CH	2-SMe-Ph	125.8
1-45	2	CF ₃	H	H	CH	3-SMe-Ph	
1-46	2	CF ₃	H	H	CH	4-SMe-Ph	
1-47	2	CF ₃	H	H	CH	2-SOMe-Ph	50-52
1-48	2	CF ₃	H	H	CH	3-SOMe-Ph	
1-49	2	CF ₃	H	H	CH	4-SOMe-Ph	
1-50	2	CF ₃	H	H	CH	2-SO ₂ Me-Ph	165-167
1-51	2	CF ₃	H	H	CH	3-SO ₂ Me-Ph	
1-52	2	CF ₃	H	H	CH	4-SO ₂ Me-Ph	
1-53	2	CF ₃	H	H	CH	2-NO ₂ -Ph	
1-54	2	CF ₃	H	H	CH	3-NO ₂ -Ph	
1-55	2	CF ₃	H	H	CH	4-NO ₂ -Ph	
1-56	2	CF ₃	H	H	CH	2-CN-Ph	
1-57	2	CF ₃	H	H	CH	3-CN-Ph	
1-58	2	CF ₃	H	H	CH	4-CN-Ph	
1-59	2	CF ₃	H	H	CH	2-CF ₃ -Ph	123-125
1-60	2	CF ₃	H	H	CH	3-CF ₃ -Ph	
1-61	2	CF ₃	H	H	CH	4-CF ₃ -Ph	
1-62	2	CF ₃	H	H	CH	2-OCF ₃ -Ph	
1-63	2	CF ₃	H	H	CH	3-OCF ₃ -Ph	
1-64	2	CF ₃	H	H	CH	4-OCF ₃ -Ph	
1-65	2	CF ₃	H	H	CH	2-SCF ₃ -Ph	
1-66	2	CF ₃	H	H	CH	3-SCF ₃ -Ph	
1-67	2	CF ₃	H	H	CH	4-SCF ₃ -Ph	
1-68	2	CF ₃	H	H	CH	2-SOCF ₃ -Ph	
1-69	2	CF ₃	H	H	CH	3-SOCF ₃ -Ph	
1-70	2	CF ₃	H	H	CH	4-SOCF ₃ -Ph	
1-71	2	CF ₃	H	H	CH	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1-72	2	CF ₃	H	H	CH	3-SO ₂ CF ₃ -Ph	

第1表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
1-73	2	CF ₃	H	H	CH	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1-74	2	CF ₃	H	H	CH	2-CO ₂ H-Ph	
1-75	2	CF ₃	H	H	CH	3-CO ₂ H-Ph	
1-76	2	CF ₃	H	H	CH	4-CO ₂ H-Ph	
1-77	2	CF ₃	H	H	CH	2-CO ₂ Me-Ph	
1-78	2	CF ₃	H	H	CH	3-CO ₂ Me-Ph	
1-79	2	CF ₃	H	H	CH	4-CO ₂ Me-Ph	
1-80	2	CF ₃	H	H	CH	2-Ph-Ph	
1-81	2	CF ₃	H	H	CH	4-PhO-Ph	44-46
1-82	2	CF ₃	H	H	CH	2, 4-F ₂ -Ph	
1-83	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-F ₂ -Ph	
1-84	2	CF ₃	H	H	CH	2, 3-Cl ₂ -Ph	140-142
1-85	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-86	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Br ₂ -Ph	
1-87	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-I ₂ -Ph	
1-88	2	CF ₃	H	H	CH	2-Me-3-Cl-Ph	136-137
1-89	2	CF ₃	H	H	CH	2-Me-4-Br-Ph	174-176
1-90	2	CF ₃	H	H	CH	3-Me-4-Br-Ph	136-138
1-91	2	CF ₃	H	H	CH	2, 3-Me ₂ -Ph	66-68
1-92	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	193-195
1-93	2	CF ₃	H	H	CH	2, 3-(CH ₂) ₄ -Ph	127-128
1-94	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Et ₂ -Ph	126-128
1-95	2	CF ₃	H	H	CH	2-Me-4-OMe-Ph	154-156
1-96	2	CF ₃	H	H	CH	2, 3-(OMe) ₂ -Ph	
1-97	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
1-98	2	CF ₃	H	H	CH	2, 4-(CF ₃) ₂ -Ph	
1-99	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
1-100	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
1-101	2	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-6-F-Ph	
1-102	2	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-6-Me-Ph	154-155
1-103	2	CF ₃	H	H	CH	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	166-168
1-104	2	CF ₃	H	H	CH	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
1-105	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
1-106	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
1-107	2	CF ₃	H	H	CH	2, 4, 6-Me ₃ -Ph	193-195
1-108	2	CF ₃	H	H	CH	2-Pyn	104-106
1-109	2	CF ₃	H	H	CH	3-Pyn	
1-110	2	CF ₃	H	H	CH	4-Pyn	
1-111	2	CF ₃	H	H	CH	6-Cl-2-Pyn	
1-112	2	CF ₃	H	H	CH	5-CF ₃ -2-Pyn	56-58

第1表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
1-113	2	CF ₃	H	H	CH	6-CF ₃ -2-Pyn	
1-114	2	CF ₃	H	H	CH	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
1-115	2	CF ₃	H	H	CH	2-Pym	
1-116	2	CF ₃	H	H	CH	4-Pym	
1-117	2	CF ₃	H	H	CH	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
1-118	2	CF ₃	H	H	CH	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
1-119	2	CF ₃	H	H	CH	3-Pyd	
1-120	2	CF ₃	H	H	CH	6-Cl-3-Pyd	
1-121	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-NHMe	
1-122	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-NHPh	
1-123	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-NMePh	1. 5202 (28°C)
1-124	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-N(i-Pr) (2, 4-F ₂ -Ph)	183. 5-184. 4
1-125	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-N(i-Pr) ₂	
1-126	2	CF ₃	Me	H	CH	Ph	
1-127	2	CF ₃	Me	H	CH	2-Cl-Ph	
1-128	2	CF ₃	Me	H	CH	3-Cl-Ph	
1-129	2	CF ₃	Me	H	CH	4-Cl-Ph	
1-130	2	CF ₃	Me	H	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-131	2	CF ₃	Me	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-132	2	CF ₃	Me	H	CH	-CH ₂ -Ph	
1-133	2	CF ₃	Me	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
1-134	2	CF ₃	COMe	H	CH	Ph	
1-135	2	CF ₃	COMe	H	CH	2-Cl-Ph	
1-136	2	CF ₃	COMe	H	CH	3-Cl-Ph	
1-137	2	CF ₃	COMe	H	CH	4-Cl-Ph	
1-138	2	CF ₃	COMe	H	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-139	2	CF ₃	COMe	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-140	2	CF ₃	COMe	H	CH	-CH ₂ -Ph	
1-141	2	CF ₃	COMe	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
1-142	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	Ph	
1-143	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	2-Cl-Ph	
1-144	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	3-Cl-Ph	
1-145	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	4-Cl-Ph	
1-146	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-147	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-148	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	-CH ₂ -Ph	
1-149	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
1-150	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	Ph	
1-151	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	2-Cl-Ph	

第1表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
1-152	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	3-Cl-Ph	
1-153	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	4-Cl-Ph	
1-154	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-155	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-156	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	-CH ₂ -Ph	
1-157	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
1-158	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	Ph	
1-159	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2-Cl-Ph	
1-160	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	3-Cl-Ph	
1-161	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	4-Cl-Ph	
1-162	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2-Me-Ph	
1-163	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2-CF ₃ -Ph	
1-164	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-165	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	167-169
1-166	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2-Cl-6-F-Ph	
1-167	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2-Cl-6-Me-Ph	
1-168	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	-CH ₂ -Ph	
1-169	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	-CMe ₂ -Ph	
1-170	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	Ph	
1-171	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2-Cl-Ph	
1-172	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	3-Cl-Ph	
1-173	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	4-Cl-Ph	
1-174	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2-Me-Ph	
1-175	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2-CF ₃ -Ph	
1-176	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-177	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	167-169
1-178	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2-Cl-6-F-Ph	
1-179	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2-Cl-6-Me-Ph	
1-180	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	-CH ₂ -Ph	
1-181	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	-CMe ₂ -Ph	
1-182	2	CF ₃	H	H	C-Me	Me	
1-183	2	CF ₃	H	H	C-Me	Et	89.1
1-184	2	CF ₃	H	H	C-Me	n-Pr	
1-185	2	CF ₃	H	H	C-Me	i-Pr	
1-186	2	CF ₃	H	H	C-Me	c-Pr	
1-187	2	CF ₃	H	H	C-Me	n-Bu	
1-188	2	CF ₃	H	H	C-Me	t-Bu	
1-189	2	CF ₃	H	H	C-Me	c-Hex	52-54
1-190	2	CF ₃	H	H	C-Me	-CH ₂ -Ph	43-45
1-191	2	CF ₃	H	H	C-Me	-CMe ₂ -Ph	

第1表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
1-192	2	CF ₃	H	H	C-Me	Ph	1.5476 (23°C)
1-193	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Cl-Ph	51-53
1-194	2	CF ₃	H	H	C-Me	3-Cl-Ph	
1-195	2	CF ₃	H	H	C-Me	4-Cl-Ph	
1-196	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Me-Ph	
1-197	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-CF ₃ -Ph	
1-198	2	CF ₃	H	H	C-Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	186-188
1-199	2	CF ₃	H	H	C-Me	2, 6-Me ₂ -Ph	191-193
1-200	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Cl-6-F-Ph	
1-201	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Cl-6-Me-Ph	
1-202	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Pyn	
1-203	2	CF ₃	H	H	C-Me	3-Pyn	
1-204	2	CF ₃	H	H	C-Me	4-Pyn	
1-205	2	CF ₃	H	H	C-Me	6-Cl-2-Pyn	
1-206	2	CF ₃	H	H	C-Me	5-CF ₃ -2-Pyn	
1-207	2	CF ₃	H	H	C-Me	6-CF ₃ -2-Pyn	
1-208	2	CF ₃	H	H	C-Me	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
1-209	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Pym	
1-210	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Pym	
1-211	2	CF ₃	H	H	C-Me	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
1-212	2	CF ₃	H	H	C-Me	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
1-213	2	CF ₃	H	H	C-Me	3-Pyd	
1-214	2	CF ₃	H	H	C-Me	6-Cl-3-Pyd	
1-215	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	Me	78.3-84.7
1-216	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	t-Bu	
1-217	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	-CH ₂ -Ph	
1-218	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	-CMe ₂ -Ph	
1-219	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	Ph	
1-220	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-Cl-Ph	
1-221	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	3-Cl-Ph	
1-222	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	4-Cl-Ph	
1-223	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-Me-Ph	
1-224	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
1-225	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-226	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-227	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-Cl-6-F-Ph	
1-228	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-Cl-6-Me-Ph	
1-229	2	CF ₃	H	H	C-Cl	Me	
1-230	2	CF ₃	H	H	C-Cl	t-Bu	
1-231	2	CF ₃	H	H	C-Cl	-CH ₂ -Ph	

第1表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
1-232	2	CF ₃	H	H	C-Cl	-CMe ₂ -Ph	
1-233	2	CF ₃	H	H	C-Cl	Ph	
1-234	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2-Cl-Ph	
1-235	2	CF ₃	H	H	C-Cl	3-Cl-Ph	
1-236	2	CF ₃	H	H	C-Cl	4-Cl-Ph	
1-237	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2-Me-Ph	49-51
1-238	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2-CF ₃ -Ph	
1-239	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2,6-Cl ₂ -Ph	
1-240	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2,6-Me ₂ -Ph	
1-241	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2-Cl-6-F-Ph	
1-242	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2-Cl-6-Me-Ph	
1-243	2	CF ₃	H	H	C-Br	Me	
1-244	2	CF ₃	H	H	C-Br	t-Bu	
1-245	2	CF ₃	H	H	C-Br	-CH ₂ -Ph	45-48
1-246	2	CF ₃	H	H	C-Br	-CMe ₂ -Ph	
1-247	2	CF ₃	H	H	C-Br	Ph	
1-248	2	CF ₃	H	H	C-Br	2-Cl-Ph	
1-249	2	CF ₃	H	H	C-Br	3-Cl-Ph	
1-250	2	CF ₃	H	H	C-Br	4-Cl-Ph	
1-251	2	CF ₃	H	H	C-Br	2-Me-Ph	57-60
1-252	2	CF ₃	H	H	C-Br	2-CF ₃ -Ph	
1-253	2	CF ₃	H	H	C-Br	2,6-Cl ₂ -Ph	
1-254	2	CF ₃	H	H	C-Br	2,6-Me ₂ -Ph	176-178
1-255	2	CF ₃	H	H	C-Br	2-Cl-6-F-Ph	
1-256	2	CF ₃	H	H	C-Br	2-Cl-6-Me-Ph	
1-257	2	CF ₃	H	H	C-OMe	Ph	NMR-1
1-258	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2-Cl-Ph	48-50
1-259	2	CF ₃	H	H	C-OMe	3-Cl-Ph	
1-260	2	CF ₃	H	H	C-OMe	4-Cl-Ph	
1-261	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2,6-Cl ₂ -Ph	
1-262	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2,6-Me ₂ -Ph	
1-263	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2-Cl-6-F-Ph	
1-264	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2-Cl-6-Me-Ph	
1-265	2	CF ₃	H	H	C-SMe	Ph	1. 5518 (23°C)
1-266	2	CF ₃	H	H	C-SMe	2-Cl-Ph	58-60
1-267	2	CF ₃	H	H	C-SMe	3-Cl-Ph	
1-268	2	CF ₃	H	H	C-SMe	4-Cl-Ph	121-123
1-269	2	CF ₃	H	H	C-SMe	2,6-Cl ₂ -Ph	
1-270	2	CF ₃	H	H	C-SMe	2,6-Me ₂ -Ph	
1-271	2	CF ₃	H	H	C-SMe	2-Cl-6-F-Ph	

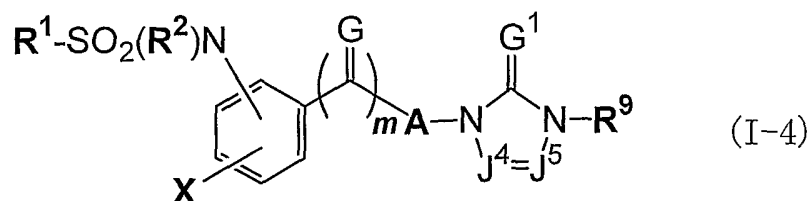
第1表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
1-272	2	CF ₃	H	H	C-SMe	2-Cl-6-Me-Ph	
1-273	2	CF ₃	H	H	C-SCHF ₂	Ph	49-51
1-274	2	CF ₃	H	H	C-SCHF ₂	2-Cl-Ph	
1-275	2	CF ₃	H	H	C-SCHF ₂	3-Cl-Ph	
1-276	2	CF ₃	H	H	C-SCHF ₂	4-Cl-Ph	
1-277	2	CF ₃	H	H	C-SCHF ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-278	2	CF ₃	H	H	C-SCHF ₂	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-279	2	CF ₃	H	H	C-SOMe	Ph	69-71
1-280	2	CF ₃	H	H	C-SOMe	2-Cl-Ph	
1-281	2	CF ₃	H	H	C-SOMe	3-Cl-Ph	
1-282	2	CF ₃	H	H	C-SOMe	4-Cl-Ph	149-150
1-283	2	CF ₃	H	H	C-SOMe	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-284	2	CF ₃	H	H	C-SOMe	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-285	2	CF ₃	H	H	C-SO ₂ Me	Ph	70-72
1-286	2	CF ₃	H	H	C-SO ₂ Me	2-Cl-Ph	154-156
1-287	2	CF ₃	H	H	C-SO ₂ Me	3-Cl-Ph	
1-288	2	CF ₃	H	H	C-SO ₂ Me	4-Cl-Ph	141-143
1-289	2	CF ₃	H	H	C-SO ₂ Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-290	2	CF ₃	H	H	C-SO ₂ Me	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-291	2	CF ₃	H	H	C-Ph	Et	142-144
1-292	2	CF ₃	H	H	C-Ph	Ph	159-160
1-293	2	CF ₃	H	H	C-Ph	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-294	2	CF ₃	H	H	C-Ph	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-295	3	CF ₃	H	H	CH	Me	
1-296	3	CF ₃	H	H	CH	t-Bu	
1-297	3	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -Ph	
1-298	3	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
1-299	3	CF ₃	H	H	CH	Ph	
1-300	3	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-Ph	
1-301	3	CF ₃	H	H	CH	3-Cl-Ph	
1-302	3	CF ₃	H	H	CH	4-Cl-Ph	
1-303	3	CF ₃	H	H	CH	2-Me-Ph	
1-304	3	CF ₃	H	H	CH	2-CF ₃ -Ph	
1-305	3	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-306	3	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-307	3	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-6-F-Ph	
1-308	3	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-6-Me-Ph	
1-309	4	CF ₃	H	H	CH	Me	
1-310	4	CF ₃	H	H	CH	t-Bu	
1-311	4	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -Ph	

第1表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
1-312	4	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
1-313	4	CF ₃	H	H	CH	Ph	
1-314	4	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-Ph	
1-315	4	CF ₃	H	H	CH	3-Cl-Ph	
1-316	4	CF ₃	H	H	CH	4-Cl-Ph	
1-317	4	CF ₃	H	H	CH	2-Me-Ph	
1-318	4	CF ₃	H	H	CH	2-CF ₃ -Ph	
1-319	4	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
1-320	4	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	
1-321	4	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-6-F-Ph	
1-322	4	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-6-Me-Ph	
1-323	2	CF ₃	H	H	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)- Ph	136-138
1-324	2	CF ₃	H	H	CH	2-Me-4-(4-CF ₃ - Ph)-Ph	65-67
1-325	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2-Pyn	46-48
1-326	2	CF ₃	H	H	C-Br	2, 3-Cl ₂ -Ph	143-145
1-327	2	CF ₃	H	H	CH	2-(1-Me-n- C ₅ H ₁₁)-Ph	1. 5226 (28 °C)
1-328	2	CF ₃	H	H	CH	c-Hex	114-116

一般式 (I-4)

第2表 (m=0、A=-CH₂-、G¹=O、J⁵=N)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁴	R ⁹	物性 [融点(°C)]
2-1	2	CF ₃	H	H	CH	Me	
2-2	2	CF ₃	H	H	CH	Et	
2-3	2	CF ₃	H	H	CH	n-Pr	
2-4	2	CF ₃	H	H	CH	i-Pr	
2-5	2	CF ₃	H	H	CH	c-Pr	
2-6	2	CF ₃	H	H	CH	n-Bu	
2-7	2	CF ₃	H	H	CH	t-Bu	
2-8	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -Ph	104.2
2-9	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -(2-Cl-Ph)	49.8
2-10	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -(3-Cl-Ph)	
2-11	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -(4-Cl-Ph)	
2-12	2	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -(2,6-Cl ₂ -Ph)	136.6-138.1
2-13	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-Ph	
2-14	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-(2-Cl-Ph)	
2-15	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-(3-Cl-Ph)	
2-16	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-(4-Cl-Ph)	
2-17	2	CF ₃	H	H	CH	-CHMe-(2,6-Cl ₂ -Ph)	
2-18	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
2-19	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -(2-Cl-Ph)	
2-20	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -(3-Cl-Ph)	
2-21	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -(4-Cl-Ph)	
2-22	2	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -(2,6-Cl ₂ -Ph)	
2-23	2	CF ₃	H	H	CH	Ph	94.2
2-24	2	CF ₃	H	H	CH	2-F-Ph	161.3
2-25	2	CF ₃	H	H	CH	3-F-Ph	
2-26	2	CF ₃	H	H	CH	4-F-Ph	
2-27	2	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-Ph	187.9
2-28	2	CF ₃	H	H	CH	3-Cl-Ph	113.2-120.8
2-29	2	CF ₃	H	H	CH	4-Cl-Ph	175.6
2-30	2	CF ₃	H	H	CH	2-Br-Ph	118.3
2-31	2	CF ₃	H	H	CH	3-Br-Ph	

第2表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
2-32	2	CF ₃	H	H	CH	4-Br-Ph	
2-33	2	CF ₃	H	H	CH	2-I-Ph	
2-34	2	CF ₃	H	H	CH	3-I-Ph	
2-35	2	CF ₃	H	H	CH	4-I-Ph	
2-36	2	CF ₃	H	H	CH	2-Me-Ph	186.7
2-37	2	CF ₃	H	H	CH	3-Me-Ph	123.0-131.7
2-38	2	CF ₃	H	H	CH	4-Me-Ph	136.5-142.9
2-39	2	CF ₃	H	H	CH	2-Et-Ph	
2-40	2	CF ₃	H	H	CH	2-i-Pr-Ph	
2-41	2	CF ₃	H	H	CH	2-OMe-Ph	170
2-42	2	CF ₃	H	H	CH	3-OMe-Ph	
2-43	2	CF ₃	H	H	CH	4-OMe-Ph	145.9
2-44	2	CF ₃	H	H	CH	2-SMe-Ph	
2-45	2	CF ₃	H	H	CH	2-SOMe-Ph	
2-46	2	CF ₃	H	H	CH	2-SO ₂ Me-Ph	
2-47	2	CF ₃	H	H	CH	2-CN-Ph	
2-48	2	CF ₃	H	H	CH	4-CN-Ph	
2-49	2	CF ₃	H	H	CH	2-NO ₂ -Ph	
2-50	2	CF ₃	H	H	CH	4-NO ₂ -Ph	
2-51	2	CF ₃	H	H	CH	2-CF ₃ -Ph	179.3
2-52	2	CF ₃	H	H	CH	3-CF ₃ -Ph	
2-53	2	CF ₃	H	H	CH	4-CF ₃ -Ph	
2-54	2	CF ₃	H	H	CH	2-OCF ₃ -Ph	
2-55	2	CF ₃	H	H	CH	3-OCF ₃ -Ph	
2-56	2	CF ₃	H	H	CH	4-OCF ₃ -Ph	
2-57	2	CF ₃	H	H	CH	2-SCF ₃ -Ph	
2-58	2	CF ₃	H	H	CH	2-SOCF ₃ -Ph	
2-59	2	CF ₃	H	H	CH	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
2-60	2	CF ₃	H	H	CH	2-CO ₂ H-Ph	252.9-259.5
2-61	2	CF ₃	H	H	CH	2-CO ₂ Me-Ph	158.4-159.2
2-62	2	CF ₃	H	H	CH	2-Ph-Ph	
2-63	2	CF ₃	H	H	CH	2,5-F ₂ -Ph	161.6-162.1
2-64	2	CF ₃	H	H	CH	2,6-F ₂ -Ph	169.1-169.6
2-65	2	CF ₃	H	H	CH	2,3-Cl ₂ -Ph	206.6
2-66	2	CF ₃	H	H	CH	2,4-Cl ₂ -Ph	177.5
2-67	2	CF ₃	H	H	CH	2,5-Cl ₂ -Ph	126.8-129.2
2-68	2	CF ₃	H	H	CH	2,6-Cl ₂ -Ph	174.5-177.1
2-69	2	CF ₃	H	H	CH	3,4-Cl ₂ -Ph	132.8-137.6
2-70	2	CF ₃	H	H	CH	2,4-F ₂ -Ph	175.9
2-71	2	CF ₃	H	H	CH	2,6-Br ₂ -Ph	204.0-205.6

第2表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
2-72	2	CF ₃	H	H	CH	3-Cl-4-Me-Ph	146
2-73	2	CF ₃	H	H	CH	2, 3-Me ₂ -Ph	212.0-216.4
2-74	2	CF ₃	H	H	CH	2, 4-Me ₂ -Ph	
2-75	2	CF ₃	H	H	CH	3-Cl-4-Me-Ph	146.0
2-76	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	163.7-165.3
2-77	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Et ₂ -Ph	
2-78	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
2-79	2	CF ₃	H	H	CH	2-Me-4-i-C ₃ F ₇ -Ph	91.1-120.6
2-80	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
2-81	2	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-6-Me-Ph	158.3-163.1
2-82	2	CF ₃	H	H	CH	2, 3, 5, 6-F ₄ -Ph	157.2-160.2
2-83	2	CF ₃	H	H	CH	2, 3, 4, 5, 6-F ₅ -Ph	180.9-181.2
2-84	2	CF ₃	H	H	CH	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
2-85	2	CF ₃	H	H	CH	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	171.1-171.2
2-86	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	124.2
2-87	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	108.1
2-88	2	CF ₃	H	H	CH	2, 6-Br ₂ -4-F-Ph	170.5-173.2
2-89	2	CF ₃	H	H	CH	2-Pyn	
2-90	2	CF ₃	H	H	CH	3-Pyn	
2-91	2	CF ₃	H	H	CH	4-Pyn	
2-92	2	CF ₃	H	H	CH	6-Cl-2-Pyn	64.9-68.6
2-93	2	CF ₃	H	H	CH	3, 5-Cl ₂ -2-Pyn	157.9-158.5
2-94	2	CF ₃	H	H	CH	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	52.1-63.0
2-95	2	CF ₃	H	H	CH	2-Pym	
2-96	2	CF ₃	H	H	CH	4-Pym	
2-97	2	CF ₃	H	H	CH	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
2-98	2	CF ₃	H	H	CH	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	226.3-226.6
2-99	2	CF ₃	H	H	CH	3-Pyd	
2-100	2	CF ₃	H	H	CH	6-Cl-3-Pyd	
2-101	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-NHMe	
2-102	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-NHPh	
2-103	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-NMePh	
2-104	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-NEt (c-Hex)	
2-105	2	CF ₃	H	H	CH	-CO-N(i-Pr) ₂	
2-106	2	CF ₃	Me	H	CH	Ph	
2-107	2	CF ₃	Me	H	CH	2-Cl-Ph	
2-108	2	CF ₃	Me	H	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
2-109	2	CF ₃	Me	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	
2-110	2	CF ₃	Me	H	CH	-CH ₂ -Ph	
2-111	2	CF ₃	Me	H	CH	-CMe ₂ -Ph	

第2表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
2-112	2	CF ₃	COMe	H	CH	Ph	
2-113	2	CF ₃	COMe	H	CH	2-Cl-Ph	
2-114	2	CF ₃	COMe	H	CH	2,6-Cl ₂ -Ph	
2-115	2	CF ₃	COMe	H	CH	2,6-Me ₂ -Ph	
2-116	2	CF ₃	COMe	H	CH	-CH ₂ -Ph	
2-117	2	CF ₃	COMe	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
2-118	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	Ph	
2-119	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	2-Cl-Ph	
2-120	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	2,6-Cl ₂ -Ph	
2-121	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	2,6-Me ₂ -Ph	
2-122	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	-CH ₂ -Ph	
2-123	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
2-124	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	Ph	
2-125	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	2-Cl-Ph	
2-126	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	2,6-Cl ₂ -Ph	
2-127	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	2,6-Me ₂ -Ph	
2-128	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	-CH ₂ -Ph	
2-129	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
2-130	2	CF ₃	H	5-Me	CH	Ph	91.7-106.2
2-131	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	Ph	
2-132	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2-Cl-Ph	
2-133	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2,6-Cl ₂ -Ph	
2-134	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2-Cl-6-F-Ph	
2-135	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2,6-Me ₂ -Ph	
2-136	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	2-Cl-6-Me-Ph	
2-137	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	-CH ₂ -Ph	
2-138	2	CF ₃	H	4-Cl	CH	-CMe ₂ -Ph	
2-139	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	Ph	
2-140	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2-Cl-Ph	
2-141	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2,6-Cl ₂ -Ph	
2-142	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2-Cl-6-F-Ph	
2-143	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2,6-Me ₂ -Ph	
2-144	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	2-Cl-6-Me-Ph	
2-145	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	-CH ₂ -Ph	
2-146	2	CF ₃	H	5-Cl	CH	-CMe ₂ -Ph	
2-147	3	CF ₃	H	H	CH	Me	
2-148	3	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -Ph	
2-149	3	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
2-150	3	CF ₃	H	H	CH	Ph	
2-151	3	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-Ph	

第2表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
2-152	3	CF ₃	H	H	CH	2-CF ₃ -Ph	
2-153	3	CF ₃	H	H	CH	2,6-Cl ₂ -Ph	
2-154	3	CF ₃	H	H	CH	2,6-Me ₂ -Ph	
2-155	4	CF ₃	H	H	CH	Me	
2-156	4	CF ₃	H	H	CH	-CH ₂ -Ph	
2-157	4	CF ₃	H	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
2-158	4	CF ₃	H	H	CH	Ph	
2-159	4	CF ₃	H	H	CH	2-Cl-Ph	
2-160	4	CF ₃	H	H	CH	2-CF ₃ -Ph	
2-161	4	CF ₃	H	H	CH	2,6-Cl ₂ -Ph	
2-162	4	CF ₃	H	H	CH	2,6-Me ₂ -Ph	
2-163	2	CHF ₂	H	H	CH	t-Bu	
2-164	2	CHF ₂	H	H	CH	-CH ₂ -Ph	
2-165	2	CHF ₂	H	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
2-166	2	CHF ₂	H	H	CH	Ph	
2-167	2	CHF ₂	H	H	CH	2-Cl-Ph	188.1
2-168	2	CHF ₂	H	H	CH	2-OMe-Ph	
2-169	2	CHF ₂	H	H	CH	2-CF ₃ -Ph	176.7-182.1
2-170	2	CHF ₂	H	H	CH	2-OCF ₃ -Ph	
2-171	2	CHF ₂	H	H	CH	2,6-Cl ₂ -Ph	
2-172	2	CHF ₂	H	H	CH	2,6-Me ₂ -Ph	
2-173	2	CF ₃	H	H	C-Me	t-Bu	
2-174	2	CF ₃	H	H	C-Me	-CH ₂ -Ph	
2-175	2	CF ₃	H	H	C-Me	-CMe ₂ -Ph	
2-176	2	CF ₃	H	H	C-Me	Ph	180.6
2-177	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Cl-Ph	1.5532(24°C)
2-178	2	CF ₃	H	H	C-Me	3-Cl-Ph	
2-179	2	CF ₃	H	H	C-Me	4-Cl-Ph	
2-180	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Me-Ph	
2-181	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-OMe-Ph	
2-182	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-CF ₃ -Ph	
2-183	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-OCF ₃ -Ph	
2-184	2	CF ₃	H	H	C-Me	2,6-Cl ₂ -Ph	223.5
2-185	2	CF ₃	H	H	C-Me	2,4,6-Cl ₃ -Ph	175.7
2-186	2	CF ₃	H	H	C-Me	2,6-Me ₂ -Ph	161.5
2-187	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Cl-6-Me-Ph	
2-188	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Pyn	
2-189	2	CF ₃	H	H	C-Me	3-Pyn	
2-190	2	CF ₃	H	H	C-Me	4-Pyn	
2-191	2	CF ₃	H	H	C-Me	6-Cl ₂ -Pyn	

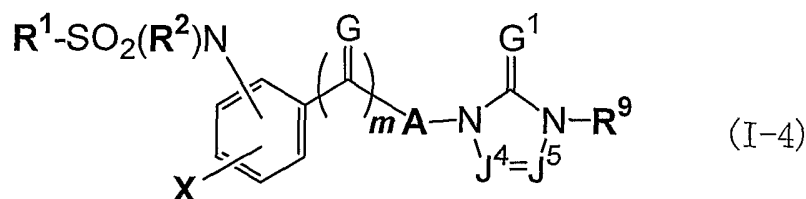
第2表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
2-192	2	CF ₃	H	H	C-Me	6-CF ₃ -2-Pyn	
2-193	2	CF ₃	H	H	C-Me	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
2-194	2	CF ₃	H	H	C-Me	2-Pym	
2-195	2	CF ₃	H	H	C-Me	4-Pym	
2-196	2	CF ₃	H	H	C-Me	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
2-197	2	CF ₃	H	H	C-Me	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
2-198	2	CF ₃	H	H	C-Me	3-Pyd	
2-199	2	CF ₃	H	H	C-Me	6-Cl-3-Pyd	
2-200	2	CF ₃	H	H	C-Me	-CO-NHMe	
2-201	2	CF ₃	H	H	C-Me	-CO-NHPh	
2-202	2	CF ₃	H	H	C-Me	-CO-NMePh	
2-203	2	CF ₃	H	H	C-Me	-CO-NEt (c-Hex)	
2-204	2	CF ₃	H	H	C-Me	-CO-N(i-Pr) ₂	
2-205	2	CF ₃	Et	H	C-Me	Ph	124. 3
2-206	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	t-Bu	
2-207	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	-CH ₂ -Ph	
2-208	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	-CMe ₂ -Ph	
2-209	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	Ph	120. 3
2-210	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-Cl-Ph	
2-211	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
2-212	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-OCF ₃ -Ph	
2-213	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2, 6-Cl ₂ -Ph	
2-214	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-Cl-6-F-Ph	
2-215	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2, 6-Me ₂ -Ph	
2-216	2	CF ₃	H	H	C-CF ₃	2-Cl-6-Me-Ph	
2-217	2	CF ₃	H	H	C-OMe	Me	
2-218	2	CF ₃	H	H	C-OMe	t-Bu	
2-219	2	CF ₃	H	H	C-OMe	-CH ₂ -Ph	
2-220	2	CF ₃	H	H	C-OMe	-CMe ₂ -Ph	
2-221	2	CF ₃	H	H	C-OMe	Ph	171. 1
2-222	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2-Cl-Ph	
2-223	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2-CF ₃ -Ph	
2-224	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2-OCF ₃ -Ph	
2-225	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2, 6-Cl ₂ -Ph	
2-226	2	CF ₃	H	H	C-OMe	2, 6-Me ₂ -Ph	
2-227	2	CF ₃	H	5-Me	C-OMe	Ph	176. 9-178. 3
2-228	2	CF ₃	H	H	C-SMe	Me	
2-229	2	CF ₃	H	H	C-SMe	t-Bu	
2-230	2	CF ₃	H	H	C-SMe	-CH ₂ -Ph	
2-231	2	CF ₃	H	H	C-SMe	-CMe ₂ -Ph	

第2表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁵	R ⁹	物性 [融点(°C)]
2-232	2	CF ₃	H	H	C-SMe	Ph	
2-233	2	CF ₃	H	H	C-SMe	2-Cl-Ph	
2-234	2	CF ₃	H	H	C-SMe	2, 6-Cl ₂ -Ph	
2-235	2	CF ₃	H	H	C-SMe	2, 6-Me ₂ -Ph	
2-236	2	CF ₃	H	H	C-Cl	-CH ₂ -Ph	
2-237	2	CF ₃	H	H	C-Cl	-CMe ₂ -Ph	
2-238	2	CF ₃	H	H	C-Cl	Ph	
2-239	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2-Cl-Ph	
2-240	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2, 6-Cl ₂ -Ph	
2-241	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2-Cl-6-F-Ph	
2-242	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2, 6-Me ₂ -Ph	
2-243	2	CF ₃	H	H	C-Cl	2-Cl-6-Me-Ph	
2-244	2	CF ₃	H	H	C-Me	4-Cl-2-F-5-i-Pr-Ph	59-61
2-245	2	CF ₃	H	3-Cl	CH	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	129. 3-133. 1
2-246	2	CF ₃	H	3, 5-Cl ₂	CH	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	106. 4-124. 2
2-247	2	CF ₃	CO-i-Pr	H	CH	2, 6-Cl ₂	55. 6-61. 9

一般式 (I-4)

第3表 (m=0、A=-CH₂-、G¹=O、J⁴=J⁵=N)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	R ⁹	物性 [融点(°C)、屈折率]
3-1	2	CF ₃	H	H	Me	
3-2	2	CF ₃	H	H	t-Bu	1.4979 (27°C)
3-3	2	CF ₃	H	H	-CH ₂ -Ph	1.5194 (20°C)
3-4	2	CF ₃	H	H	-CH ₂ -(2-Cl-Ph)	1.5475 (22°C)
3-5	2	CF ₃	H	H	-CH ₂ -(3-Cl-Ph)	97-98
3-6	2	CF ₃	H	H	-CH ₂ -(4-Cl-Ph)	1.5499 (23°C)
3-7	2	CF ₃	H	H	-CH ₂ -(2,6-Cl ₂ -Ph)	
3-8	2	CF ₃	H	H	-CHMe-Ph	1.5287 (25°C)
3-9	2	CF ₃	H	H	-CHMe-(2-Cl-Ph)	
3-10	2	CF ₃	H	H	-CHMe-(3-Cl-Ph)	
3-11	2	CF ₃	H	H	-CHMe-(4-Cl-Ph)	
3-12	2	CF ₃	H	H	-CHMe-(2,6-Cl ₂ -Ph)	
3-13	2	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -Ph	1.5328 (26°C)
3-14	2	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -(2-Cl-Ph)	
3-15	2	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -(3-Cl-Ph)	
3-16	2	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -(4-Cl-Ph)	
3-17	2	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -(2,6-Cl ₂ -Ph)	
3-18	2	CF ₃	H	H	Ph	88-89
3-19	2	CF ₃	H	H	2-F-Ph	1.5244 (21°C)
3-20	2	CF ₃	H	H	3-F-Ph	
3-21	2	CF ₃	H	H	4-F-Ph	
3-22	2	CF ₃	H	H	2-Cl-Ph	105-107
3-23	2	CF ₃	H	H	3-Cl-Ph	74-75
3-24	2	CF ₃	H	H	4-Cl-Ph	127-128
3-25	2	CF ₃	H	H	2-Br-Ph	45
3-26	2	CF ₃	H	H	3-Br-Ph	
3-27	2	CF ₃	H	H	4-Br-Ph	
3-28	2	CF ₃	H	H	2-I-Ph	
3-29	2	CF ₃	H	H	2-Me-Ph	1.5293 (24°C)
3-30	2	CF ₃	H	H	2-Et-Ph	
3-31	2	CF ₃	H	H	2-i-Pr-Ph	
3-32	2	CF ₃	H	H	2-OMe-Ph	90-92

第3表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	R ⁹	物性 [融点(°C)、屈折率]
3-33	2	CF ₃	H	H	2-SMe-Ph	
3-34	2	CF ₃	H	H	2-SOMe-Ph	
3-35	2	CF ₃	H	H	2-SO ₂ Me-Ph	
3-36	2	CF ₃	H	H	2-NO ₂ -Ph	155
3-37	2	CF ₃	H	H	2-CN-Ph	1. 5443 (26°C)
3-38	2	CF ₃	H	H	2-CF ₃ -Ph	95-97
3-39	2	CF ₃	H	H	2-OCF ₃ -Ph	
3-40	2	CF ₃	H	H	2-SCF ₃ -Ph	
3-41	2	CF ₃	H	H	2-SOCF ₃ -Ph	
3-42	2	CF ₃	H	H	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
3-43	2	CF ₃	H	H	2-CO ₂ Me-Ph	
3-44	2	CF ₃	H	H	2-Ph-Ph	
3-45	2	CF ₃	H	H	4-PhO-Ph	
3-46	2	CF ₃	H	H	2, 6-F ₂ -Ph	109-110
3-47	2	CF ₃	H	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	124
3-48	2	CF ₃	H	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	139-141
3-49	2	CF ₃	H	H	3, 4-Cl ₂ -Ph	88-90
3-50	2	CF ₃	H	H	3, 5-Cl ₂ -Ph	
3-51	2	CF ₃	H	H	2, 6-Br ₂ -Ph	
3-52	2	CF ₃	H	H	2, 6-I ₂ -Ph	
3-53	2	CF ₃	H	H	2, 6-Me ₂ -Ph	150-152
3-54	2	CF ₃	H	H	2, 6-Et ₂ -Ph	
3-55	2	CF ₃	H	H	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
3-56	2	CF ₃	H	H	2, 4-(CF ₃) ₂ -Ph	
3-57	2	CF ₃	H	H	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
3-58	2	CF ₃	H	H	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
3-59	2	CF ₃	H	H	2, 4, 6-F ₃ -Ph	
3-60	2	CF ₃	H	H	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
3-61	2	CF ₃	H	H	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	147-149
3-62	2	CF ₃	H	H	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
3-63	2	CF ₃	H	H	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
3-64	2	CF ₃	H	H	2, 4, 6-Me ₃ -Ph	
3-65	2	CF ₃	H	H	2-Pyn	
3-66	2	CF ₃	H	H	3-Pyn	
3-67	2	CF ₃	H	H	4-Pyn	
3-68	2	CF ₃	H	H	6-Cl-2-Pyn	
3-69	2	CF ₃	H	H	6-CF ₃ -2-Pyn	
3-70	2	CF ₃	H	H	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
3-71	2	CF ₃	H	H	2-Pym	
3-72	2	CF ₃	H	H	4-Pym	

第3表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	R ⁹	物性 [融点(°C)、屈折率]
3-73	2	CF ₃	H	H	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
3-74	2	CF ₃	H	H	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
3-75	2	CF ₃	H	H	3-Pyd	
3-76	2	CF ₃	H	H	6-Cl-3-Pyd	
3-77	2	CF ₃	H	H	-CO-NHMe	
3-78	2	CF ₃	H	H	-CO-NHPh	
3-79	2	CF ₃	H	H	-CO-NMePh	1. 5302 (25°C)
3-80	2	CF ₃	H	H	-CO-NEt (c-Hex)	50
3-81	2	CF ₃	H	H	-CO-N(i-Pr) ₂	
3-82	2	CF ₃	Me	H	Ph	
3-83	2	CF ₃	Me	H	2-Cl-Ph	NMR-2
3-84	2	CF ₃	Me	H	2-Me-Ph	
3-85	2	CF ₃	Me	H	2-CF ₃ -Ph	
3-86	2	CF ₃	Me	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
3-87	2	CF ₃	Me	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-88	2	CF ₃	Me	H	-CH ₂ -Ph	
3-89	2	CF ₃	Me	H	-CMe ₂ -Ph	
3-90	2	CF ₃	COMe	H	Ph	
3-91	2	CF ₃	COMe	H	2-Cl-Ph	
3-92	2	CF ₃	COMe	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
3-93	2	CF ₃	COMe	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-94	2	CF ₃	COMe	H	-CH ₂ -Ph	
3-95	2	CF ₃	COMe	H	-CMe ₂ -Ph	
3-96	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	Ph	
3-97	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	2-Cl-Ph	
3-98	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
3-99	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-100	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	-CH ₂ -Ph	
3-101	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	-CMe ₂ -Ph	
3-102	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	Ph	
3-103	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	2-Cl-Ph	
3-104	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
3-105	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-106	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	-CH ₂ -Ph	
3-107	2	CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	-CMe ₂ -Ph	
3-108	2	CF ₃	H	5-Me	Ph	
3-109	2	CF ₃	H	5-Me	2-Cl-Ph	
3-110	2	CF ₃	H	5-Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	
3-111	2	CF ₃	H	5-Me	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-112	2	CF ₃	H	5-Me	-CH ₂ -Ph	

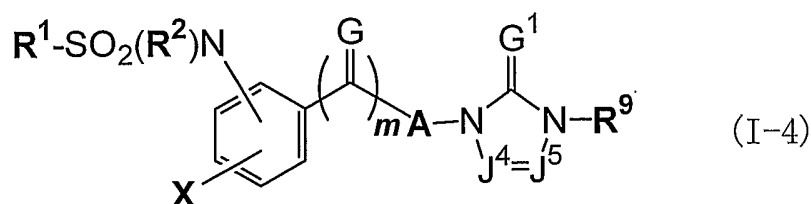
第3表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	R ⁹	物性 [融点(°C)、屈折率]
3-113	2	CF ₃	H	5-Me	-CMe ₂ -Ph	
3-114	2	CF ₃	H	4-Cl	Ph	
3-115	2	CF ₃	H	4-Cl	2-Cl-Ph	
3-116	2	CF ₃	H	4-Cl	2, 6-Cl ₂ -Ph	
3-117	2	CF ₃	H	4-Cl	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-118	2	CF ₃	H	4-Cl	-CH ₂ -Ph	
3-119	2	CF ₃	H	4-Cl	-CMe ₂ -Ph	
3-120	2	CF ₃	H	5-Cl	Ph	
3-121	2	CF ₃	H	5-Cl	2-Cl-Ph	
3-122	2	CF ₃	H	5-Cl	2, 6-Cl ₂ -Ph	
3-123	2	CF ₃	H	5-Cl	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-124	2	CF ₃	H	5-Cl	-CH ₂ -Ph	
3-125	2	CF ₃	H	5-Cl	-CMe ₂ -Ph	
3-126	3	CF ₃	H	H	Me	
3-127	3	CF ₃	H	H	t-Bu	
3-128	3	CF ₃	H	H	-CH ₂ -Ph	
3-129	3	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -Ph	
3-130	3	CF ₃	H	H	Ph	
3-131	3	CF ₃	H	H	2-Cl-Ph	
3-132	3	CF ₃	H	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
3-133	3	CF ₃	H	H	2-Cl-6-Me-Ph	
3-134	3	CF ₃	H	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-135	4	CF ₃	H	H	Me	
3-136	4	CF ₃	H	H	t-Bu	
3-137	4	CF ₃	H	H	-CH ₂ -Ph	
3-138	4	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -Ph	
3-139	4	CF ₃	H	H	Ph	
3-140	4	CF ₃	H	H	2-Cl-Ph	
3-141	4	CF ₃	H	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
3-142	4	CF ₃	H	H	2-Cl-6-Me-Ph	
3-143	4	CF ₃	H	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-144	2	CHF ₂	H	H	Me	
3-145	2	CHF ₂	H	H	t-Bu	
3-146	2	CHF ₂	H	H	-CH ₂ -Ph	
3-147	2	CHF ₂	H	H	-CMe ₂ -Ph	
3-148	2	CHF ₂	H	H	Ph	
3-149	2	CHF ₂	H	H	2-Cl-Ph	
3-150	2	CHF ₂	H	H	2-CF ₃ -Ph	
3-151	2	CHF ₂	H	H	2-OCF ₃ -Ph	
3-152	2	CHF ₂	H	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	

第3表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	R ⁹	物性 [融点(°C)、屈折率]
3-153	2	CHF ₂	H	H	2-Cl-6-F-Ph	
3-154	2	CHF ₂	H	H	2-Cl-6-Me-Ph	
3-155	2	CHF ₂	H	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
3-156	2	CF ₃	H	H	c-Hex	107
3-157	2	CF ₃	H	H	4-SCF ₃ -Ph	1. 5214(25°C)
3-158	2	CF ₃	H	H	4-OMe-Ph	130-131
3-159	2	CF ₃	H	H	2-NH ₂ -Ph	1. 5316(24°C)
3-160	2	CF ₃	H	H	2-NHOH-Ph	1. 5465(24°C)
3-161	2	CF ₃	Ac	H	2-NHAc-Ph	1. 5241(24°C)
3-162	2	CF ₃	H	H	2, 4-F ₂ -Ph	112-113
3-163	2	CF ₃	H	H	2-Phthalimidyl-Ph	177-180
3-164	2	CF ₃	H	6-Cl	2-CF ₃ -Ph	1. 4936(28°C)
3-165	2	CF ₃	H	5-SMe	2-CF ₃ -Ph	1. 5327(21°C)
3-166	2	CF ₃	H	H	CH ₂ CO-t-Bu	104-105
3-167	2	CF ₃	H	H	CH ₂ COPh	1. 5351(23°C)
3-168	2	CF ₃	H	H	CH ₂ CO(2, 4-Cl ₂ -Ph)	1. 5494(28°C)
3-169	2	CF ₃	H	H	CONMe ₂	1. 5099(25°C)
3-170	2	CF ₃	H	H	CHMeCO ₂ Me	1. 4966(27°C)
3-171	2	CF ₃	H	H	CHMeCO ₂ H	1. 4989(25°C)
3-172	2	CF ₃	H	H	CHMeCONH(4-Cl-Ph)	90-95
3-173	2	CF ₃	H	H	CMe ₂ -(3-i-Pr-Ph)	1. 5129(28°C)
3-174	2	CF ₃	H	H	CH ₂ (2, 4-Cl ₂ -Ph)	49
3-175	2	CF ₃	H	H	CH ₂ (2-Me-Ph)	106-107
3-176	2	CF ₃	H	H	CH ₂ (3-Me-Ph)	1. 5275(23°C)
3-177	2	CF ₃	H	H	CH ₂ (4-Me-Ph)	1. 5431(23°C)
3-178	2	CF ₃	H	H	CH ₂ (2, 4-Me ₂ -Ph)	30
3-179	2	CF ₃	H	H	CH ₂ (4-MeO-Ph)	1. 5371(26°C)
3-180	2	CF ₃	H	H	CH ₂ (4-CF ₃ O-Ph)	1. 5077(25°C)
3-181	2	CF ₃	H	H	CH ₂ (3-CF ₃ SO ₂ NH-Ph)	161-162
3-182	2	CF ₃	H	H	i-Pr	1. 4953(20°C)
3-183	2	CF ₃	H	H	CH(Et) ₂	59
3-184	2	CF ₃	H	H	(CH ₂) ₇ -Me	1. 4882(26°C)
3-185	2	CF ₃	H	H	CH(Me)-(CH ₂) ₅ -Me	1. 4681(20°C)

一般式 (I-4)

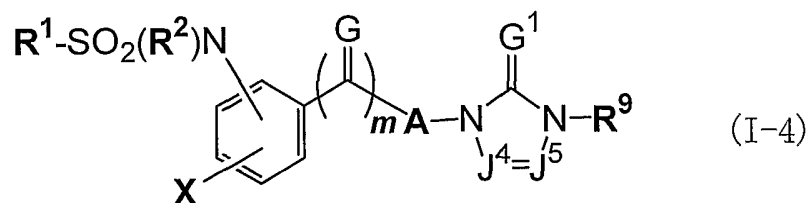
第4表 (m=0、A=-CH₂-、G¹=O、J⁴=J⁵=CH)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	R ⁹	物性 [融点(°C)]
4-1	2	CF ₃	H	H	Me	
4-2	2	CF ₃	H	H	t-Bu	
4-3	2	CF ₃	H	H	-CH ₂ -Ph	
4-4	2	CF ₃	H	H	-CH ₂ -(2-Cl-Ph)	
4-5	2	CF ₃	H	H	-CH ₂ -(2, 6-Cl ₂ -Ph)	
4-6	2	CF ₃	H	H	-CHMe-Ph	
4-7	2	CF ₃	H	H	-CHMe-(2-Cl-Ph)	
4-8	2	CF ₃	H	H	-CHMe-(2, 6-Cl ₂ -Ph)	
4-9	2	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -Ph	
4-10	2	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -(2-Cl-Ph)	
4-11	2	CF ₃	H	H	-CMe ₂ -(2, 6-Cl ₂ -Ph)	
4-12	2	CF ₃	H	H	Ph	
4-13	2	CF ₃	H	H	2-F-Ph	
4-14	2	CF ₃	H	H	2-Cl-Ph	117.4
4-15	2	CF ₃	H	H	3-Cl-Ph	
4-16	2	CF ₃	H	H	4-Cl-Ph	
4-17	2	CF ₃	H	H	2-Br-Ph	
4-18	2	CF ₃	H	H	2-I-Ph	
4-19	2	CF ₃	H	H	2-Me-Ph	
4-20	2	CF ₃	H	H	2-Et-Ph	
4-21	2	CF ₃	H	H	2-i-Pr-Ph	
4-22	2	CF ₃	H	H	2-OMe-Ph	
4-23	2	CF ₃	H	H	2-SMe-Ph	
4-24	2	CF ₃	H	H	2-SOMe-Ph	
4-25	2	CF ₃	H	H	2-SO ₂ Me-Ph	
4-26	2	CF ₃	H	H	2-NO ₂ -Ph	
4-27	2	CF ₃	H	H	2-CN-Ph	
4-28	2	CF ₃	H	H	2-CF ₃ -Ph	
4-29	2	CF ₃	H	H	2-OCF ₃ -Ph	
4-30	2	CF ₃	H	H	2-SCF ₃ -Ph	
4-31	2	CF ₃	H	H	2-SOCF ₃ -Ph	
4-32	2	CF ₃	H	H	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	

第4表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	R ⁹	物性 [融点(°C)]
4-33	2	CF ₃	H	H	2-CO ₂ Me-Ph	
4-34	2	CF ₃	H	H	2-Ph-Ph	
4-35	2	CF ₃	H	H	4-PhO-Ph	
4-36	2	CF ₃	H	H	2, 6-F ₂ -Ph	
4-37	2	CF ₃	H	H	2, 3-Cl ₂ -Ph	
4-38	2	CF ₃	H	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	
4-39	2	CF ₃	H	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	182.2
4-40	2	CF ₃	H	H	2, 6-Br ₂ -Ph	
4-41	2	CF ₃	H	H	2, 6-I ₂ -Ph	
4-42	2	CF ₃	H	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
4-43	2	CF ₃	H	H	2, 6-Et ₂ -Ph	
4-44	2	CF ₃	H	H	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
4-45	2	CF ₃	H	H	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
4-46	2	CF ₃	H	H	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
4-47	2	CF ₃	H	H	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
4-48	2	CF ₃	H	H	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
4-49	2	CF ₃	H	H	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
4-50	2	CF ₃	H	H	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
4-51	2	CF ₃	H	H	2, 4, 6-Me ₃ -Ph	
4-52	2	CF ₃	H	H	2-Pyn	
4-53	2	CF ₃	H	H	3-Pyn	
4-54	2	CF ₃	H	H	4-Pyn	
4-55	2	CF ₃	H	H	6-Cl-2-Pyn	
4-56	2	CF ₃	H	H	6-CF ₃ -2-Pyn	
4-57	2	CF ₃	H	H	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
4-58	2	CF ₃	H	H	2-Pym	
4-59	2	CF ₃	H	H	4-Pym	
4-60	2	CF ₃	H	H	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
4-61	2	CF ₃	H	H	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
4-62	2	CF ₃	H	H	-CO-NHMe	
4-63	2	CF ₃	H	H	-CO-NHPh	
4-64	2	CF ₃	H	H	-CO-NMePh	
4-65	2	CF ₃	H	H	-CO-NEt(c-Hex)	
4-66	2	CF ₃	H	H	-CO-N(i-Pr) ₂	

一般式 (I-4)

第5表 (R¹=CF₃、R²=H、X=H、J⁴=CH、J⁵=N、G¹=O)

No.	置換位置	m	G	A	R ⁹	物性 [融点 (°C)]
5-1	2	0	0	(CH ₂) ₂	Me	
5-2	2	0	0	(CH ₂) ₂	t-Bu	
5-3	2	0	0	(CH ₂) ₂	-CH ₂ -Ph	
5-4	2	0	0	(CH ₂) ₂	-CMe ₂ -Ph	
5-5	2	0	0	(CH ₂) ₂	Ph	
5-6	2	0	0	(CH ₂) ₂	2-Cl-Ph	102-105
5-7	2	0	0	(CH ₂) ₂	2-Me-Ph	
5-8	2	0	0	(CH ₂) ₂	2-OMe-Ph	
5-9	2	0	0	(CH ₂) ₂	2-CF ₃ -Ph	
5-10	2	0	0	(CH ₂) ₂	2-OCF ₃ -Ph	
5-11	2	0	0	(CH ₂) ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	
5-12	2	0	0	(CH ₂) ₂	2, 6-Me ₂ -Ph	
5-13	2	0	0	(CH ₂) ₂	2-Pyn	
5-14	2	0	0	(CH ₂) ₂	3-Pyn	
5-15	2	0	0	(CH ₂) ₂	4-Pyn	
5-16	2	0	0	(CH ₂) ₂	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
5-17	2	0	0	(CH ₂) ₂	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
5-18	2	0	0	(CH ₂) ₂	3-Pyd	
5-19	2	0	0	(CH ₂) ₂	-CO-NHMe	
5-20	2	0	0	(CH ₂) ₂	-CO-NHPh	
5-21	2	0	0	(CH ₂) ₂	-CO-NMePh	
5-22	2	0	0	(CH ₂) ₂	-CO-NEt (c-Hex)	
5-23	2	0	0	(CH ₂) ₂	-CO-N(i-Pr) ₂	
5-24	2	0	0	CHMe	Me	
5-25	2	0	0	CHMe	t-Bu	
5-26	2	0	0	CHMe	-CH ₂ -Ph	
5-27	2	0	0	CHMe	-CMe ₂ -Ph	
5-28	2	0	0	CHMe	Ph	
5-29	2	0	0	CHMe	2-Cl-Ph	NMR-3

第5表 (続き)

No.	置換 位置	m	G	A	R ⁹	物性 [融点 (°C)]
5-30	2	0	0	CHMe	2-Me-Ph	
5-31	2	0	0	CHMe	2-OMe-Ph	
5-32	2	0	0	CHMe	2-CF ₃ -Ph	
5-33	2	0	0	CHMe	2-OCF ₃ -Ph	
5-34	2	0	0	CHMe	2, 6-Cl ₂ -Ph	
5-35	2	0	0	CHMe	2, 6-Me ₂ -Ph	
5-36	2	0	0	CHMe	2-Pyn	
5-37	2	0	0	CHMe	3-Pyn	
5-38	2	0	0	CHMe	4-Pyn	
5-39	2	0	0	CHMe	2-Pym	
5-40	2	0	0	CHMe	4-Pym	
5-41	2	0	0	CHMe	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
5-42	2	0	0	CHMe	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
5-43	2	0	0	CHMe	3-Pyd	
5-44	2	0	0	CHMe	6-Cl-3-Pyd	
5-45	2	0	0	CH(OH)CH ₂	Me	
5-46	2	0	0	CH(OH)CH ₂	t-Bu	
5-47	2	0	0	CH(OH)CH ₂	-CH ₂ -Ph	
5-48	2	0	0	CH(OH)CH ₂	-CMe ₂ -Ph	
5-49	2	0	0	CH(OH)CH ₂	Ph	
5-50	2	0	0	CH(OH)CH ₂	2-Cl-Ph	NMR-4
5-51	2	0	0	CH(OH)CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	
5-52	2	0	0	CH(OH)CH ₂	2-Cl-6-F-Ph	
5-53	2	0	0	CH(OH)CH ₂	2-Cl-6-Me-Ph	
5-54	2	0	0	CH(OH)CH ₂	2, 6-Me ₂ -Ph	
5-55	2	0	0	CH(OH)CH ₂	2-Pym	
5-56	2	0	0	CH(OH)CH ₂	4-Pym	
5-57	2	0	0	CH(OH)CH ₂	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
5-58	2	0	0	CH(OH)CH ₂	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
5-59	2	1	0	CH ₂	Me	
5-60	2	1	0	CH ₂	t-Bu	
5-61	2	1	0	CH ₂	-CH ₂ -Ph	
5-62	2	1	0	CH ₂	-CMe ₂ -Ph	
5-63	2	1	0	CH ₂	Ph	
5-64	2	1	0	CH ₂	2-Cl-Ph	NMR-5
5-65	2	1	0	CH ₂	2-Me-Ph	

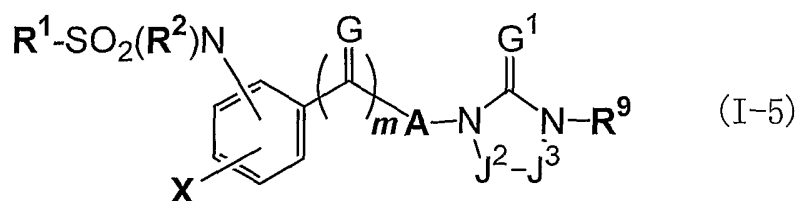
第5表 (続き)

No.	置換位置	m	G	A	R ⁹	物性 [融点 (°C)]
5-66	2	1	0	CH ₂	2-OMe-Ph	
5-67	2	1	0	CH ₂	2-CF ₃ -Ph	
5-68	2	1	0	CH ₂	2-OCF ₃ -Ph	
5-69	2	1	0	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	
5-70	2	1	0	CH ₂	2-Cl-6-F-Ph	
5-71	2	1	0	CH ₂	2-Cl-6-Me-Ph	
5-72	2	1	0	CH ₂	2, 6-Me ₂ -Ph	
5-73	2	1	0	CH ₂	2-Pyn	
5-74	2	1	0	CH ₂	3-Pyn	
5-75	2	1	0	CH ₂	4-Pyn	
5-76	2	1	0	CH ₂	2-Pym	
5-77	2	1	0	CH ₂	4-Pym	
5-78	2	1	0	CH ₂	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
5-79	2	1	0	CH ₂	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
5-80	2	1	0	CH ₂	3-Pyd	
5-81	2	1	0	CH ₂	-CO-NHMe	
5-82	2	1	0	CH ₂	-CO-NHPh	
5-83	2	1	0	CH ₂	-CO-NH(2-Cl-Ph)	
5-84	2	1	0	CH ₂	-CO-NMe ₂	
5-85	2	1	0	CH ₂	-CO-NMePh	
5-86	2	1	0	CH ₂	-CO-NEt(c-Hex)	
5-87	2	1	0	CH ₂	-CO-N(i-Pr) ₂	
5-88	2	1	N-OMe	CH ₂	Me	
5-89	2	1	N-OMe	CH ₂	t-Bu	
5-90	2	1	N-OMe	CH ₂	-CH ₂ -Ph	
5-91	2	1	N-OMe	CH ₂	-CMe ₂ -Ph	
5-92	2	1	N-OMe	CH ₂	Ph	
5-93	2	1	N-OMe	CH ₂	2-Cl-Ph	NMR-6
5-94	2	1	N-OMe	CH ₂	2-Me-Ph	
5-95	2	1	N-OMe	CH ₂	2-OMe-Ph	
5-96	2	1	N-OMe	CH ₂	2-CF ₃ -Ph	
5-97	2	1	N-OMe	CH ₂	2-OCF ₃ -Ph	
5-98	2	1	N-OMe	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	
5-99	2	1	N-OMe	CH ₂	2-Cl-6-F-Ph	
5-100	2	1	N-OMe	CH ₂	2-Cl-6-Me-Ph	

第5表 (続き)

No.	置換 位置	m	G	A	R ⁹	物性 [融点 (°C)]
5-101	2	1	N-OMe	CH ₂	2,6-Me ₂ -Ph	

一般式 (I-5)

第6表 (m=0、A=-CH₂-、G¹=O)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-1	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	Me	
6-2	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	t-Bu	
6-3	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	-CH ₂ -Ph	
6-4	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	-CHMe-Ph	
6-5	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	-CMe ₂ -Ph	
6-6	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	Ph	
6-7	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-F-Ph	
6-8	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-Cl-Ph	170.3
6-9	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	3-Cl-Ph	161.8
6-10	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4-Cl-Ph	152.6
6-11	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-Me-Ph	
6-12	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-i-Pr-Ph	
6-13	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-OMe-Ph	
6-14	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-SMe-Ph	
6-15	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-SOMe-Ph	
6-16	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-SO ₂ Me-Ph	
6-17	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-CN-Ph	
6-18	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-NO ₂ -Ph	
6-19	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-CF ₃ -Ph	125.8
6-20	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-OCF ₃ -Ph	
6-21	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-SCF ₃ -Ph	
6-22	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-SOCF ₃ -Ph	
6-23	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
6-24	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-CO ₂ Me-Ph	
6-25	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-Ph-Ph	
6-26	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4-PhO-Ph	
6-27	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2,6-F ₂ -Ph	146.2
6-28	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2,6-Cl ₂ -Ph	201.2
6-29	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2,6-Me ₂ -Ph	200.6
6-30	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2,6-(CF ₃) ₂ -Ph	
6-31	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2,6-(OCF ₃) ₂ -Ph	

第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-32	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-Cl-6-Me-Ph	185.1
6-33	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	144.3
6-34	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
6-35	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
6-36	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
6-37	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-Pyn	
6-38	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	3-Pyn	
6-39	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4-Pyn	
6-40	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	6-Cl-2-Pyn	
6-41	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	6-CF ₃ -2-Pyn	
6-42	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
6-43	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-Pym	
6-44	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4-Pym	
6-45	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
6-46	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
6-47	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	3-Pyd	
6-48	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	6-Cl-3-Pyd	
6-49	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	-CO-NHMe	
6-50	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	-CO-NHPh	
6-51	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	-CO-NMePh	
6-52	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	-CO-NEt ₂	
6-53	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	-CO-NEt (c-Hex)	
6-54	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	-CO-N(i-Pr) ₂	
6-55	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	Me	
6-56	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	t-Bu	
6-57	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	-CH ₂ -Ph	
6-58	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	-CHMe-Ph	
6-59	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	-CMe ₂ -Ph	
6-60	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	Ph	1. 5561 (24°C)
6-61	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-F-Ph	
6-62	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-Cl-Ph	150.5-151.7
6-63	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-Br-Ph	
6-64	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-I-Ph	
6-65	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-Me-Ph	
6-66	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-i-Pr-Ph	
6-67	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-OMe-Ph	
6-68	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-SMe-Ph	
6-69	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-SOMe-Ph	
6-70	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-SO ₂ Me-Ph	
6-71	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-CN-Ph	

第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-72	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-NO ₂ -Ph	1. 5140 (24°C)
6-73	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-CF ₃ -Ph	
6-74	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-OCF ₃ -Ph	
6-75	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-SCF ₃ -Ph	
6-76	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-SOCF ₃ -Ph	
6-77	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
6-78	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-CO ₂ Me-Ph	
6-79	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-Ph-Ph	
6-80	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	4-PhO-Ph	
6-81	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 6-F ₂ -Ph	
6-82	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 6-Cl ₂ -Ph	
6-83	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 6-Me ₂ -Ph	
6-84	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
6-85	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
6-86	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
6-87	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
6-88	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
6-89	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
6-90	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
6-91	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-Pyn	
6-92	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	3-Pyn	
6-93	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	4-Pyn	
6-94	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	6-Cl-2-Pyn	
6-95	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	6-CF ₃ -2-Pyn	
6-96	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
6-97	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	2-Pym	
6-98	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	4-Pym	
6-99	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
6-100	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
6-101	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	3-Pyd	
6-102	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	6-Cl-3-Pyd	
6-103	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	-CO-NHMe	
6-104	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	-CO-NHPh	
6-105	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	-CO-NMePh	
6-106	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	-CO-NEt (c-Hex)	
6-107	2	CF ₃	H	H	CH ₂	C=O	-CO-N(i-Pr) ₂	
6-108	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	Me	
6-109	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	t-Bu	
6-110	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	-CH ₂ -Ph	
6-111	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	-CHMe-Ph	

第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-112	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	-CMe ₂ -Ph	96.9-115.3
6-113	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	Ph	
6-114	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-Cl-Ph	
6-115	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-Me-Ph	
6-116	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-OMe-Ph	
6-117	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-SMe-Ph	
6-118	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-SOMe-Ph	
6-119	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-SO ₂ Me-Ph	
6-120	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-CN-Ph	
6-121	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-NO ₂ -Ph	
6-122	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-CF ₃ -Ph	
6-123	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-OCF ₃ -Ph	
6-124	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-SCF ₃ -Ph	
6-125	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-SOCF ₃ -Ph	
6-126	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
6-127	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-CO ₂ Me-Ph	
6-128	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-Ph-Ph	
6-129	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-PhO-Ph	
6-130	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2, 6-F ₂ -Ph	
6-131	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	
6-132	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2, 6-Me ₂ -Ph	
6-133	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
6-134	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
6-135	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
6-136	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
6-137	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
6-138	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-Pyn	
6-139	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	3-Pyn	
6-140	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	4-Pyn	
6-141	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	6-Cl-2-Pyn	
6-142	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	6-CF ₃ -2-Pyn	
6-143	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
6-144	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	2-Pym	
6-145	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	4-Pym	
6-146	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
6-147	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
6-148	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	3-Pyd	
6-149	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	6-Cl-3-Pyd	
6-150	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	-CO-NHMe	
6-151	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	-CO-NHPh	

第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-152	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	-CO-NH-2-Cl-Ph	
6-153	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	-CO-NMePh	
6-154	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	-CO-NEt (c-Hex)	
6-155	2	CF ₃	H	H	C=O	CH ₂	-CO-N(i-Pr) ₂	
6-156	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	Me	
6-157	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	t-Bu	
6-158	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	-CH ₂ -Ph	
6-159	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	-CHMe-Ph	
6-160	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	-CMe ₂ -Ph	
6-161	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	Ph	
6-162	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-F-Ph	
6-163	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-Cl-Ph	
6-164	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-Me-Ph	
6-165	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-i-Pr-Ph	
6-166	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-OMe-Ph	
6-167	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-SMe-Ph	
6-168	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-SOMe-Ph	
6-169	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-SO ₂ Me-Ph	
6-170	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-CN-Ph	
6-171	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-NO ₂ -Ph	
6-172	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-CF ₃ -Ph	
6-173	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-OCF ₃ -Ph	
6-174	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-SCF ₃ -Ph	
6-175	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-SOCF ₃ -Ph	
6-176	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
6-177	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-CO ₂ Me-Ph	
6-178	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-Ph-Ph	
6-179	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-PhO-Ph	
6-180	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-F ₂ -Ph	
6-181	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-Cl ₂ -Ph	
6-182	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-Br ₂ -Ph	
6-183	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-I ₂ -Ph	
6-184	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-Me ₂ -Ph	
6-185	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
6-186	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
6-187	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
6-188	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
6-189	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
6-190	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
6-191	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	

第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-192	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
6-193	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-Pyn	
6-194	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	3-Pyn	
6-195	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	4-Pyn	
6-196	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	6-Cl-2-Pyn	
6-197	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	6-CF ₃ -2-Pyn	
6-198	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
6-199	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	2-Pym	
6-200	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	4-Pym	
6-201	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
6-202	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
6-203	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	3-Pyd	
6-204	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	6-Cl-3-Pyd	
6-205	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	-CO-NHMe	
6-206	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	-CO-NHPh	
6-207	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	-CO-NMePh	
6-208	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	-CO-NEt (c-Hex)	
6-209	2	CF ₃	H	H	C=O	C=O	-CO-N(i-Pr) ₂	
6-210	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	Me	
6-211	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	t-Bu	
6-212	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	-CH ₂ -Ph	
6-213	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	-CHMe-Ph	
6-214	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	-CMe ₂ -Ph	
6-215	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	Ph	
6-216	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-F-Ph	
6-217	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-Cl-Ph	
6-218	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-Me-Ph	
6-219	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-i-Pr-Ph	
6-220	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-OMe-Ph	
6-221	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-SMe-Ph	
6-222	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-SOMe-Ph	
6-223	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-SO ₂ Me-Ph	
6-224	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-CN-Ph	
6-225	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-NO ₂ -Ph	
6-226	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-CF ₃ -Ph	
6-227	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-OCF ₃ -Ph	
6-228	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-SCF ₃ -Ph	
6-229	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-SOCF ₃ -Ph	
6-230	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
6-231	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-CO ₂ Me-Ph	

第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-232	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-Ph-Ph	
6-233	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-PhO-Ph	
6-234	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 6-F ₂ -Ph	
6-235	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
6-236	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 6-Me ₂ -Ph	
6-237	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
6-238	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
6-239	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
6-240	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
6-241	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
6-242	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
6-243	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
6-244	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-Pyn	
6-245	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	3-Pyn	
6-246	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	4-Pyn	
6-247	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	6-Cl-2-Pyn	
6-248	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	6-CF ₃ -2-Pyn	
6-249	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
6-250	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	2-Pym	
6-251	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	4-Pym	
6-252	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
6-253	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
6-254	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	3-Pyd	
6-255	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	6-Cl-3-Pyd	
6-256	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	-CO-NHMe	
6-257	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	-CO-NHPh	
6-258	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	-CO-NMePh	
6-259	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	-CO-NEt ₂	
6-260	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	-CO-NEt (c-Hex)	
6-261	2	CF ₃	H	H	CH ₂	NH	-CO-N(i-Pr) ₂	
6-262	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	Me	
6-263	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	t-Bu	
6-264	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	-CH ₂ -Ph	
6-265	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	-CHMe-Ph	
6-266	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	-CMe ₂ -Ph	
6-267	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	Ph	
6-268	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-F-Ph	
6-269	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-Cl-Ph	
6-270	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-Me-Ph	
6-271	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-i-Pr-Ph	

第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-272	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-OMe-Ph	
6-273	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-SMe-Ph	
6-274	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-SOMe-Ph	
6-275	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-SO ₂ Me-Ph	
6-276	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-CN-Ph	
6-277	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-NO ₂ -Ph	
6-278	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-CF ₃ -Ph	
6-279	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-OCF ₃ -Ph	
6-280	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-SCF ₃ -Ph	
6-281	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-SOCF ₃ -Ph	
6-282	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
6-283	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-CO ₂ Me-Ph	
6-284	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-Ph-Ph	
6-285	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-PhO-Ph	
6-286	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,6-F ₂ -Ph	
6-287	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,6-Cl ₂ -Ph	
6-288	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,6-Me ₂ -Ph	
6-289	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,6-(OMe) ₂ -Ph	
6-290	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,6-(CF ₃) ₂ -Ph	
6-291	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
6-292	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,3,4-Cl ₃ -Ph	
6-293	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,4,6-Cl ₃ -Ph	
6-294	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
6-295	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
6-296	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2,3,4-Me ₃ -Ph	
6-297	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-Pyn	
6-298	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	3-Pyn	
6-299	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	4-Pyn	
6-300	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	6-Cl-2-Pyn	
6-301	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	6-CF ₃ -2-Pyn	
6-302	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
6-303	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	2-Pym	
6-304	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	4-Pym	
6-305	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	4,6-Me ₂ -2-Pym	
6-306	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	4,6-(OMe) ₂ -2-Pym	
6-307	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	3-Pyd	
6-308	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	6-Cl-3-Pyd	
6-309	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	-CO-NHMe	
6-310	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	-CO-NHPh	
6-311	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	-CO-NMePh	

第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-312	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	-CO-NEt ₂	
6-313	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	-CO-NEt (c-Hex)	
6-314	2	CF ₃	H	H	CH ₂	N-Me	-CO-N(i-Pr) ₂	
6-315	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	Ph	
6-316	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-F-Ph	
6-317	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-Cl-Ph	
6-318	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-F ₂ -Ph	
6-319	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	
6-320	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Me ₂ -Ph	
6-321	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
6-322	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
6-323	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
6-324	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
6-325	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
6-326	3	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
6-327	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	Ph	
6-328	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-F-Ph	
6-329	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2-Cl-Ph	
6-330	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-F ₂ -Ph	
6-331	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	
6-332	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Me ₂ -Ph	
6-333	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
6-334	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
6-335	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
6-336	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
6-337	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
6-338	4	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
6-339	2	CF ₃	H	5-Cl	CH ₂	CH ₂	2-Cl-Ph	NMR-8
6-340	2	CF ₃	H	H	Me ₂ C	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	180. 3-182. 0
6-341	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4-Br-2, 6-Me ₂ -Ph	200. 8
6-342	2	CF ₃	i-Pr-CO	H	CH ₂	CH ₂	4-Br-2, 6-Me ₂ -Ph	1. 5249 (21°C)
6-343	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4-Br-2-CF ₃ -Ph	175. 3
6-344	2	CF ₃	c-Pr-CO	H	CH ₂	CH ₂	4-Br-2, 6-Me ₂ -Ph	1. 5369 (21°C)
6-345	2	CF ₃	i-Pr-CO	H	CH ₂	CH ₂	2-Cl-6-Me-Ph	1. 5241 (22°C)
6-346	2	CF ₃	H	H	CH ₂	MeCH	2, 6-Cl ₂ -Ph	166. 8-167. 7
6-347	2	CF ₃	t-Bu-CO	H	CH ₂	CH ₂	4-Br-2, 6-Me ₂ -Ph	150. 5

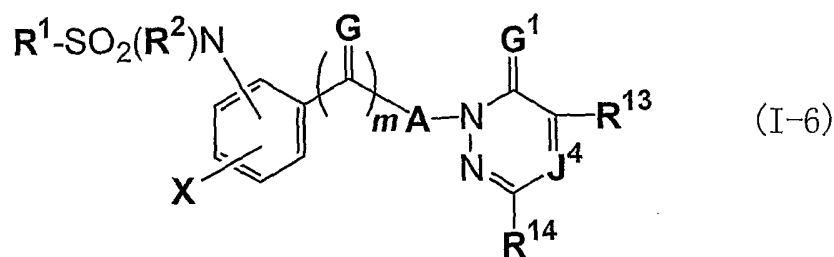
第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-348	2	CF ₃	Ph-CO	H	CH ₂	CH ₂	4-Br-2, 6-Me ₂ -Ph	57.3-64.1
6-349	2	CF ₃	H	H	MeCH	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	172.4-173.3
6-350	2	CF ₃	i-Pr-CO	H	MeCH	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	51.7-66.8
6-351	2	CF ₃	i-Pr-CO	H	CH ₂	MeCH	2, 6-Cl ₂ -Ph	1.5375 (22°C)
6-352	2	CF ₃	i-Pr-CO	H	CH ₂	CH ₂	2-Cl-Ph	1.5367 (22°C)
6-353	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4-Br-2-Me-Ph	158.1
6-354	2	CF ₃	i-Pr-CO	H	CH ₂	CH ₂	4-Br-2-Me-Ph	1.5371 (21°C)
6-355	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	4-Cl-2-Me-Ph	158.0-161.9
6-356	2	CF ₃	i-Pr-CO	H	CH ₂	CH ₂	4-Cl-2-Me-Ph	47.3-60.0
6-357	2	CF ₃	i-Pr-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	1.5381 (22°C)
6-358	2	CF ₃	H	H	CH ₂	CH ₂	5-Cl-2-Me-Ph	167.5
6-359	2	CF ₃	Me	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	123-124
6-360	2	CF ₃	MeOCH ₂ 2, 4, 6	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	1.5403 (27°C)
6-361	2	CF ₃	-Me ₃ - Ph-CO 2, 6-	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	NMR-9
6-362	2	CF ₃	Me ₂ - Ph-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	NMR-10
6-363	2	CF ₃	Ph-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	95-97
6-364	2	CF ₃	i- BuO- CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	1.5232 (21°C)
6-365	2	CF ₃	n- BuO- CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	1.5335 (22°C)
6-366	2	CF ₃	MeO- CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	126-128
6-367	2	CF ₃	EtO- CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	1.5290 (21°C)
6-368	2	CF ₃	PhO- CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	1.5479 (25°C)
6-369	2	CF ₃	n-Pr- CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	1.5345 (25°C)

第6表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ²	J ³	R ⁹	物性 [融点(°C)]
6-370	2	CF ₃	n-Bu-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	1. 5341 (25°C)
6-371	2	CF ₃	i-Bu-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	127. 0-128. 0
6-372	2	CF ₃	4-Cl-Ph-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	134-138
6-373	2	CF ₃	i-Pr	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	159-161
6-374	2	CF ₃	Et-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	1. 5370 (29°C)
6-375	2	CF ₃	4-Me-Ph-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	118-121
6-376	2	CF ₃	CH ₂ =C H(CH ₂) ₂ -CO 4-	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	98-100
6-377	2	CF ₃	CF ₃ -Ph-CO 2, 4-	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	141-145
6-378	2	CF ₃	F ₂ -Ph-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	119-122
6-379	2	CF ₃	Ph-Ph-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	125-128
6-380	2	CF ₃	2-Me-Ph-CO	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	143-146
6-381	2	CHF ₂	H	H	CH ₂	CH ₂	2, 6-Cl ₂ -Ph	176. 5
6-382	2	CF ₃	H	H	C=O	N-Me	Ph	132-134
6-383	2	CF ₃	H	H	N-Ph	C=O	Me	44-46

一般式 (I-6)

第7表 (R²=H、R¹⁴=H、m=0、A=-CH₂-、G¹=O)

No.	置換位置	R ¹	X	J ⁴	R ¹³	物性
7-1	2	CF ₃	H	CH	Me	
7-2	2	CF ₃	H	CH	t-Bu	
7-3	2	CF ₃	H	CH	-CH ₂ -Ph	
7-4	2	CF ₃	H	CH	-CHMe-Ph	
7-5	2	CF ₃	H	CH	-CMe ₂ -Ph	
7-6	2	CF ₃	H	CH	Ph	
7-7	2	CF ₃	H	CH	2-F-Ph	
7-8	2	CF ₃	H	CH	2-Cl-Ph	
7-9	2	CF ₃	H	CH	3-Cl-Ph	
7-10	2	CF ₃	H	CH	4-Cl-Ph	
7-11	2	CF ₃	H	CH	2-Br-Ph	
7-12	2	CF ₃	H	CH	2-I-Ph	
7-13	2	CF ₃	H	CH	2-Me-Ph	
7-14	2	CF ₃	H	CH	2-i-Pr-Ph	
7-15	2	CF ₃	H	CH	2-OMe-Ph	
7-16	2	CF ₃	H	CH	2-SMe-Ph	
7-17	2	CF ₃	H	CH	2-SOMe-Ph	
7-18	2	CF ₃	H	CH	2-SO ₂ Me-Ph	
7-19	2	CF ₃	H	CH	2-CN-Ph	
7-20	2	CF ₃	H	CH	2-NO ₂ -Ph	
7-21	2	CF ₃	H	CH	2-CF ₃ -Ph	
7-22	2	CF ₃	H	CH	2-OCF ₃ -Ph	
7-23	2	CF ₃	H	CH	2-SCF ₃ -Ph	
7-24	2	CF ₃	H	CH	2-SOCF ₃ -Ph	
7-25	2	CF ₃	H	CH	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
7-26	2	CF ₃	H	CH	2-CO ₂ Me-Ph	
7-27	2	CF ₃	H	CH	2-Ph-Ph	
7-28	2	CF ₃	H	CH	2-PhO-Ph	
7-29	2	CF ₃	H	CH	2,6-F ₂ -Ph	

第7表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	X	J ¹	R ¹³	物性
7-30	2	CF ₃	H	CH	2, 6-Cl ₂ -Ph	
7-31	2	CF ₃	H	CH	2, 6-Me ₂ -Ph	
7-32	2	CF ₃	H	CH	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
7-33	2	CF ₃	H	CH	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
7-34	2	CF ₃	H	CH	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
7-35	2	CF ₃	H	CH	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
7-36	2	CF ₃	H	CH	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
7-37	2	CF ₃	H	CH	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
7-38	2	CF ₃	H	CH	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
7-39	2	CF ₃	H	CH	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
7-40	2	CF ₃	H	CH	2-Pyn	
7-41	2	CF ₃	H	CH	3-Pyn	
7-42	2	CF ₃	H	CH	4-Pyn	
7-43	2	CF ₃	H	CH	6-Cl-2-Pyn	
7-44	2	CF ₃	H	CH	6-CF ₃ -2-Pyn	
7-45	2	CF ₃	H	CH	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
7-46	2	CF ₃	H	CH	2-Pym	
7-47	2	CF ₃	H	CH	4-Pym	
7-48	2	CF ₃	H	CH	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
7-49	2	CF ₃	H	CH	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
7-50	2	CF ₃	H	CH	3-Pyd	
7-51	2	CF ₃	H	CH	-CO-NHMe	
7-52	2	CF ₃	H	CH	-CO-NHPh	
7-53	2	CF ₃	H	CH	-CO-NMePh	
7-54	2	CF ₃	H	CH	-CO-NEt-(c-Hex)	
7-55	2	CF ₃	H	N	Me	
7-56	2	CF ₃	H	N	t-Bu	
7-57	2	CF ₃	H	N	-CH ₂ -Ph	
7-58	2	CF ₃	H	N	-CHMe-Ph	
7-59	2	CF ₃	H	N	-CMe ₂ -Ph	
7-60	2	CF ₃	H	N	Ph	123.8
7-61	2	CF ₃	H	N	2-F-Ph	
7-62	2	CF ₃	H	N	2-Cl-Ph	
7-63	2	CF ₃	H	N	3-Cl-Ph	
7-64	2	CF ₃	H	N	4-Cl-Ph	
7-65	2	CF ₃	H	N	2-Me-Ph	
7-66	2	CF ₃	H	N	2-i-Pr-Ph	
7-67	2	CF ₃	H	N	2-OMe-Ph	
7-68	2	CF ₃	H	N	2-SMe-Ph	
7-69	2	CF ₃	H	N	2-SOMe-Ph	

第7表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	X	J ¹	R ¹³	物性
7-70	2	CF ₃	H	N	2-SO ₂ Me-Ph	
7-71	2	CF ₃	H	N	2-CN-Ph	
7-72	2	CF ₃	H	N	2-NO ₂ -Ph	
7-73	2	CF ₃	H	N	2-CF ₃ -Ph	
7-74	2	CF ₃	H	N	2-OCF ₃ -Ph	
7-75	2	CF ₃	H	N	2-SCF ₃ -Ph	
7-76	2	CF ₃	H	N	2-SOCF ₃ -Ph	
7-77	2	CF ₃	H	N	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
7-78	2	CF ₃	H	N	2-CO ₂ Me-Ph	
7-79	2	CF ₃	H	N	2-Ph-Ph	
7-80	2	CF ₃	H	N	2-PhO-Ph	
7-81	2	CF ₃	H	N	2, 6-F ₂ -Ph	
7-82	2	CF ₃	H	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	
7-83	2	CF ₃	H	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
7-84	2	CF ₃	H	N	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
7-85	2	CF ₃	H	N	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
7-86	2	CF ₃	H	N	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
7-87	2	CF ₃	H	N	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
7-88	2	CF ₃	H	N	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
7-89	2	CF ₃	H	N	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
7-90	2	CF ₃	H	N	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
7-91	2	CF ₃	H	N	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
7-92	2	CF ₃	H	N	2-Pyn	
7-93	2	CF ₃	H	N	3-Pyn	
7-94	2	CF ₃	H	N	4-Pyn	
7-95	2	CF ₃	H	N	6-Cl-2-Pyn	
7-96	2	CF ₃	H	N	6-CF ₃ -2-Pyn	
7-97	2	CF ₃	H	N	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
7-98	2	CF ₃	H	N	2-Pym	
7-99	2	CF ₃	H	N	4-Pym	
7-100	2	CF ₃	H	N	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
7-101	2	CF ₃	H	N	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
7-102	2	CF ₃	H	N	3-Pyd	
7-103	2	CF ₃	H	N	-CO-NHMe	
7-104	2	CF ₃	H	N	-CO-NHPh	
7-105	2	CF ₃	H	N	-CO-NMePh	
7-106	2	CF ₃	H	N	-CO-NEt (c-Hex)	
7-107	3	CF ₃	H	N	Me	
7-108	3	CF ₃	H	N	t-Bu	
7-109	3	CF ₃	H	N	-CH ₂ -Ph	

第7表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	X	J ^d	R ¹³	物性
7-110	3	CF ₃	H	N	-CHMe-Ph	
7-111	3	CF ₃	H	N	-CMe ₂ -Ph	
7-112	3	CF ₃	H	N	Ph	
7-113	3	CF ₃	H	N	2-F-Ph	
7-114	3	CF ₃	H	N	2-Cl-Ph	
7-115	3	CF ₃	H	N	3-Cl-Ph	
7-116	3	CF ₃	H	N	4-Cl-Ph	
7-117	3	CF ₃	H	N	2-Me-Ph	
7-118	3	CF ₃	H	N	2-i-Pr-Ph	
7-119	3	CF ₃	H	N	2-OMe-Ph	
7-120	3	CF ₃	H	N	2-SMe-Ph	
7-121	3	CF ₃	H	N	2-SOMe-Ph	
7-122	3	CF ₃	H	N	2-SO ₂ Me-Ph	
7-123	3	CF ₃	H	N	2-CN-Ph	
7-124	3	CF ₃	H	N	2-NO ₂ -Ph	
7-125	3	CF ₃	H	N	2-CF ₃ -Ph	
7-126	3	CF ₃	H	N	2-OCF ₃ -Ph	
7-127	3	CF ₃	H	N	2-SCF ₃ -Ph	
7-128	3	CF ₃	H	N	2-SOCF ₃ -Ph	
7-129	3	CF ₃	H	N	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
7-130	3	CF ₃	H	N	2-CO ₂ Me-Ph	
7-131	3	CF ₃	H	N	2-Ph-Ph	
7-132	3	CF ₃	H	N	2-PhO-Ph	
7-133	3	CF ₃	H	N	4-PhO-Ph	
7-134	3	CF ₃	H	N	2, 6-F ₂ -Ph	
7-135	3	CF ₃	H	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	
7-136	3	CF ₃	H	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
7-137	3	CF ₃	H	N	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
7-138	3	CF ₃	H	N	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
7-139	3	CF ₃	H	N	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
7-140	3	CF ₃	H	N	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
7-141	3	CF ₃	H	N	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
7-142	3	CF ₃	H	N	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
7-143	3	CF ₃	H	N	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
7-144	3	CF ₃	H	N	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
7-145	3	CF ₃	H	N	2-Pyn	
7-146	3	CF ₃	H	N	3-Pyn	
7-147	3	CF ₃	H	N	4-Pyn	
7-148	3	CF ₃	H	N	6-Cl-2-Pyn	
7-149	3	CF ₃	H	N	6-CF ₃ -2-Pyn	

第7表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	X	J ^d	R ¹³	物性
7-150	3	CF ₃	H	N	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
7-151	3	CF ₃	H	N	2-Pym	
7-152	3	CF ₃	H	N	4-Pym	
7-153	3	CF ₃	H	N	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
7-154	3	CF ₃	H	N	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
7-155	3	CF ₃	H	N	3-Pyd	
7-156	3	CF ₃	H	N	-CO-NHMe	
7-157	3	CF ₃	H	N	-CO-NHPh	
7-158	3	CF ₃	H	N	-CO-NMePh	
7-159	3	CF ₃	H	N	-CO-NEt (c-Hex)	
7-160	4	CF ₃	H	N	Me	
7-161	4	CF ₃	H	N	t-Bu	
7-162	4	CF ₃	H	N	-CH ₂ -Ph	
7-163	4	CF ₃	H	N	-CHMe-Ph	
7-164	4	CF ₃	H	N	-CMe ₂ -Ph	
7-165	4	CF ₃	H	N	Ph	
7-166	4	CF ₃	H	N	2-F-Ph	
7-167	4	CF ₃	H	N	2-Cl-Ph	
7-168	4	CF ₃	H	N	3-Cl-Ph	
7-169	4	CF ₃	H	N	4-Cl-Ph	
7-170	4	CF ₃	H	N	2-Me-Ph	
7-171	4	CF ₃	H	N	2-i-Pr-Ph	
7-172	4	CF ₃	H	N	2-OMe-Ph	
7-173	4	CF ₃	H	N	2-SMe-Ph	
7-174	4	CF ₃	H	N	2-SOMe-Ph	
7-175	4	CF ₃	H	N	2-SO ₂ Me-Ph	
7-176	4	CF ₃	H	N	2-CN-Ph	
7-177	4	CF ₃	H	N	2-NO ₂ -Ph	
7-178	4	CF ₃	H	N	2-CF ₃ -Ph	
7-179	4	CF ₃	H	N	2-OCF ₃ -Ph	
7-180	4	CF ₃	H	N	2-SCF ₃ -Ph	
7-181	4	CF ₃	H	N	2-SOCF ₃ -Ph	
7-182	4	CF ₃	H	N	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
7-183	4	CF ₃	H	N	2-CO ₂ Me-Ph	
7-184	4	CF ₃	H	N	2-Ph-Ph	
7-185	4	CF ₃	H	N	2-PhO-Ph	
7-186	4	CF ₃	H	N	2, 6-F ₂ -Ph	
7-187	4	CF ₃	H	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	
7-188	4	CF ₃	H	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
7-189	4	CF ₃	H	N	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	

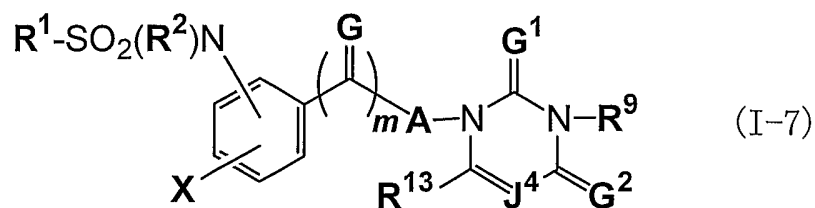
第7表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	X	J ¹	R ¹³	物性
7-190	4	CF ₃	H	N	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
7-191	4	CF ₃	H	N	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
7-192	4	CF ₃	H	N	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
7-193	4	CF ₃	H	N	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
7-194	4	CF ₃	H	N	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
7-195	4	CF ₃	H	N	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
7-196	4	CF ₃	H	N	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
7-197	4	CF ₃	H	N	2-Pyn	
7-198	4	CF ₃	H	N	3-Pyn	
7-199	4	CF ₃	H	N	4-Pyn	
7-200	4	CF ₃	H	N	6-Cl-2-Pyn	
7-201	4	CF ₃	H	N	6-CF ₃ -2-Pyn	
7-202	4	CF ₃	H	N	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
7-203	4	CF ₃	H	N	2-Pym	
7-204	4	CF ₃	H	N	4-Pym	
7-205	4	CF ₃	H	N	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
7-206	4	CF ₃	H	N	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
7-207	4	CF ₃	H	N	3-Pyd	
7-208	4	CF ₃	H	N	-CO-NHMe	
7-209	4	CF ₃	H	N	-CO-NHPh	
7-210	4	CF ₃	H	N	-CO-NMePh	
7-211	4	CF ₃	H	N	-CO-NEt (c-Hex)	
7-212	2	CHF ₂	H	N	Me	
7-213	2	CHF ₂	H	N	t-Bu	
7-214	2	CHF ₂	H	N	-CH ₂ -Ph	
7-215	2	CHF ₂	H	N	-CHMe-Ph	
7-216	2	CHF ₂	H	N	-CMe ₂ -Ph	
7-217	2	CHF ₂	H	N	Ph	114.9
7-218	2	CHF ₂	H	N	2-F-Ph	
7-219	2	CHF ₂	H	N	2-Cl-Ph	
7-220	2	CHF ₂	H	N	3-Cl-Ph	
7-221	2	CHF ₂	H	N	4-Cl-Ph	
7-222	2	CHF ₂	H	N	2-Me-Ph	
7-223	2	CHF ₂	H	N	2-i-Pr-Ph	
7-224	2	CHF ₂	H	N	2-OMe-Ph	
7-225	2	CHF ₂	H	N	2-SMe-Ph	
7-226	2	CHF ₂	H	N	2-SOMe-Ph	
7-227	2	CHF ₂	H	N	2-SO ₂ Me-Ph	
7-228	2	CHF ₂	H	N	2-CN-Ph	
7-229	2	CHF ₂	H	N	2-NO ₂ -Ph	

第7表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	X	J ^d	R ¹³	物性
7-230	2	CHF ₂	H	N	2-CF ₃ -Ph	
7-231	2	CHF ₂	H	N	2-OCF ₃ -Ph	
7-232	2	CHF ₂	H	N	2-SCF ₃ -Ph	
7-233	2	CHF ₂	H	N	2-SOCF ₃ -Ph	
7-234	2	CHF ₂	H	N	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
7-235	2	CHF ₂	H	N	2-CO ₂ Me-Ph	
7-236	2	CHF ₂	H	N	2-Ph-Ph	
7-237	2	CHF ₂	H	N	2-PhO-Ph	
7-238	2	CHF ₂	H	N	2, 6-F ₂ -Ph	
7-239	2	CHF ₂	H	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	
7-240	2	CHF ₂	H	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
7-241	2	CHF ₂	H	N	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
7-242	2	CHF ₂	H	N	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
7-243	2	CHF ₂	H	N	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
7-244	2	CHF ₂	H	N	2, 3, 4-Cl ₃ -Ph	
7-245	2	CHF ₂	H	N	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
7-246	2	CHF ₂	H	N	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
7-247	2	CHF ₂	H	N	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
7-248	2	CHF ₂	H	N	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
7-249	2	CHF ₂	H	N	2-Pyn	
7-250	2	CHF ₂	H	N	3-Pyn	
7-251	2	CHF ₂	H	N	4-Pyn	
7-252	2	CHF ₂	H	N	6-Cl-2-Pyn	
7-253	2	CHF ₂	H	N	6-CF ₃ -2-Pyn	
7-254	2	CHF ₂	H	N	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
7-255	2	CHF ₂	H	N	2-Pym	
7-256	2	CHF ₂	H	N	4-Pym	
7-257	2	CHF ₂	H	N	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
7-258	2	CHF ₂	H	N	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
7-259	2	CHF ₂	H	N	3-Pyd	
7-260	2	CHF ₂	H	N	-CO-NHMe	
7-261	2	CHF ₂	H	N	-CO-NHPh	
7-262	2	CHF ₂	H	N	-CO-NMePh	
7-263	2	CHF ₂	H	N	-CO-NEt (c-Hex)	

一般式 (I-7)

第8表 (R¹=CF₃、R²=H、m=0、A=-CH₂-、G¹=G²=O)

No.	置換位置	X	J ⁴	R ¹³	R ⁹	物性
8-1	2	H	CH	H	Me	
8-2	2	H	CH	H	t-Bu	
8-3	2	H	CH	H	-CH ₂ -Ph	
8-4	2	H	CH	H	-CHMe-Ph	
8-5	2	H	CH	H	-CMe ₂ -Ph	
8-6	2	H	CH	H	Ph	
8-7	2	H	CH	H	2-F-Ph	
8-8	2	H	CH	H	2-Cl-Ph	
8-9	2	H	CH	H	3-Cl-Ph	
8-10	2	H	CH	H	4-Cl-Ph	
8-11	2	H	CH	H	2-Me-Ph	
8-12	2	H	CH	H	2-i-Pr-Ph	
8-13	2	H	CH	H	2-OMe-Ph	
8-14	2	H	CH	H	2-SMe-Ph	
8-15	2	H	CH	H	2-SOMe-Ph	
8-16	2	H	CH	H	2-SO ₂ Me-Ph	
8-17	2	H	CH	H	2-CN-Ph	
8-18	2	H	CH	H	2-NO ₂ -Ph	
8-19	2	H	CH	H	2-CF ₃ -Ph	
8-20	2	H	CH	H	2-OCF ₃ -Ph	
8-21	2	H	CH	H	2-SCF ₃ -Ph	
8-22	2	H	CH	H	2-SOCF ₃ -Ph	
8-23	2	H	CH	H	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
8-24	2	H	CH	H	2-CO ₂ Me-Ph	
8-25	2	H	CH	H	2-Ph-Ph	
8-26	2	H	CH	H	2-PhO-Ph	
8-27	2	H	CH	H	2, 6-F ₂ -Ph	
8-28	2	H	CH	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
8-29	2	H	CH	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
8-30	2	H	CH	H	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
8-31	2	H	CH	H	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	

第8表 (続き)

No.	置換位置	X	J ⁴	R ¹³	R ⁹	物性
8-32	2	H	CH	H	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
8-33	2	H	CH	H	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
8-34	2	H	CH	H	2-Pyn	
8-35	2	H	CH	H	3-Pyn	
8-36	2	H	CH	H	4-Pyn	
8-37	2	H	CH	H	6-Cl-2-Pyn	
8-38	2	H	CH	H	6-CF ₃ -2-Pyn	
8-39	2	H	CH	H	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
8-40	2	H	CH	H	2-Pym	
8-41	2	H	CH	H	4-Pym	
8-42	2	H	CH	H	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
8-43	2	H	CH	H	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
8-44	2	H	CH	H	3-Pyd	
8-45	2	H	CH	H	-CO-NHMe	
8-46	2	H	CH	H	-CO-NHPh	
8-47	2	H	CH	H	-CO-NMePh	
8-48	2	H	CH	H	-CO-NEt (c-Hex)	
8-49	2	H	CH	Me	Me	
8-50	2	H	CH	Me	t-Bu	
8-51	2	H	CH	Me	-CH ₂ -Ph	
8-52	2	H	CH	Me	-CHMe-Ph	
8-53	2	H	CH	Me	-CMe ₂ -Ph	
8-54	2	H	CH	Me	Ph	
8-55	2	H	CH	Me	2-F-Ph	
8-56	2	H	CH	Me	2-Cl-Ph	105-106
8-57	2	H	CH	Me	3-Cl-Ph	
8-58	2	H	CH	Me	4-Cl-Ph	
8-59	2	H	CH	Me	2-Me-Ph	
8-60	2	H	CH	Me	2-i-Pr-Ph	
8-61	2	H	CH	Me	2-OMe-Ph	
8-62	2	H	CH	Me	2-SMe-Ph	
8-63	2	H	CH	Me	2-SOMe-Ph	
8-64	2	H	CH	Me	2-SO ₂ Me-Ph	
8-65	2	H	CH	Me	2-CN-Ph	
8-66	2	H	CH	Me	2-NO ₂ -Ph	
8-67	2	H	CH	Me	2-CF ₃ -Ph	
8-68	2	H	CH	Me	2-OCF ₃ -Ph	
8-69	2	H	CH	Me	2-SCF ₃ -Ph	
8-70	2	H	CH	Me	2-SOCF ₃ -Ph	
8-71	2	H	CH	Me	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	

第8表 (続き)

No.	置換位置	X	J ^d	R ¹³	R ⁹	物性
8-72	2	H	CH	Me	2-CO ₂ Me-Ph	
8-73	2	H	CH	Me	2-Ph-Ph	
8-74	2	H	CH	Me	2-PhO-Ph	
8-75	2	H	CH	Me	2, 6-F ₂ -Ph	
8-76	2	H	CH	Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	
8-77	2	H	CH	Me	2, 6-Me ₂ -Ph	
8-78	2	H	CH	Me	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
8-79	2	H	CH	Me	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
8-80	2	H	CH	Me	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
8-81	2	H	CH	Me	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
8-82	2	H	CH	Me	2-Pyn	
8-83	2	H	CH	Me	3-Pyn	
8-84	2	H	CH	Me	4-Pyn	
8-85	2	H	CH	Me	6-Cl-2-Pyn	
8-86	2	H	CH	Me	6-CF ₃ -2-Pyn	
8-87	2	H	CH	Me	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
8-88	2	H	CH	Me	2-Pym	
8-89	2	H	CH	Me	4-Pym	
8-90	2	H	CH	Me	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
8-91	2	H	CH	Me	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
8-92	2	H	CH	Me	3-Pyd	
8-93	2	H	CH	Me	-CO-NHMe	
8-94	2	H	CH	Me	-CO-NHPh	
8-95	2	H	CH	Me	-CO-NMePh	
8-96	2	H	CH	Me	-CO-NEt (c-Hex)	
8-97	2	H	N	Me	Me	
8-98	2	H	N	Me	t-Bu	
8-99	2	H	N	Me	-CH ₂ -Ph	
8-100	2	H	N	Me	-CHMe-Ph	
8-101	2	H	N	Me	-CMe ₂ -Ph	
8-102	2	H	N	Me	Ph	
8-103	2	H	N	Me	2-F-Ph	
8-104	2	H	N	Me	2-Cl-Ph	
8-105	2	H	N	Me	3-Cl-Ph	
8-106	2	H	N	Me	4-Cl-Ph	
8-107	2	H	N	Me	2-Me-Ph	
8-108	2	H	N	Me	2-i-Pr-Ph	
8-109	2	H	N	Me	2-OMe-Ph	
8-110	2	H	N	Me	2-SMe-Ph	
8-111	2	H	N	Me	2-SOMe-Ph	

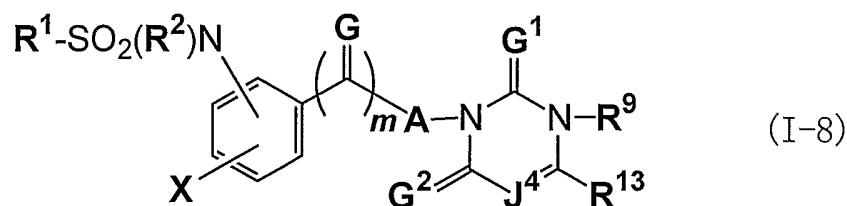
第8表 (続き)

No.	置換位置	X	J ⁴	R ¹³	R ⁹	物性
8-112	2	H	N	Me	2-SO ₂ Me-Ph	
8-113	2	H	N	Me	2-CN-Ph	
8-114	2	H	N	Me	2-NO ₂ -Ph	
8-115	2	H	N	Me	2-CF ₃ -Ph	
8-116	2	H	N	Me	2-OCF ₃ -Ph	
8-117	2	H	N	Me	2-SCF ₃ -Ph	
8-118	2	H	N	Me	2-SOCF ₃ -Ph	
8-119	2	H	N	Me	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
8-120	2	H	N	Me	2-CO ₂ Me-Ph	
8-121	2	H	N	Me	2-Ph-Ph	
8-122	2	H	N	Me	2-PhO-Ph	
8-123	2	H	N	Me	2, 6-F ₂ -Ph	
8-124	2	H	N	Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	
8-125	2	H	N	Me	2, 6-Me ₂ -Ph	
8-126	2	H	N	Me	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
8-127	2	H	N	Me	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
8-128	2	H	N	Me	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
8-129	2	H	N	Me	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
8-130	2	H	N	Me	2-Pyn	
8-131	2	H	N	Me	3-Pyn	
8-132	2	H	N	Me	4-Pyn	
8-133	2	H	N	Me	6-Cl-2-Pyn	
8-134	2	H	N	Me	6-CF ₃ -2-Pyn	
8-135	2	H	N	Me	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
8-136	2	H	N	Me	2-Pym	
8-137	2	H	N	Me	4-Pym	
8-138	2	H	N	Me	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
8-139	2	H	N	Me	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
8-140	2	H	N	Me	3-Pyd	
8-141	2	H	N	Me	-CO-NHMe	
8-142	2	H	N	Me	-CO-NHPh	
8-143	2	H	N	Me	-CO-NMePh	
8-144	2	H	N	Me	-CO-NEt (c-Hex)	
8-145	4	H	CH	H	Me	
8-146	4	H	CH	H	t-Bu	
8-147	4	H	CH	H	-CH ₂ -Ph	
8-148	4	H	CH	H	-CHMe-Ph	
8-149	4	H	CH	H	-CMe ₂ -Ph	
8-150	4	H	CH	H	Ph	
8-151	4	H	CH	H	2-Cl-Ph	

第8表 (続き)

No.	置換位置	X	J ^d	R ¹³	R ⁹	物性
8-152	4	H	CH	H	2-Me-Ph	
8-153	4	H	CH	H	3-Me-Ph	
8-154	4	H	CH	H	4-Me-Ph	
8-155	4	H	CH	H	2-OMe-Ph	
8-156	4	H	CH	H	2-CN-Ph	
8-157	4	H	CH	H	2-NO ₂ -Ph	
8-158	4	H	CH	H	2-CF ₃ -Ph	
8-159	4	H	CH	H	2-OCF ₃ -Ph	
8-160	4	H	CH	H	2-CO ₂ Me-Ph	
8-161	4	H	CH	H	2-Ph-Ph	
8-162	4	H	CH	H	2-PhO-Ph	
8-163	4	H	CH	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
8-164	4	H	CH	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
8-165	4	H	CH	H	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
8-166	4	H	CH	H	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
8-167	4	H	CH	H	2-Pyn	
8-168	4	H	CH	H	3-Pyn	
8-169	4	H	CH	H	4-Pyn	
8-170	4	H	CH	H	2-Pym	
8-171	4	H	CH	H	4-Pym	
8-172	4	H	CH	H	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
8-173	4	H	CH	H	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
8-174	4	H	CH	H	3-Pyd	

一般式 (I-8)

第9表 (R¹=CF₃、R²=H、m=0、A=-CH₂-、G¹=G²=0)

No.	置換位置	X	J ⁴	R ¹³	R ⁹	物性
9-1	2	H	CH	H	Me	
9-2	2	H	CH	H	t-Bu	
9-3	2	H	CH	H	-CH ₂ -Ph	
9-4	2	H	CH	H	-CHMe-Ph	
9-5	2	H	CH	H	-CMe ₂ -Ph	
9-6	2	H	CH	H	Ph	
9-7	2	H	CH	H	2-F-Ph	
9-8	2	H	CH	H	2-Cl-Ph	
9-9	2	H	CH	H	3-Cl-Ph	
9-10	2	H	CH	H	4-Cl-Ph	
9-11	2	H	CH	H	2-Me-Ph	
9-12	2	H	CH	H	2-i-Pr-Ph	
9-13	2	H	CH	H	2-OMe-Ph	
9-14	2	H	CH	H	2-SMe-Ph	
9-15	2	H	CH	H	2-SOMe-Ph	
9-16	2	H	CH	H	2-SO ₂ Me-Ph	
9-17	2	H	CH	H	2-CN-Ph	
9-18	2	H	CH	H	2-NO ₂ -Ph	
9-19	2	H	CH	H	2-CF ₃ -Ph	
9-20	2	H	CH	H	2-OCF ₃ -Ph	
9-21	2	H	CH	H	2-SCF ₃ -Ph	
9-22	2	H	CH	H	2-SOCF ₃ -Ph	
9-23	2	H	CH	H	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
9-24	2	H	CH	H	2-CO ₂ Me-Ph	
9-25	2	H	CH	H	2-Ph-Ph	
9-26	2	H	CH	H	2-PhO-Ph	
9-27	2	H	CH	H	2, 6-F ₂ -Ph	
9-28	2	H	CH	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
9-29	2	H	CH	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
9-30	2	H	CH	H	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
9-31	2	H	CH	H	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
9-32	2	H	CH	H	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	

第9表 (続き)

No.	置換位置	X	J ⁴	R ¹³	R ⁹	物性
9-33	2	H	CH	H	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
9-34	2	H	CH	H	2-Pyn	
9-35	2	H	CH	H	3-Pyn	
9-36	2	H	CH	H	4-Pyn	
9-37	2	H	CH	H	6-Cl-2-Pyn	
9-38	2	H	CH	H	6-CF ₃ -2-Pyn	
9-39	2	H	CH	H	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
9-40	2	H	CH	H	2-Pym	
9-41	2	H	CH	H	4-Pym	
9-42	2	H	CH	H	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
9-43	2	H	CH	H	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
9-44	2	H	CH	H	3-Pyd	
9-45	2	H	CH	H	-CO-NHMe	
9-46	2	H	CH	H	-CO-NHPh	
9-47	2	H	CH	H	-CO-NMePh	
9-48	2	H	CH	H	-CO-NEt (c-Hex)	
9-49	2	H	CH	Me	Me	
9-50	2	H	CH	Me	t-Bu	
9-51	2	H	CH	Me	-CH ₂ -Ph	
9-52	2	H	CH	Me	-CHMe-Ph	
9-53	2	H	CH	Me	-CMe ₂ -Ph	
9-54	2	H	CH	Me	Ph	
9-55	2	H	CH	Me	2-F-Ph	
9-56	2	H	CH	Me	2-Cl-Ph	166-167
9-57	2	H	CH	Me	3-Cl-Ph	
9-58	2	H	CH	Me	4-Cl-Ph	
9-59	2	H	CH	Me	2-Me-Ph	
9-60	2	H	CH	Me	2-i-Pr-Ph	
9-61	2	H	CH	Me	2-OMe-Ph	
9-62	2	H	CH	Me	2-SMe-Ph	
9-63	2	H	CH	Me	2-SOMe-Ph	
9-64	2	H	CH	Me	2-SO ₂ Me-Ph	
9-65	2	H	CH	Me	2-CN-Ph	
9-66	2	H	CH	Me	2-NO ₂ -Ph	
9-67	2	H	CH	Me	2-CF ₃ -Ph	
9-68	2	H	CH	Me	2-OCF ₃ -Ph	
9-69	2	H	CH	Me	2-SCF ₃ -Ph	
9-70	2	H	CH	Me	2-SOCF ₃ -Ph	
9-71	2	H	CH	Me	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
9-72	2	H	CH	Me	2-CO ₂ Me-Ph	

第9表 (続き)

No.	置換位置	X	J ^d	R ¹³	R ⁹	物性
9-73	2	H	CH	Me	2-Ph-Ph	
9-74	2	H	CH	Me	2-PhO-Ph	
9-75	2	H	CH	Me	2,6-F ₂ -Ph	
9-76	2	H	CH	Me	2,6-Cl ₂ -Ph	
9-77	2	H	CH	Me	2,6-Me ₂ -Ph	
9-78	2	H	CH	Me	2,4,6-Cl ₃ -Ph	
9-79	2	H	CH	Me	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
9-80	2	H	CH	Me	2,6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
9-81	2	H	CH	Me	2,3,4-Me ₃ -Ph	
9-82	2	H	CH	Me	2-Pyn	
9-83	2	H	CH	Me	3-Pyn	
9-84	2	H	CH	Me	4-Pyn	
9-85	2	H	CH	Me	6-Cl-2-Pyn	
9-86	2	H	CH	Me	6-CF ₃ -2-Pyn	
9-87	2	H	CH	Me	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
9-88	2	H	CH	Me	2-Pym	
9-89	2	H	CH	Me	4-Pym	
9-90	2	H	CH	Me	4,6-Me ₂ -2-Pym	
9-91	2	H	CH	Me	4,6-(OMe) ₂ -2-Pym	
9-92	2	H	CH	Me	3-Pyd	
9-93	2	H	CH	Me	-CO-NHMe	
9-94	2	H	CH	Me	-CO-NHPh	
9-95	2	H	CH	Me	-CO-NMePh	
9-96	2	H	CH	Me	-CO-NEt (c-Hex)	
9-97	2	H	N	Me	Me	
9-98	2	H	N	Me	t-Bu	
9-99	2	H	N	Me	-CH ₂ -Ph	
9-100	2	H	N	Me	-CHMe-Ph	
9-101	2	H	N	Me	-CMe ₂ -Ph	
9-102	2	H	N	Me	Ph	
9-103	2	H	N	Me	2-F-Ph	
9-104	2	H	N	Me	2-Cl-Ph	
9-105	2	H	N	Me	3-Cl-Ph	
9-106	2	H	N	Me	4-Cl-Ph	
9-107	2	H	N	Me	2-Me-Ph	
9-108	2	H	N	Me	2-i-Pr-Ph	
9-109	2	H	N	Me	2-OMe-Ph	
9-110	2	H	N	Me	2-SMe-Ph	
9-111	2	H	N	Me	2-SOMe-Ph	
9-112	2	H	N	Me	2-SO ₂ Me-Ph	

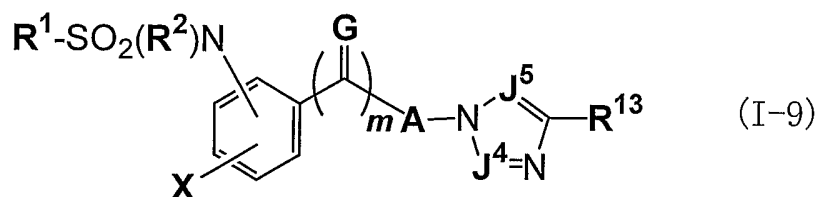
第9表 (続き)

No.	置換位置	X	J ⁴	R ¹³	R ⁹	物性
9-113	2	H	N	Me	2-CN-Ph	
9-114	2	H	N	Me	2-NO ₂ -Ph	
9-115	2	H	N	Me	2-CF ₃ -Ph	
9-116	2	H	N	Me	2-OCF ₃ -Ph	
9-117	2	H	N	Me	2-SCF ₃ -Ph	
9-118	2	H	N	Me	2-SOCF ₃ -Ph	
9-119	2	H	N	Me	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
9-120	2	H	N	Me	2-CO ₂ Me-Ph	
9-121	2	H	N	Me	2-Ph-Ph	
9-122	2	H	N	Me	2-PhO-Ph	
9-123	2	H	N	Me	2, 6-F ₂ -Ph	
9-124	2	H	N	Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	
9-125	2	H	N	Me	2, 6-Me ₂ -Ph	
9-126	2	H	N	Me	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
9-127	2	H	N	Me	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
9-128	2	H	N	Me	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
9-129	2	H	N	Me	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
9-130	2	H	N	Me	2-Pyn	
9-131	2	H	N	Me	3-Pyn	
9-132	2	H	N	Me	4-Pyn	
9-133	2	H	N	Me	6-Cl-2-Pyn	
9-134	2	H	N	Me	6-CF ₃ -2-Pyn	
9-135	2	H	N	Me	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
9-136	2	H	N	Me	2-Pym	
9-137	2	H	N	Me	4-Pym	
9-138	2	H	N	Me	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
9-139	2	H	N	Me	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
9-140	2	H	N	Me	3-Pyd	
9-141	2	H	N	Me	-CO-NHMe	
9-142	2	H	N	Me	-CO-NHPh	
9-143	2	H	N	Me	-CO-NMePh	
9-144	2	H	N	Me	-CO-NEt (c-Hex)	
9-145	4	H	CH	H	Me	
9-146	4	H	CH	H	t-Bu	
9-147	4	H	CH	H	-CH ₂ -Ph	
9-148	4	H	CH	H	-CHMe-Ph	
9-149	4	H	CH	H	-CMe ₂ -Ph	
9-150	4	H	CH	H	Ph	
9-151	4	H	CH	H	2-Cl-Ph	
9-152	4	H	CH	H	2-Me-Ph	

第9表 (続き)

No.	置換位置	X	J ^d	R ¹³	R ⁹	物性
9-153	4	H	CH	H	2-OMe-Ph	
9-154	4	H	CH	H	2-CN-Ph	
9-155	4	H	CH	H	2-NO ₂ -Ph	
9-156	4	H	CH	H	2-CF ₃ -Ph	
9-157	4	H	CH	H	2-OCF ₃ -Ph	
9-158	4	H	CH	H	2-CO ₂ Me-Ph	
9-159	4	H	CH	H	2-Ph-Ph	
9-160	4	H	CH	H	2-PhO-Ph	
9-161	4	H	CH	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	
9-162	4	H	CH	H	2, 6-Me ₂ -Ph	
9-163	4	H	CH	H	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
9-164	4	H	CH	H	2, 3, 4-Me ₃ -Ph	
9-165	4	H	CH	H	2-Pyn	
9-166	4	H	CH	H	3-Pyn	
9-167	4	H	CH	H	4-Pyn	
9-168	4	H	CH	H	2-Pym	
9-169	4	H	CH	H	4-Pym	
9-170	4	H	CH	H	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
9-171	4	H	CH	H	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
9-172	4	H	CH	H	3-Pyd	

一般式 (I-9)

第10表 (m=0、A=-CH₂-)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁴	J ⁵	R ¹³	物性 [融点(°C)、屈折率]
10-1	2	CF ₃	H	H	CH	CH	Ph	251-252
10-2	2	CF ₃	H	H	N	CH	Ph	NMR-7
10-3	2	CF ₃	H	H	N	N	Me	
10-4	2	CF ₃	H	H	N	N	t-Bu	
10-5	2	CF ₃	H	H	N	N	-CH ₂ -Ph	
10-6	2	CF ₃	H	H	N	N	-CHMe-Ph	
10-7	2	CF ₃	H	H	N	N	-CMe ₂ -Ph	
10-8	2	CF ₃	H	H	N	N	Ph	119-120
10-9	2	CF ₃	H	H	N	N	2-F-Ph	
10-10	2	CF ₃	H	H	N	N	3-F-Ph	
10-11	2	CF ₃	H	H	N	N	4-F-Ph	
10-12	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-Ph	1. 5581 (26°C)
10-13	2	CF ₃	H	H	N	N	3-Cl-Ph	1. 5490 (26°C)
10-14	2	CF ₃	H	H	N	N	4-Cl-Ph	1. 5492 (26°C)
10-15	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Me-Ph	87-88
10-16	2	CF ₃	H	H	N	N	3-Me-Ph	89-90
10-17	2	CF ₃	H	H	N	N	4-Me-Ph	98-99
10-18	2	CF ₃	H	H	N	N	2-OMe-Ph	124-125
10-19	2	CF ₃	H	H	N	N	3-OMe-Ph	122-123
10-20	2	CF ₃	H	H	N	N	4-OMe-Ph	100-101
10-21	2	CF ₃	H	H	N	N	2-SMe-Ph	90-91
10-22	2	CF ₃	H	H	N	N	3-SMe-Ph	
10-23	2	CF ₃	H	H	N	N	4-SMe-Ph	104-105
10-24	2	CF ₃	H	H	N	N	2-SOMe-Ph	176-178
10-25	2	CF ₃	H	H	N	N	3-SOMe-Ph	
10-26	2	CF ₃	H	H	N	N	4-SOMe-Ph	162-165
10-27	2	CF ₃	H	H	N	N	2-CN-Ph	
10-28	2	CF ₃	H	H	N	N	2-NO ₂ -Ph	111-112
10-29	2	CF ₃	H	H	N	N	2-CF ₃ -Ph	123-124
10-30	2	CF ₃	H	H	N	N	2-OCF ₃ -Ph	
10-31	2	CF ₃	H	H	N	N	2-SCF ₃ -Ph	
10-32	2	CF ₃	H	H	N	N	2-SOCF ₃ -Ph	

第10表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁴	J ⁵	R ¹³	物性 [融点(°C)、屈折率]
10-33	2	CF ₃	H	H	N	N	2-SO ₂ CF ₃ -Ph	
10-34	2	CF ₃	H	H	N	N	4-CO ₂ Et-Ph	1. 5332 (22°C)
10-35	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-F ₂ -Ph	132-134
10-36	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 3-Cl ₂ -Ph	
10-37	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 4-Cl ₂ -Ph	92-93
10-38	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 5-Cl ₂ -Ph	
10-39	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	170-171
10-40	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-6-F-Ph	150-151
10-41	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
10-42	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-6-Me-Ph	
10-43	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
10-44	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
10-45	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	
10-46	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 4, 6-Me ₃ -Ph	
10-47	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Pyn	
10-48	2	CF ₃	H	H	N	N	3-Pyn	
10-49	2	CF ₃	H	H	N	N	4-Pyn	
10-50	2	CF ₃	H	H	N	N	6-Cl-2-Pyn	
10-51	2	CF ₃	H	H	N	N	6-CF ₃ -2-Pyn	
10-52	2	CF ₃	H	H	N	N	6-Cl-4-CF ₃ -2-Pyn	
10-53	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Pym	
10-54	2	CF ₃	H	H	N	N	4-Pym	
10-55	2	CF ₃	H	H	N	N	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
10-56	2	CF ₃	H	H	N	N	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
10-57	2	CF ₃	H	H	N	N	3-Pyd	
10-58	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO ₂ Et	1. 4941 (21°C)
10-59	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO ₂ H	142-143
10-60	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NHMe	
10-61	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NHPh	
10-62	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NMePh	
10-63	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NEt ₂	
10-64	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NEt (c-Hex)	
10-65	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-N(i-Pr) ₂	
10-66	2	CF ₃	H	5-Me	N	N	Ph	
10-67	2	CF ₃	H	5-Me	N	N	2-Cl-Ph	
10-68	2	CF ₃	H	5-Me	N	N	2-Me-Ph	
10-69	2	CF ₃	H	5-Me	N	N	2-CF ₃ -Ph	
10-70	2	CF ₃	H	5-Me	N	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	
10-71	2	CF ₃	H	5-Me	N	N	2-Cl-6-Me-Ph	
10-72	2	CF ₃	H	5-Me	N	N	2, 6-Me ₂ -Ph	

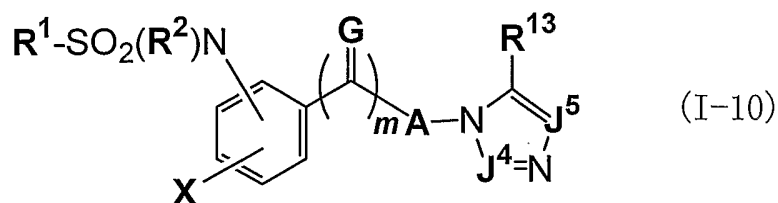
第10表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁴	J ⁵	R ¹³	物性 [融点(°C)、屈折率]
10-73	2	CF ₃	H	5-Me	N	N	-CH ₂ -Ph	
10-74	2	CF ₃	H	5-Me	N	N	-CMe ₂ -Ph	
10-75	2	CF ₃	H	4-Cl	N	N	Ph	
10-76	2	CF ₃	H	4-Cl	N	N	2-Cl-Ph	
10-77	2	CF ₃	H	4-Cl	N	N	2-Me-Ph	
10-78	2	CF ₃	H	4-Cl	N	N	2-CF ₃ -Ph	
10-79	2	CF ₃	H	4-Cl	N	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	
10-80	2	CF ₃	H	4-Cl	N	N	2-Cl-6-Me-Ph	
10-81	2	CF ₃	H	4-Cl	N	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
10-82	2	CF ₃	H	4-Cl	N	N	-CH ₂ -Ph	
10-83	2	CF ₃	H	4-Cl	N	N	-CMe ₂ -Ph	
10-84	2	CF ₃	H	5-Cl	N	N	Ph	
10-85	2	CF ₃	H	5-Cl	N	N	2-Cl-Ph	
10-86	2	CF ₃	H	5-Cl	N	N	2-Me-Ph	
10-87	2	CF ₃	H	5-Cl	N	N	2-CF ₃ -Ph	
10-88	2	CF ₃	H	5-Cl	N	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	
10-89	2	CF ₃	H	5-Cl	N	N	2-Cl-6-Me-Ph	
10-90	2	CF ₃	H	5-Cl	N	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
10-91	2	CF ₃	H	5-Cl	N	N	-CH ₂ -Ph	
10-92	2	CF ₃	H	5-Cl	N	N	-CMe ₂ -Ph	
10-93	3	CF ₃	H	H	N	N	Me	
10-94	3	CF ₃	H	H	N	N	t-Bu	
10-95	3	CF ₃	H	H	N	N	-CH ₂ -Ph	
10-96	3	CF ₃	H	H	N	N	Ph	
10-97	3	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-Ph	
10-98	3	CF ₃	H	H	N	N	2-CF ₃ -Ph	
10-99	3	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	
10-100	3	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-6-Me-Ph	
10-101	3	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
10-102	4	CF ₃	H	H	N	N	Me	
10-103	4	CF ₃	H	H	N	N	t-Bu	
10-104	4	CF ₃	H	H	N	N	-CH ₂ -Ph	
10-105	4	CF ₃	H	H	N	N	Ph	
10-106	4	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-Ph	
10-107	4	CF ₃	H	H	N	N	2-CF ₃ -Ph	
10-108	4	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	
10-109	4	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-6-Me-Ph	
10-110	4	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
10-111	2	CHF ₂	H	H	N	N	Me	
10-112	2	CHF ₂	H	H	N	N	t-Bu	

第10表 (続き)

No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁴	J ⁵	R ¹³	物性 [融点(°C)、屈折率]
10-113	2	CHF ₂	H	H	N	N	-CH ₂ -Ph	
10-114	2	CHF ₂	H	H	N	N	-CMe ₂ -Ph	
10-115	2	CHF ₂	H	H	N	N	Ph	
10-116	2	CHF ₂	H	H	N	N	2-Cl-Ph	99-100
10-117	2	CHF ₂	H	H	N	N	2-Me-Ph	
10-118	2	CHF ₂	H	H	N	N	2-OMe-Ph	
10-119	2	CHF ₂	H	H	N	N	2-CF ₃ -Ph	
10-120	2	CHF ₂	H	H	N	N	2-OCF ₃ -Ph	
10-121	2	CHF ₂	H	H	N	N	2,6-Cl ₂ -Ph	
10-122	2	CHF ₂	H	H	N	N	2-Cl-6-F-Ph	
10-123	2	CHF ₂	H	H	N	N	2-Cl-6-Me-Ph	
10-124	2	CHF ₂	H	H	N	N	2,6-Me ₂ -Ph	

一般式 (I-10)

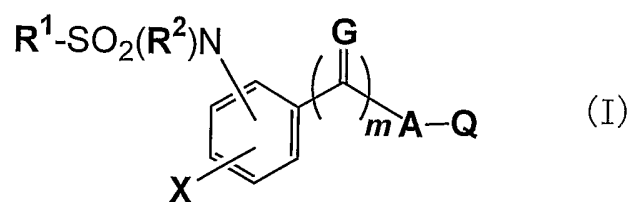
第 1 1 表 (m=0、A=-CH₂-)

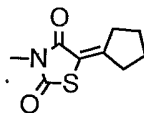
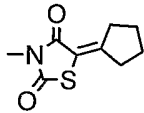
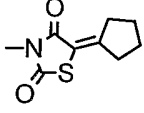
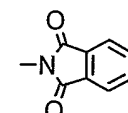
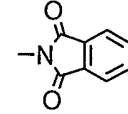
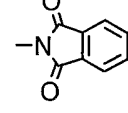
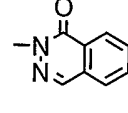
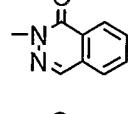
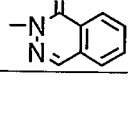
No.	置換位置	R ¹	R ²	X	J ⁴	J ⁵	R ¹³	物性 [融点 (°C)]
11-1	2	CF ₃	H	H	N	N	Me	
11-2	2	CF ₃	H	H	N	N	t-Bu	
11-3	2	CF ₃	H	H	N	N	-CH ₂ -Ph	
11-4	2	CF ₃	H	H	N	N	-CHMe-Ph	
11-5	2	CF ₃	H	H	N	N	-CMe ₂ -Ph	
11-6	2	CF ₃	H	H	N	N	Ph	
11-7	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-Ph	141-142
11-8	2	CF ₃	H	H	N	N	3-Cl-Ph	
11-9	2	CF ₃	H	H	N	N	4-Cl-Ph	
11-10	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Me-Ph	
11-11	2	CF ₃	H	H	N	N	2-OMe-Ph	156-157
11-12	2	CF ₃	H	H	N	N	2-SMe-Ph	
11-13	2	CF ₃	H	H	N	N	2-SOMe-Ph	
11-14	2	CF ₃	H	H	N	N	2-SO ₂ Me-Ph	
11-15	2	CF ₃	H	H	N	N	2-CN-Ph	
11-16	2	CF ₃	H	H	N	N	2-NO ₂ -Ph	
11-17	2	CF ₃	H	H	N	N	2-CF ₃ -Ph	
11-18	2	CF ₃	H	H	N	N	2-OCF ₃ -Ph	
11-19	2	CF ₃	H	H	N	N	4-CO ₂ Et-Ph	
11-20	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Ph-Ph	
11-21	2	CF ₃	H	H	N	N	2-PhO-Ph	
11-22	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-F ₂ -Ph	
11-23	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Cl ₂ -Ph	163-164
11-24	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-6-F-Ph	
11-25	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Me ₂ -Ph	
11-26	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Cl-6-Me-Ph	
11-27	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-(OMe) ₂ -Ph	
11-28	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-(CF ₃) ₂ -Ph	
11-29	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-(OCF ₃) ₂ -Ph	
11-30	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	
11-31	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Cl ₂ -4-CF ₃ -Ph	
11-32	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 6-Cl ₂ -4-OCF ₃ -Ph	

第 1 1 表 (続き)

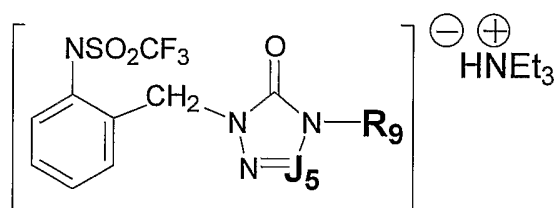
No.	置換 位置	R ¹	R ²	X	J ⁴	J ⁵	R ¹³	物性 [融点 (°C)]
11-33	2	CF ₃	H	H	N	N	2, 4, 6-Me ₃ -Ph	
11-34	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Pyn	
11-35	2	CF ₃	H	H	N	N	3-Pyn	
11-36	2	CF ₃	H	H	N	N	4-Pyn	
11-37	2	CF ₃	H	H	N	N	2-Pym	
11-38	2	CF ₃	H	H	N	N	4-Pym	
11-39	2	CF ₃	H	H	N	N	4, 6-Me ₂ -2-Pym	
11-40	2	CF ₃	H	H	N	N	4, 6-(OMe) ₂ -2-Pym	
11-41	2	CF ₃	H	H	N	N	3-Pyd	
11-42	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO ₂ Et	
11-43	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO ₂ H	
11-44	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NHMe	
11-45	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NHPh	
11-46	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NMe ₂	
11-47	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NMePh	
11-48	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-NEt (c-Hex)	
11-49	2	CF ₃	H	H	N	N	-CO-N(i-Pr) ₂	

一般式 (I)

第 1 2 表 (R¹=CF₃、R²=H、m=0、A=-CH₂-)

No.	置換位置	X	Q	物性 [融点 (°C)、屈折率]
12-1	2	H		1.5455(24°C)
12-2	3	H		
12-3	4	H		
12-4	2	H		172.1
12-5	3	H		
12-6	4	H		
12-7	2	H		115.4
12-8	3	H		
12-9	4	H		

一般式 (I-11)



第13表

No.	J ⁵	R ⁹	物性 [融点 (°C)、屈折率]
13-1	C-SMe	2-Cl-Ph	101-103
13-2	CH	2-Cl-Ph	101-103
13-3	CH	2,6-Me ₂ -Ph	123-125
13-4	CH	2-Cl-6-Me-Ph	1.5488 (26°C)

5

第1表から第13表中のNMRデータを第14表に記す。

第14表

NMR No.	化合物 No.	¹ H-NMR (CDCl ₃ /TMS, δ 値ppm)
1	1-257	10.82 (1H, bs), 7.62-7.26 (9H, m), 4.97 (2H, s), 4.01 (3H, s)
2	3-83	7.6-7.4 (8H, m), 5.3 (2H, q), 3.5 (3H, s)
3	5-29	10.39 (1H, s), 7.83 (1H, s), 7.57-7.33 (8H, m), 5.62 (1H, q), 1.97 (3H, d)
4	5-50	9.45 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.50-7.25 (8H, m), 5.31 (1H, dd), 4.60 (1H, br), 4.04 (1H, dd), 3.95 (1H, dd)
5	5-64	11.50 (1H, s), 8.01 (1H, dd), 7.86 (1H, d), 7.72-7.70 (2H, m), 7.56-7.50 (2H, m), 7.42-7.25 (3H, m), 5.92 (2H, s)
6	5-93	10.78 (1H, s), 7.92 (1H, dd), 7.68-7.65 (2H, m), 7.50 (1H, dd), 7.43-7.25 (5H, m), 5.01 (2H, s), 4.19 (3H, s)
7	10-2	9.3 (1H, br), 8.21 (1H, s), 8.01-7.99 (2H, s), 7.62 (1H, d), 7.45-7.39 (5H, m), 7.26 (1H, dd), 5.34 (2H, s)
8	6-339	9.5 (1H, s), 7.50 (1H, d), 7.44 (1H, dd), 7.39-7.23 (5H, m), 4.49 (2H, s), 3.85 (2H, dd), 3.66 (2H, dd)
9	6-361	7.57-6.92 (10H, m), 4.58 (2H, dd), 3.73 (2H, m), 3.48 (2H, m), 2.41 (6H, s),
10	6-362	9.07 (1H, s), 8.35 (1H, s), 7.45-7.13 (6H, m), 6.80 (2H, s), 4.42 (2H, s), 3.56 (4H, dd), 2.37 (6H, s), 2.22 (3H, s)

実施例1.

(1-1). 2-(2-ニトロベンジル)-4-フェニル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オンの合成

4-フェニル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン (1.61g、10ミリモル) と炭酸カリウム (1.66g、12ミリモル) をN、N-ジメチルホルムアミド (35ml) に懸濁し、ついで2-ニトロベンジルクロリド (1.80g、10.5ミリモル) を加えて50℃で4時間加熱攪拌した。室温に冷却した後、氷水を加え、析出した結晶をエーテルで洗浄し2-
10 (2-ニトロベンジル)-4-フェニル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン (2.73g、収率92%) を得た。

(1-2). 2-(2-アミノベンジル)-4-フェニル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オンの合成

2-(2-ニトロベンジル)-4-フェニル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン (2.6g、8.8ミリモル)、塩化第一スズ
15 二水和物 (7.93g、35ミリモル) をエタノール (30ml) と濃塩酸 (30ml) の混合溶媒中に加え、6時間加熱還流した。室温に冷却した後、20%水酸化ナトリウム水溶液を加えて反応液を塩基性にし、クロロホルムで抽出した。クロロホルム層を4回水洗した後、飽和食塩水で1回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。析出した結晶をヘキサンで洗浄し2-(2-ア
20 ミノベンジル)-4-フェニル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン (2.33g、収率100%) を得た。

(1-3). 4-フェニル-2-(2-トリフルオロメタンシルホニルアミノベンジル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン (化合物No. 1-23) の合成

25 2-(2-アミノベンジル)-4-フェニル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン (0.30g、1.1ミリモル) とトリエチルアミン (0.14g、1.4ミリモル) をクロロホルム (5ml) に溶解した後、反応溶液を-10℃に冷却した。ついでトリフルオロメタンシルホン酸無水物 (0.39g、1.4ミリモル) をクロロホルム0.5mlで希釈した溶液を2

分で滴下した。そのままの温度で2時間攪拌した後、徐々に反応温度を室温まで上昇させながらさらに10時間攪拌した。反応終了後、クロロホルムを減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、4-フェニル
5 2-(2-トリフルオロメタンシルホニルアミノベンジル)-2,4-ジヒド
ロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン(0.36g、収率79%)を得た。融点は141-142°Cであった。

実施例2.

- (2-1). 2-(2-クロロフェニル)-4-(2-ニトロベンジル)-2,
4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オンの合成
- 10 2-(2-クロロフェニル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリア
ゾール-3-オン(1.00g、5.1ミリモル)と炭酸カリウム(0.74g、
5.4ミリモル)をN,N-ジメチルホルムアミド(25ml)に溶解、懸濁し、
ついで2-ニトロベンジルクロリド(0.88g、5.1ミリモル)を加えて5
15 0°Cで2時間加熱攪拌した。室温に冷却した後、氷水を加え、酢酸エチルで抽出
した。酢酸エチル層を飽和食塩水で1回洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥
し溶媒を留去した。析出した結晶をヘキサソール(1:1)混合液で洗浄
し2-(2-クロロフェニル)-4-(2-ニトロベンジル)-2,4-ジヒド
ロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン(1.37g、収率81.3
%)を得た。融点は85.5°Cであった。
- 20 (2-2). 4-(2-アミノベンジル)-2-(2-クロロフェニル)-2,
4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オンの合成
- 1-(2-クロロフェニル)-2-(2-ニトロベンジル)-2,4-ジヒド
ロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン(1.25g、3.8ミリモ
ル)、鉄粉末(1.06g、18.9ミリモル)、塩化アンモニウム(0.10
25 g、1.9ミリモル)をエタノール(30ml)と水(15ml)に溶解し、2
時間加熱還流した。室温に冷却した後に、反応液を吸引ろ過し、酢酸エチルで抽
出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で1回洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾
燥し溶媒を留去した。析出した結晶をヘキサソール(1:1)混合液で洗
浄し4-(2-アミノベンジル)-2-(2-クロロフェニル)-2,4-ジヒ

ドロー3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン (0.55 g、収率48.2%)を得た。融点は168.6°Cであった。

(2-3). 2-(2-クロロフェニル)-4-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン (化合物No. 2-27) の合成

4-(2-アミノベンジル)-2-(2-クロロフェニル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン (0.50 g、1.7ミリモル) とトリエチルアミン (0.18 g、1.8ミリモル) をクロロホルム (20 ml) に溶解した後、反応溶液を-10°Cに冷却した。ついでトリフルオロメタンスルホン酸無水物 (0.47 g、1.7ミリモル) を20分かけて滴下した。そのままの温度で2時間攪拌した後、氷を加え、さらに6N塩酸を加えて反応液を酸性にし、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で1回洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) で精製して2-(2-クロロフェニル)-4-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン (0.38 g、収率51.7%)を得た。融点は187.9°Cであった。

実施例3.

(3-1). 4-(2-ニトロベンジル)-1-(2-トリフルオロメチルフェニル)-5(4H)-テトラゾリノンの合成

1-(2-トリフルオロメチルフェニル)-5(4H)-テトラゾリノン (2.5 g、11ミリモル) と炭酸カリウム (2.2 g、16ミリモル) をN、N-ジメチルホルムアミド (25 ml) に溶解、懸濁し、ついでp-トルエンスルホン酸 2-ニトロベンジルエステル (3.7 g、12ミリモル) を加えて50°Cで2時間加熱攪拌した。室温に冷却した後、氷水を加え、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で1回洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。析出した結晶をヘキサンで洗浄し4-(2-ニトロベンジル)-1-(2-トリフルオロメチルフェニル)-5(4H)-テトラゾリノン (3.8 g、収率94%)を得た。

(3-2). 4-(2-アミノベンジル)-1-(2-トリフルオロメチルフェニル)-5(4H)-テトラゾリノンの合成

4-(2-ニトロベンジル)-1-(2-トリフルオロメチルフェニル)-5(4H)-テトラゾリノン(2.0g、5ミリモル)、塩化第一スズ 二水和物(4.9g、22ミリモル)をエタノール(20ml)と濃塩酸(20ml)に溶解し、5時間加熱還流した。室温に冷却した後に、10%水酸化ナトリウム水溶液を加えて反応液を塩基性にし、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で1回洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。析出した結晶をヘキサンで洗浄し4-(2-アミノベンジル)-1-(2-トリフルオロメチルフェニル)-5(4H)-テトラゾリノン(1.3g、収率70%)を得た。

(3-3). 1-(2-トリフルオロメチルフェニル)-4-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)-5(4H)-テトラゾリノン(化合物No. 3-38)の合成

4-(2-アミノベンジル)-1-(2-トリフルオロメチルフェニル)-5(4H)-テトラゾリノン(0.50g、1.5ミリモル)とイミダゾール(0.26g、3.8ミリモル)をクロロホルム(7ml)に溶解した後、反応溶液を-10℃に冷却した。ついでトリフルオロメタンスルホン酸無水物(0.55g、1.9ミリモル)を20分かけて滴下した。そのままの温度で2時間攪拌した後、氷を加え、さらに6N塩酸を加えて反応液を酸性にし、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で1回洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル=2：1)で精製して1-(2-トリフルオロメチルフェニル)-4-(2-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)-5(4H)-テトラゾリノン(0.2g、収率29%)を得た。融点は95-97℃であった。

実施例4.

(4-1). 2-(2,6-ジクロロフェニル)-4-[2-(N-イソプロピルカルボニル-N-トリフルオロメタンスルホニルアミノベンジル)]-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オンの合成(化合物No. 2

− 2 4 7)

2 − (2, 6 −ジクロロフェニル) − 4 − (2 −トリフルオロメタンスルホニル
 アミノベンジル) − 2, 4 −ジヒドロ − 3 H − 1, 2, 4 −トリアゾール − 3
 −オン (0. 3 0 g、0. 6 ミリモル) とトリエチルアミン (0. 0 7 g、0.
 5 7 ミリモル) をテトラヒドロフラン (2 0 m l) に溶解し、塩化イソブチリル
 (0. 0 8 g、0. 7 ミリモル) を加えて室温で5時間攪拌した。反応液を氷水
 に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で1回洗浄した後、
 無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。濃縮物をシリカゲルカラムクロマ
 トグラフィー [n −ヘキサン − 酢酸エチル (1 : 1)] で精製し、2 − (2, 6
 10 −ジクロロフェニル) − 4 − [2 − (N −イソプロピルカルボニル − N −トリフル
 オロメタンスルホニルアミノベンジル)] − 2, 4 −ジヒドロ − 3 H − 1, 2,
 4 −トリアゾール − 3 −オン (0. 2 5 g、収率72. 7%) を得た。融点は5
 5. 6 − 6 1. 9 °Cであった。

(4 − 2) . N − (2, 6 −ジクロロフェニル) − N' − [2 − (N −トリフルオロメタン
 15 スルホニル − N −フェニルカルボニル) アミノベンジル] − 2 −イミダゾリジノン
 (化合物No. 6 − 3 6 3)

N − (2, 6 −ジクロロフェニル) − N' − (2 −トリフルオロメタンスルホニルアミ
 ノベンジル) − 2 −イミダゾリジノン (0. 3 0 g、0. 6 4 ミリモル) とトリエ
 チルアミン (0. 0 7 g、0. 7 0 ミリモル) をテトラヒドロフラン (1 5
 20 m l) に溶解し、ついでベンゾイルクロリド (0. 0 9 g、0. 6 4 ミリモル)
 を加えて室温で7時間攪拌した。その後、水を加えて、酢酸エチルで抽出した。
 酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去し
 た。ついでシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、N − (2, 6 −ジク
 ロロフェニル) − N' − [2 − (N −トリフルオロメタンスルホニル − N −フェニルカル
 25 ボニル) アミノベンジル] − 2 −イミダゾリジノン (0. 0 9 g、収率24. 6
 %) を得た。融点は9 5 − 9 7 °Cであった。

本発明の一般式 (I) で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はそ
 の塩類を有効成分として含有する除草剤は、例えばイヌビエ (イネ科1年生、水
 田の害草)、タマガヤツリ (カヤツリグサ科1年生草、水田の害草)、マツバイ

(カヤツリグサ科多年生草、湿地、水路、水田に発生、水田の多年生害草)、ウリカワ(オモダカ科、水田、湿地、溝に発生する多年生害草)、イヌホタルイ(カヤツリグサ科多年生草、水田、湿地、溝に発生)、スズメノテッポウ(イネ科越年草、水田裏作、低湿地に発生)、カラスムギ(イネ科越年草、平地、荒地、畑地に発生)、ヨモギ(キク科多年生草、山野、畑地に発生)、メヒシバ(イネ科1年生草、畑、樹園地の強害草)、ギシギシ(タデ科多年生草、畑地、道端に発生)、コゴメガヤツリ(カヤツリグサ科1年生草、畑地の害草)、アオビユ(ヒユ科1年生草、空き地、道端、畑地に発生)、オナモミ(キク科1年生草、畑地の害草)、イチビ(アオイ科1年生草、畑地の害草)、シロバナヨウシュチヨウセンアサガオ(ナス科1年生草、畑地の害草)、オオイヌノフグリ(ゴマノハグサ科越年草、畑地の害草)、ヤエムグラ(アカネ科越年草、畑地、樹園地の害草)等の水田、畑、樹園地、湿地等に発生する1年生、越年生及び多年生雑草を除草するのに有用である。特に水田における雑草防除に有効であり、スルホニルウレア系除草剤抵抗性雑草等の難防除雑草を含む多くの雑草種に対する広い適用性、効果の持続性、イネ-水田雑草間の選択性幅が広いことから水田用除草剤として優れた性能を有する。

本発明の一般式(I)で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する除草剤は出芽前及び出芽後にある雑草に対して優れた除草効果を示すことから、有用植物の植え付け予定地に予め処理するとか、有用植物の植え付け後(有用植物が樹園のごとく既に定植されている場合を含む)雑草の発生始期から生育期に処理することにより本発明除草剤の有する特徴ある生理活性を効果的に発現させることができる。しかし本発明の除草剤はこのような態様においてのみ使用されねばならないというものではなく、例えば本発明除草剤は水田用除草剤として使用することができるばかりでなく、一般雑草の除草剤としても使用することができ、例えば刈り取り跡、休耕田畑、畦畔、農道、水路、牧草造成地、墓地、公園、道路、運動場、建物の周辺の空き地、開墾地、線路端、森林等の一般雑草の駆除のために使用することもできる。この場合、雑草の発生始期までに処理するのが経済的にも最も効果的であるが、必ずしもこれに限定されず、生育期にある雑草をも防除することが可能である。

本発明の一般式（I）で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類を除草剤として使用する場合、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。即ち、本発明の一般式（I）で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類は、これらを適当な不

5 活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に、適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁剤、乳懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、ジャンボ剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、

10 固体の担体になり得る材料としては、例えば植物質粉末類（例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣等）、粉砕合成樹脂等の合成重合体、粘土類（例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等）、タルク類（例えばタルク、ピロフィライト等）、シリカ類（例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン（含水微粉珪素、

15 含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。））、活性炭、天然鉱物質類（例えばイオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、アタパルジャイトおよびゼオライト等）、焼成珪藻土、レンガ粉砕物、フライアッシュ、砂、プラスチック担体等（例えばポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等）、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱

20 物性粉末、硫安、磷安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

液体の担体になり得る材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させ得ることとなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは

25 単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類（例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、エーテル類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラ

ン等)、脂肪族炭化水素類(例えばケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類(例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤を挙げることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び/又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリアルスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。消泡剤としては、例えばシリコン油等の補助剤を使用することもできる。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ特に制限されないが、下限はおよそ0.001重量%程度～上限は90重量%程度である。例えば粉剤或いは粒剤とする場合の下限は0.01重量%程度が好ましく、より好ま

しくは0.1重量%程度、上限は50重量%程度が好ましく、より好ましくは10重量%程度であり、乳剤、水和剤或いは顆粒水和剤等とする場合の下限は0.

0.1重量%程度が好ましく、より好ましくは0.1重量%程度、上限は90重量%程度が好ましく、より好ましくは60重量%程度である。本発明の一般式

- 5 (I) で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する除草剤は、各種雑草を枯殺し若しくは生育を抑制するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で殺草若しくは生育抑制に有効な量を当該雑草に、又は当該雑草の発生若しくは成育が好ましくない場所において茎葉又は土壤に適用して使用すればよい。

- 10 本発明の一般式 (I) で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する除草剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象雑草、作物の生育状況、雑草の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として1ヘクタール当たり0.1g~10kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。本発明の一般式 (I) で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する除草剤を更に防除対象雑草、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の除草剤と混合して使用することも可能である。

以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

20 製剤例1.

本発明化合物	10部
キシレン	70部
N-メチルピロリドン	10部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	

- 25 アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 10部

以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

製剤例2.

本発明化合物	3部
クレー粉末	82部

珪藻土粉末 1 5 部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

製剤例 3.

本発明化合物 5 部

5 ベントナイトとクレーの混合粉末 9 0 部

リグニンスルホン酸カルシウム 5 部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

製剤例 4.

本発明化合物 2 0 部

10 カオリンと合成高分散珪酸 7 5 部

ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと

アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 5 部

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

試験例 1. 出芽前の水田雑草に対する除草効果試験

15 7 5 c m²のプラスチックポットに土壌（埴壤土）を充填し、水田雑草であるイヌビエ、イヌホタルイの種子を播種し、アゼナの種子を混和した土壌

7 5 c m³で覆土した後、水深 5 c mの状態に湛水した。翌日に、製剤例 1 から 4 に準じて調製した本発明化合物（第 1 表から第 1 3 表に記載の化合物）を有効成分とする薬剤の所定有効薬量（g / h a）を水で希釈し水面に滴下処理をした。

20 ついで、温室内で育成し、処理 2 1 日後に除草効果を調査し、無処理と比較して、下記の基準に従って除草効果を評価した。

除草効果（生育抑制程度）及び薬害の判定基準。

4 . . . 9 0 % ~ 1 0 0 %の除草効果、薬害。

3 . . . 7 0 % ~ 8 9 %の除草効果、薬害。

25 2 . . . 4 0 % ~ 6 9 %の除草効果、薬害。

1 . . . 1 % ~ 3 9 %の除草効果、薬害。

0 . . . 0 %の除草効果、薬害。

結果を第 1 5 表に示す。

尚、表中の「/」は試験未実施を示す。

第15表

	薬量 (gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
1-2	1000	/	4	1
1-8	1000	/	4	0
1-23	1000	/	4	4
1-27	1000	/	4	4
1-28	1000	/	4	4
1-29	1000	/	4	4
1-30	1000	0	4	4
1-32	1000	/	4	4
1-36	1000	/	4	4
1-38	1000	/	4	4
1-40	1000	/	4	4
1-41	1000	/	4	4
1-43	1000	/	4	4
1-44	1000	/	4	4
1-47	1000	/	4	4
1-50	1000	/	4	4
1-59	1000	/	4	4
1-81	1000	/	4	4
1-84	1000	/	4	4
1-88	1000	/	4	4
1-89	1000	/	4	4
1-90	1000	/	4	4
1-91	1000	/	4	4
1-92	1000	/	4	4
1-93	1000	/	4	4
1-94	1000	/	4	4
1-95	1000	/	4	4
1-102	1000	/	4	4
1-103	1000	/	4	4
1-107	1000	/	4	4
1-108	1000	/	4	4
1-112	1000	/	4	4
1-123	1000	/	4	/
1-124	1000	/	4	4
1-165	1000	/	4	4
1-177	1000	/	4	4
1-183	1000	/	4	0
1-189	1000	/	4	/
1-190	1000	/	4	/
1-192	1000	4	4	4

第15表 (続き)

	薬量 (gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
1-193	1000	/	4	4
1-198	1000	/	4	4
1-199	1000	/	4	/
1-215	1000	4	4	4
1-237	1000	/	4	4
1-245	1000	/	2	4
1-251	1000	/	4	4
1-254	1000	/	4	4
1-257	1000	/	4	4
1-258	1000	/	4	4
1-265	1000	4	4	4
1-266	1000	/	4	4
1-268	1000	/	4	4
1-273	1000	/	4	4
1-279	1000	/	4	4
1-282	1000	/	4	4
1-285	1000	/	4	4
1-286	1000	/	4	4
1-288	1000	/	/	/
1-291	1000	/	4	4
1-292	1000	/	4	4
1-323	1000	/	0	3
1-324	1000	/	2	4
1-325	1000	/	4	4
1-326	1000	/	4	4
1-327	1000	/	4	/
1-328	1000	/	4	4
2-8	1000	/	/	/
2-9	1000	/	4	4
2-12	1000	/	4	4
2-23	1000	4	4	4
2-24	1000	/	4	4
2-27	1000	4	4	4
2-28	1000	3	4	4
2-29	1000	4	4	4
2-30	1000	/	4	4
2-36	1000	/	4	4
2-37	1000	/	4	4
2-38	1000	/	4	4
2-41	1000	/	4	4

第15表 (続き)

	薬量 (gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
2-43	1000	/	4	4
2-51	1000	/	4	4
2-60	1000	/	/	/
2-61	1000	/	4	4
2-63	1000	/	4	/
2-64	1000	/	4	4
2-65	1000	/	4	4
2-66	1000	4	4	4
2-67	1000	/	4	4
2-68	1000	/	4	4
2-69	1000	/	1	4
2-70	1000	/	4	/
2-71	1000	/	4	4
2-72	1000	/	4	4
2-73	1000	/	4	4
2-76	1000	/	4	4
2-79	1000	/	2	4
2-81	1000	/	4	4
2-82	1000	/	4	/
2-83	1000	/	4	4
2-85	1000	/	4	4
2-86	1000	/	4	4
2-87	1000	/	4	4
2-88	1000	/	4	/
2-92	1000	/	/	/
2-93	1000	/	4	/
2-94	1000	/	4	4
2-98	1000	/	4	0
2-130	1000	1	4	4
2-167	1000	/	4	/
2-169	1000	0	4	4
2-176	1000	4	4	4
2-177	1000	/	4	4
2-184	1000	/	4	4
2-185	1000	/	4	4
2-186	1000	/	4	4
2-205	1000	/	/	/
2-209	1000	4	4	4
2-221	1000	4	4	4
2-227	1000	2	4	/

第15表 (続き)

	薬量 (gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
2-244	1000	/	4	4
2-245	1000	/	1	4
2-246	1000	/	4	4
2-247	1000	/	4	4
3-2	1000	/	4	4
3-3	1000	/	4	4
3-4	1000	/	4	4
3-5	1000	/	4	4
3-6	1000	/	4	4
3-8	1000	/	4	4
3-13	1000	/	4	4
3-18	1000	/	4	4
3-19	1000	/	4	4
3-22	1000	4	4	4
3-23	1000	/	4	4
3-24	1000	/	4	4
3-25	1000	/	4	4
3-29	1000	/	4	4
3-32	1000	/	4	4
3-36	1000	/	4	4
3-37	1000	/	4	4
3-38	1000	/	4	4
3-46	1000	/	4	4
3-47	1000	/	4	4
3-48	1000	/	4	4
3-49	1000	/	/	4
3-53	1000	/	4	4
3-61	1000	/	/	4
3-79	1000	/	3	4
3-80	1000	/	4	4
3-83	1000	/	/	/
3-156	1000	/	4	4
3-157	1000	/	/	/
3-158	1000	/	4	4
3-159	1000	/	4	/
3-160	1000	/	4	/
3-161	1000	/	4	4
3-162	1000	/	4	4
3-163	1000	/	4	4
3-164	1000	/	4	4

第15表 (続き)

	薬量 (gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
3-165	1000	/	1	2
3-166	1000	/	4	4
3-167	1000	/	2	4
3-168	1000	/	/	/
3-169	1000	/	4	4
3-170	1000	/	1	0
3-171	1000	/	/	/
3-172	1000	/	0	0
3-173	1000	/	4	4
3-174	1000	/	3	4
3-175	1000	/	4	4
3-176	1000	/	4	4
3-177	1000	/	4	4
3-178	1000	/	4	4
3-179	1000	/	2	4
3-180	1000	/	2	4
3-181	1000	/	4	4
3-182	1000	/	4	4
3-183	1000	/	4	4
3-184	1000	/	1	4
3-185	1000	/	4	4
4-14	1000	4	4	4
4-39	1000	/	4	4
5-6	1000	/	4	4
5-29	1000	/	4	1
5-50	1000	/	3	2
5-64	1000	/	4	4
5-93	1000	/	/	/
6-8	1000	/	4	4
6-9	1000	/	4	4
6-10	1000	/	4	4
6-19	1000	/	4	4
6-27	1000	/	4	4
6-28	1000	/	4	4
6-29	1000	/	4	4
6-32	1000	/	4	4
6-33	1000	/	4	4
6-60	1000	4	4	4
6-62	1000	/	4	4
6-73	1000	/	4	4

第15表 (続き)

	薬量 (gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
6-82	1000	/	4	4
6-83	1000	/	4	4
6-113	1000	4	4	4
6-339	1000	/	4	4
6-340	1000	/	4	4
6-341	1000	/	4	4
6-342	1000	/	4	4
6-343	1000	/	4	4
6-344	1000	/	4	4
6-345	1000	/	4	4
6-346	1000	/	4	4
6-347	1000	/	/	/
6-348	1000	/	4	4
6-349	1000	/	4	4
6-350	1000	/	4	4
6-351	1000	/	4	4
6-352	1000	/	4	4
6-353	1000	/	4	4
6-354	1000	/	4	4
6-355	1000	/	4	4
6-356	1000	/	4	4
6-357	1000	/	4	4
6-358	1000	/	4	4
6-359	1000	/	4	4
6-360	1000	/	4	4
6-361	1000	/	/	/
6-362	1000	/	/	/
6-363	1000	/	/	/
6-364	1000	/	/	/
6-365	1000	/	/	/
6-366	1000	/	/	/
6-367	1000	/	/	/
6-368	1000	/	/	/
6-369	1000	/	/	/
6-370	1000	/	/	/
6-371	1000	/	/	/
6-372	1000	/	/	/
6-373	1000	/	/	/
6-374	1000	/	/	/
6-375	1000	/	/	/

第15表 (続き)

	薬量 (gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
6-376	1000	/	/	/
6-377	1000	/	/	/
6-378	1000	/	/	/
6-379	1000	/	/	/
6-380	1000	/	/	/
6-381	1000	/	/	/
6-382	1000	/	4	/
6-383	1000	/	4	0
7-60	1000	/	4	4
7-217	1000	/	4	2
8-56	1000	/	4	4
9-56	1000	/	3	4
10-1	1000	/	/	/
10-2	1000	1	4	4
10-8	1000	4	4	4
10-12	1000	4	4	4
10-13	1000	2	4	4
10-14	1000	2	4	4
10-15	1000	4	4	4
10-16	1000	4	4	4
10-17	1000	4	4	4
10-18	1000	4	4	4
10-19	1000	4	4	4
10-20	1000	4	4	4
10-21	1000	/	4	4
10-23	1000	/	4	/
10-24	1000	/	4	4
10-26	1000	/	4	/
10-28	1000	/	4	/
10-29	1000	/	4	4
10-34	1000	/	4	4
10-35	1000	/	4	4
10-37	1000	0	4	4
10-39	1000	/	4	4
10-40	1000	/	4	4
10-58	1000	/	/	/
10-59	1000	/	/	/
10-116	1000	/	4	4
11-7	1000	4	4	4
11-11	1000	/	4	4

第15表 (続き)

	薬量 (gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
11-23	1000	/	4	4
12-1	1000	/	4	4
12-4	1000	4	4	4
12-7	1000	4	4	4

試験例2. 出芽後の水田雑草に対する除草効果試験

- 75 cm²のプラスチックポットに土壌(埴壤土)を充填し、水田雑草である
- 5 イヌビエ、イヌホタルイの種子を播種し、アゼナの種子を混和した土壌75 cm³で覆土した後、水深5 cmの状態に湛水し、温室内で育成した。供試植物が一葉期の時期に、本発明化合物(第1表から第13表に記載の化合物)を有効成分とする薬剤を所定有効薬量(g/ha)の薬液として処理をした。ついで、温室内で育成し、処理21日後に除草効果を調査し、無処理と比較して、試験例
- 10 1の基準に従って除草効果を評価した。結果を第16表に示す。

第16表

	薬量(gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
1-2	1000	4	4	2
1-8	1000	3	4	4
1-23	1000	4	4	4
1-27	1000	4	4	4
1-28	1000	1	4	4
1-29	1000	4	4	4
1-30	1000	4	4	4
1-32	1000	4	4	4
1-36	1000	4	4	4
1-38	1000	4	4	4
1-40	1000	4	4	4
1-41	1000	4	4	4
1-43	1000	3	4	4
1-44	1000	4	4	4
1-47	1000	4	4	4
1-50	1000	4	4	4
1-59	1000	4	4	4
1-81	1000	0	4	4
1-84	1000	4	4	4
1-88	1000	4	4	4
1-89	1000	4	4	4
1-90	1000	1	4	4
1-91	1000	/	/	4
1-92	1000	4	4	4
1-93	1000	4	4	4
1-94	1000	4	4	4
1-95	1000	4	4	4
1-102	1000	4	4	4
1-103	1000	2	4	4
1-107	1000	4	4	4
1-108	1000	4	4	4
1-112	1000	1	4	4
1-123	1000	/	4	/
1-124	1000	4	4	4
1-165	1000	2	4	4
1-177	1000	3	4	4
1-183	1000	4	4	4
1-189	1000	4	/	4
1-190	1000	4	4	4
1-192	1000	4	4	4
1-193	1000	/	4	4

第16表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
1-198	1000	4	4	4
1-199	1000	4	4	4
1-215	1000	3	4	4
1-237	1000	4	4	4
1-245	1000	0	4	3
1-251	1000	4	4	4
1-254	1000	4	4	4
1-257	1000	4	4	/
1-258	1000	/	4	4
1-265	1000	4	4	4
1-266	1000	4	4	4
1-268	1000	3	4	4
1-273	1000	2	4	4
1-279	1000	0	4	3
1-282	1000	0	4	4
1-285	1000	0	4	2
1-286	1000	2	/	4
1-288	1000	/	/	/
1-291	1000	2	4	4
1-292	1000	1	4	4
1-323	1000	0	0	3
1-324	1000	0	0	4
1-325	1000	1	4	4
1-326	1000	2	4	4
1-327	1000	2	4	/
1-328	1000	4	4	4
2-8	1000	1	4	4
2-9	1000	/	4	4
2-12	1000	0	4	4
2-23	1000	4	4	4
2-24	1000	4	4	4
2-27	1000	4	4	4
2-28	1000	1	4	4
2-29	1000	2	4	4
2-30	1000	4	4	4
2-36	1000	4	4	4
2-37	1000	2	4	4
2-38	1000	4	4	4
2-41	1000	2	4	4
2-43	1000	4	4	4
2-51	1000	3	4	4

第16表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
2-60	1000	1	/	/
2-61	1000	0	4	4
2-63	1000	4	4	/
2-64	1000	/	4	/
2-65	1000	4	4	4
2-66	1000	4	4	4
2-67	1000	2	4	4
2-68	1000	4	4	4
2-69	1000	1	2	4
2-70	1000	4	4	4
2-71	1000	4	4	4
2-72	1000	0	4	4
2-73	1000	4	4	/
2-76	1000	4	4	4
2-79	1000	0	4	4
2-81	1000	3	4	4
2-82	1000	1	4	/
2-83	1000	0	4	4
2-85	1000	4	4	4
2-86	1000	3	4	4
2-87	1000	4	4	4
2-88	1000	/	4	/
2-92	1000	/	/	/
2-93	1000	4	4	/
2-94	1000	1	4	4
2-98	1000	1	4	2
2-130	1000	0	4	4
2-167	1000	4	4	/
2-169	1000	/	4	4
2-176	1000	4	4	4
2-177	1000	4	4	4
2-184	1000	4	4	4
2-185	1000	/	4	4
2-186	1000	4	4	4
2-205	1000	/	/	/
2-209	1000	1	4	4
2-221	1000	4	4	4
2-227	1000	1	4	/
2-244	1000	2	/	4
2-245	1000	1	0	4
2-246	1000	2	4	4

第16表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
2-247	1000	/	4	4
3-2	1000	4	4	3
3-3	1000	2	4	4
3-4	1000	2	4	4
3-5	1000	0	4	3
3-6	1000	0	4	4
3-8	1000	3	4	4
3-13	1000	2	4	4
3-18	1000	4	4	4
3-19	1000	4	4	4
3-22	1000	4	4	4
3-23	1000	0	/	4
3-24	1000	1	/	4
3-25	1000	3	4	4
3-29	1000	4	4	4
3-32	1000	2	4	4
3-36	1000	/	4	4
3-37	1000	1	4	4
3-38	1000	2	4	4
3-46	1000	4	4	4
3-47	1000	1	4	4
3-48	1000	1	4	4
3-49	1000	0	/	/
3-53	1000	4	/	4
3-61	1000	0	4	4
3-79	1000	0	3	4
3-80	1000	2	4	4
3-83	1000	/	/	/
3-156	1000	4	4	4
3-157	1000	0	/	/
3-158	1000	4	4	4
3-159	1000	2	4	/
3-160	1000	1	4	/
3-161	1000	0	4	4
3-162	1000	4	4	4
3-163	1000	0	4	4
3-164	1000	0	4	4
3-165	1000	0	1	2
3-166	1000	4	4	4
3-167	1000	0	3	3
3-168	1000	/	/	/

第16表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
3-169	1000	0	4	4
3-170	1000	0	0	0
3-171	1000	/	/	/
3-172	1000	/	0	0
3-173	1000	0	4	3
3-174	1000	1	1	4
3-175	1000	4	4	4
3-176	1000	0	4	4
3-177	1000	0	2	3
3-178	1000	0	4	4
3-179	1000	0	4	3
3-180	1000	0	2	3
3-181	1000	2	4	4
3-182	1000	4	4	4
3-183	1000	4	4	4
3-184	1000	0	2	1
3-185	1000	1	4	4
4-14	1000	4	4	4
4-39	1000	4	4	4
5-6	1000	/	4	4
5-29	1000	0	4	2
5-50	1000	0	2	1
5-64	1000	0	4	3
5-93	1000	/	/	/
6-8	1000	4	4	4
6-9	1000	4	4	4
6-10	1000	4	4	4
6-19	1000	4	4	4
6-27	1000	4	4	4
6-28	1000	4	4	4
6-29	1000	4	4	4
6-32	1000	4	4	4
6-33	1000	4	4	4
6-60	1000	4	4	4
6-62	1000	4	4	4
6-73	1000	4	4	4
6-82	1000	4	4	4
6-83	1000	4	4	4
6-113	1000	4	4	4
6-339	1000	1	3	4
6-340	1000	4	4	4

第16表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
6-341	1000	4	4	4
6-342	1000	4	4	4
6-343	1000	4	4	4
6-344	1000	4	4	4
6-345	1000	4	4	4
6-346	1000	/	4	4
6-347	1000	/	/	/
6-348	1000	4	4	4
6-349	1000	/	4	4
6-350	1000	4	4	4
6-351	1000	4	4	4
6-352	1000	4	4	4
6-353	1000	/	4	4
6-354	1000	4	4	4
6-355	1000	4	4	4
6-356	1000	/	4	4
6-357	1000	4	4	4
6-358	1000	/	4	4
6-359	1000	/	4	4
6-360	1000	1	4	4
6-361	1000	/	/	/
6-362	1000	/	/	/
6-363	1000	/	/	/
6-364	1000	/	/	/
6-365	1000	/	/	/
6-366	1000	/	/	/
6-367	1000	/	/	/
6-368	1000	/	/	/
6-369	1000	/	/	/
6-370	1000	/	/	/
6-371	1000	/	/	/
6-372	1000	/	/	/
6-373	1000	/	/	/
6-374	1000	/	/	/
6-375	1000	/	/	/
6-376	1000	/	/	/
6-377	1000	/	/	/
6-378	1000	/	/	/
6-379	1000	/	/	/
6-380	1000	/	/	/
6-381	1000	/	/	/

第16表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イヌビエ	イヌホタルイ	アゼナ
6-382	1000	4	4	/
6-383	1000	0	4	1
7-60	1000	4	4	4
7-217	1000	1	4	3
8-56	1000	1	4	4
9-56	1000	3	4	3
10-1	1000	/	/	/
10-2	1000	0	4	4
10-8	1000	4	4	4
10-12	1000	1	4	4
10-13	1000	1	4	4
10-14	1000	0	4	4
10-15	1000	1	4	4
10-16	1000	0	4	4
10-17	1000	4	4	4
10-18	1000	2	4	4
10-19	1000	1	4	4
10-20	1000	0	4	4
10-21	1000	1	4	4
10-23	1000	1	4	4
10-24	1000	0	4	4
10-26	1000	0	4	4
10-28	1000	3	4	4
10-29	1000	2	4	4
10-34	1000	1	4	4
10-35	1000	4	4	4
10-37	1000	0	/	4
10-39	1000	1	4	4
10-40	1000	2	4	4
10-58	1000	/	/	/
10-59	1000	/	/	/
10-116	1000	1	/	4
11-7	1000	2	4	4
11-11	1000	0	4	4
11-23	1000	4	4	4
12-1	1000	0	/	4
12-4	1000	1	4	4
12-7	1000	2	4	4

試験例 3. 移植水稻に対する薬害試験

75 cm²のプラスチックポットに土壌（埴壤土）を充填し、水深5 cmの状態に湛水し、2葉期のイネ（品種：日本晴）を移植深度1 cmで2本移植した。温室内で育成し、移植5日後に、本発明化合物（第1表から第13表に記載の化合物）を有効成分とする薬剤を所定有効薬量（g/h a）の薬液として処理をした。ついで、温室内で育成し、処理21日後に薬害を調査し、無処理と比較して、試験例1の基準に従って薬害を評価した。結果を第17表に示す。

第17表

	薬量(gai/ha)	イネ
1-2	1000	1
1-8	1000	0
1-23	1000	3
1-27	1000	4
1-28	1000	2
1-29	1000	0
1-30	1000	2
1-32	1000	1
1-36	1000	3
1-38	1000	2
1-40	1000	1
1-41	1000	3
1-43	1000	0
1-44	1000	1
1-47	1000	1
1-50	1000	1
1-59	1000	3
1-81	1000	0
1-84	1000	1
1-88	1000	1
1-89	1000	1
1-90	1000	0
1-91	1000	1
1-92	1000	3
1-93	1000	0
1-94	1000	1
1-95	1000	1
1-102	1000	3
1-103	1000	0
1-107	1000	3
1-108	1000	3
1-112	1000	0
1-123	1000	0
1-124	1000	0
1-165	1000	1
1-177	1000	1
1-183	1000	2
1-189	1000	0
1-190	1000	0
1-192	1000	2
1-193	1000	3

第17表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イネ
1-198	1000	4
1-199	1000	2
1-215	1000	0
1-237	1000	0
1-245	1000	0
1-251	1000	0
1-254	1000	1
1-257	1000	2
1-258	1000	0
1-265	1000	0
1-266	1000	1
1-268	1000	1
1-273	1000	1
1-279	1000	0
1-282	1000	1
1-285	1000	0
1-286	1000	0
1-288	1000	/
1-291	1000	1
1-292	1000	1
1-323	1000	0
1-324	1000	0
1-325	1000	0
1-326	1000	1
1-327	1000	1
1-328	1000	2
2-8	1000	0
2-9	1000	0
2-12	1000	1
2-23	1000	1
2-24	1000	1
2-27	1000	1
2-28	1000	0
2-29	1000	1
2-30	1000	0
2-36	1000	1
2-37	1000	0
2-38	1000	1
2-41	1000	1
2-43	1000	1
2-51	1000	1

第17表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イネ
2-60	1000	0
2-61	1000	0
2-63	1000	1
2-64	1000	4
2-65	1000	1
2-66	1000	1
2-67	1000	1
2-68	1000	1
2-69	1000	0
2-70	1000	3
2-71	1000	1
2-72	1000	0
2-73	1000	0
2-76	1000	1
2-79	1000	0
2-81	1000	1
2-82	1000	1
2-83	1000	0
2-85	1000	4
2-86	1000	1
2-87	1000	1
2-88	1000	2
2-92	1000	/
2-93	1000	3
2-94	1000	1
2-98	1000	0
2-130	1000	0
2-167	1000	1
2-169	1000	0
2-176	1000	2
2-177	1000	2
2-184	1000	3
2-185	1000	4
2-186	1000	3
2-205	1000	/
2-209	1000	0
2-221	1000	1
2-227	1000	2
2-244	1000	0
2-245	1000	1
2-246	1000	0

第17表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イネ
2-247	1000	1
3-2	1000	2
3-3	1000	0
3-4	1000	0
3-5	1000	0
3-6	1000	0
3-8	1000	0
3-13	1000	0
3-18	1000	1
3-19	1000	1
3-22	1000	0
3-23	1000	0
3-24	1000	0
3-25	1000	0
3-29	1000	2
3-32	1000	0
3-36	1000	0
3-37	1000	0
3-38	1000	1
3-46	1000	3
3-47	1000	1
3-48	1000	0
3-49	1000	0
3-53	1000	0
3-61	1000	0
3-79	1000	0
3-80	1000	0
3-83	1000	/
3-156	1000	0
3-157	1000	0
3-158	1000	0
3-159	1000	0
3-160	1000	0
3-161	1000	0
3-162	1000	3
3-163	1000	0
3-164	1000	0
3-165	1000	0
3-166	1000	0
3-167	1000	0
3-168	1000	/

第17表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イネ
3-169	1000	0
3-170	1000	0
3-171	1000	/
3-172	1000	0
3-173	1000	0
3-174	1000	0
3-175	1000	1
3-176	1000	0
3-177	1000	0
3-178	1000	0
3-179	1000	0
3-180	1000	0
3-181	1000	0
3-182	1000	1
3-183	1000	1
3-184	1000	0
3-185	1000	0
4-14	1000	1
4-39	1000	2
5-6	1000	0
5-29	1000	0
5-50	1000	0
5-64	1000	0
5-93	1000	/
6-8	1000	2
6-9	1000	0
6-10	1000	1
6-19	1000	4
6-27	1000	3
6-28	1000	3
6-29	1000	4
6-32	1000	2
6-33	1000	3
6-60	1000	1
6-62	1000	1
6-73	1000	1
6-82	1000	1
6-83	1000	1
6-113	1000	0
6-339	1000	0
6-340	1000	1

第17表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イネ
6-341	1000	3
6-342	1000	2
6-343	1000	4
6-344	1000	1
6-345	1000	1
6-346	1000	0
6-347	1000	0
6-348	1000	1
6-349	1000	2
6-350	1000	1
6-351	1000	1
6-352	1000	0
6-353	1000	1
6-354	1000	1
6-355	1000	2
6-356	1000	1
6-357	1000	1
6-358	1000	0
6-359	1000	0
6-360	1000	0
6-361	1000	/
6-362	1000	/
6-363	1000	/
6-364	1000	/
6-365	1000	/
6-366	1000	/
6-367	1000	/
6-368	1000	/
6-369	1000	/
6-370	1000	/
6-371	1000	/
6-372	1000	/
6-373	1000	/
6-374	1000	/
6-375	1000	/
6-376	1000	/
6-377	1000	/
6-378	1000	/
6-379	1000	/
6-380	1000	/
6-381	1000	/

第17表 (続き)

	薬量(gai/ha)	イネ
6-382	1000	1
6-383	1000	0
7-60	1000	1
7-217	1000	0
8-56	1000	1
9-56	1000	0
10-1	1000	/
10-2	1000	0
10-8	1000	0
10-12	1000	0
10-13	1000	0
10-14	1000	0
10-15	1000	0
10-16	1000	0
10-17	1000	0
10-18	1000	0
10-19	1000	0
10-20	1000	0
10-21	1000	0
10-23	1000	1
10-24	1000	0
10-26	1000	1
10-28	1000	1
10-29	1000	1
10-34	1000	0
10-35	1000	1
10-37	1000	0
10-39	1000	0
10-40	1000	0
10-58	1000	/
10-59	1000	/
10-116	1000	0
11-7	1000	0
11-11	1000	0
11-23	1000	1
12-1	1000	0
12-4	1000	0
12-7	1000	0

試験例 4. 畑作雑草に対する茎葉処理除草効果試験

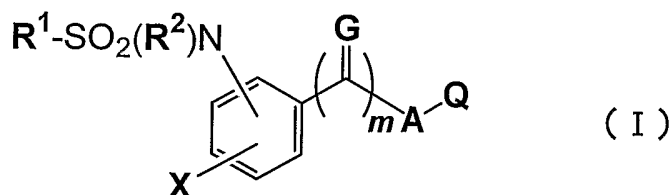
36 cm²のポットに土壌（埴壤土）を充填し、畑作雑草であるイヌビエ、オナモミの種子を播種し、土壌約20 cm³で覆土した後、温室内で育成した。供試植物が一葉期の時期に、製剤例1から4に準じて調製した本発明化合物（第15表から第13表に記載の化合物）を有効成分とする薬剤の所定有効薬量（140 g/ha相当）を1000 L/ha相当の水で希釈し、散布処理した。ついで、温室内で育成し、処理21日後に除草効果を調査し、無処理と比較して除草効果の有無を評価した。

本発明化合物の中で、少なくとも1-2、1-8、1-23、1-27、1-
10 28、1-30、1-36、1-40、1-41、1-44、1-47、1-5
9、1-84、1-88、1-89、1-91、1-92、1-93、1-94、
1-95、1-102、1-103、1-108、1-165、1-177、1
-183、1-189、1-190、1-193、1-199、1-237、1
-251、1-254、1-258、1-266、1-279、1-286、1
15 -291、1-324、1-326、1-327、1-328、2-12、2-
23、2-24、2-27、2-28、2-29、2-30、2-36、2-4
1、2-51、2-61、2-63、2-64、2-65、2-66、2-67、
2-68、2-69、2-70、2-71、2-72、2-73、2-76、2
-79、2-81、2-82、2-83、2-85、2-86、2-87、2-
20 88、2-93、2-94、2-130、2-167、2-169、2-176、
2-177、2-184、2-185、2-186、2-209、2-221、
2-244、2-245、2-247、3-2、3-5、3-8、3-13、3
-18、3-19、3-23、3-24、3-25、3-29、3-36、3-
37、3-38、3-46、3-47、3-48、3-53、3-61、3-8
25 0、3-156、3-158、3-161、3-162、3-163、3-16
4、3-166、3-168、3-169、3-170、3-172、3-17
3、3-181、3-182、3-183、3-185、4-39、5-93、
6-8、6-9、6-10、6-19、6-27、6-28、6-29、6-3
2、6-33、6-60、6-62、6-73、6-82、6-83、6-34

1、6-342、6-346、6-348、6-349、6-350、6-351、6-352、6-353、6-354、6-355、6-356、6-357、6-360、6-362、6-363、6-364、6-365、6-366、6-367、7-60、10-2、10-8、10-12、10-13、15 0-14、10-15、10-16、10-17、10-18、10-19、10-20、10-21、10-23、10-24、10-26、10-28、10-29、10-34、10-35、10-37、10-39、10-40、10-116、11-7、12-1、12-4、12-7は、イヌビエあるいはオナモミに除草効果を示した。

請求の範囲

1. 一般式 (I) :



5 {式中、 R^1 はハロ (C_1-C_6) アルキル基を示す。

R^2 は水素原子、(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) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシカルボニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基を示す。

15 Q は構成原子の少なくとも1個が窒素原子であり、かつその窒素原子がAとの結合部位である置換されていても良いヘテロ環を示す。

Aは(C_1-C_6) アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、(C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はシアノ基から選択される1以上の置換基を有する置換 (C_1-C_6) アルキレン基、(C_2-C_6) アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、(C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はシアノ基から選択される1以上の置換基を有する置換 (C_2-C_6) アルケニレン基又は (C_2-C_6) アルキニレン基を示す。

G は酸素原子、硫黄原子、 $N-R^3$ (式中、 R^3 は水素原子、(C_1-C_6) アルキル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基、同一又は異なっても良く、 Y (Y は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、

- Y (Yは後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)、 $N-OR^4$ (式中、 R^4 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキル基を示す。) 又は $N-NR^5R^6$ (式中、 R^5 及び R^6 は同一又は異なっても良く、水素原子、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。又、 R^5 と R^6 は一緒になって (C_3-C_6) アルキレン基を示すこともできる。) を示す。
mは0又は1の整数を示す。
- 10 Xは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、
- 20 フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から
- 25

選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基、フェニル (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y (Yは後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1~4 個の置換基を示す。

Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (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、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1~5 個の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (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、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニ

- ル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、シクロ(C₃-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、シクロハロ(C₃-C₆)アルキル基、
- 5 (C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、
- 10 水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、シクロ(C₃-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、シクロハロ(C₃-C₆)アルキル
- 15 基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ(C₁-C₆)アルキルアミ
- 20 ノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、シクロ(C₃-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、シクロハロ
- 25 (C₃-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ(C₁-

- C₆) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1～5 個の置換基を有する置換フェニルホルニル基、(C₁-C₆) アルキルカルボニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は
- 5 異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆) アルキル基、(C₂-C₆) アルケニル基、(C₂-C₆) アルキニル基、シクロ (C₃-C₆) アルキル基、ハロ (C₁-C₆) アルキル基、シクロハロ (C₃-C₆) アルキル基、(C₁-C₆) アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、(C₁-C₆) アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆) アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-
- 10 C₆) アルキルスルホニル基、(C₁-C₆) アルキルカルボニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルカルボニル基、(C₁-C₆) アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1～5 個の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、(C₁-C₆) アルコキシカル
- 15 ボニル基、カルボキシル基、モノ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆) アルキル基、(C₂-C₆) アルケニル基、(C₂-C₆) アルキニル基、シクロ (C₃-C₆) アルキル基、ハロ (C₁-C₆) アルキル基、シクロハロ (C₃-C₆) アルキル基、(C₁-C₆) アルコキシ基、ハロ
- 20 (C₁-C₆) アルコキシ基、(C₁-C₆) アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、(C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆) アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基、(C₁-C₆) アルキルカルボニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルカルボニル基、(C₁-C₆) アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異
- 25 なっても良いジ (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1～5 個の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基、フェニル (C₁-C₆) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆) アルキル基、(C₂-C₆) アルケニル基、(C₂-C₆) アルキニル基、シクロ (C₃-C₆) アルキル基、ハロ (C₁-C₆) アルキル基、シク

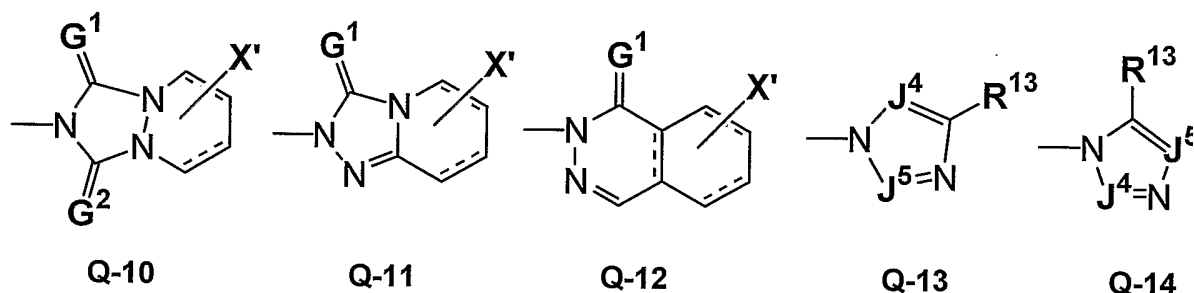
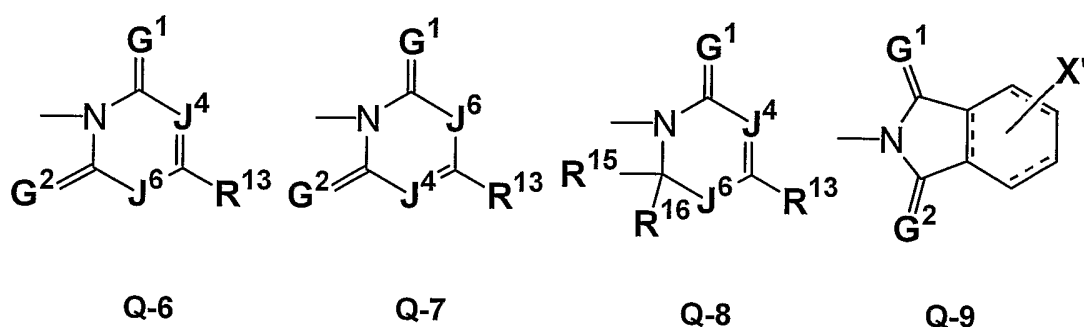
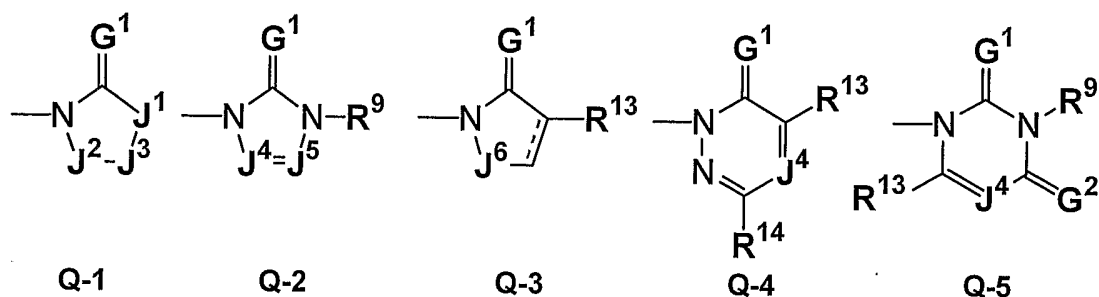
- ロハロ (C_3-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1 ~ 5 個の置換基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される 1 ~ 5 個の置換基を示す。又、Y はベンゼン環上の隣接する炭素原子と一緒にあって、同一又は異なっても良く、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子 (該窒素原子は水素原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基又はシクロ (C_3-C_6) アルキル基によって置換されていても良い。) から選択される 1 乃至 2 個のヘテロ原子により中断されても良い (C_1-C_4) アルキレン基により 5 乃至 6 員環を形成しても良い。}

で表されるハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類。

2. Q が、構成原子の少なくとも 1 個が窒素原子であり、かつ窒素原子が A との結合部位となり、炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子又はリン原子を構成元素としてなる 4 乃至 13 員ヘテロ環又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_7) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_7) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、Y (Y は請求項 1 に同じ。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基、同一又は異なっても良く、Y (Y は前記に同じ。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有するフェニル (C_1-C_6) アルキル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、Y (Y は前記に同じ。) から選択される 1 以上の置換基を有

- する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、Y（Yは前記に同じ。）から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、Y（Yは前記に同じ。）から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、Y（Yは前記に同じ。）から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y（Yは前記に同じ。）から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y（Yは前記に同じ。）から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基、フェニル(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y（Yは前記に同じ。）から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、複素環基（複素環基は、ピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、ピラジニル基、トリアジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基、モルホリニル基から選択される複素環基を示す。）、同一又は異なっても良く、Y（Yは前記に同じ。）から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基（複素環基は前記に同じ。）、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される1以上の置換基で置換された構成原子の少なくとも1個が窒素原子であり、かつ窒素原子がAとの結合部位となり炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子又は燐原子を構成元素としてなる4乃至13員ヘテロ環である請求項1記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類。

3. Qが



5

- {式中、 G^1 、 G^2 は同一又は異なっても良く、酸素原子、硫黄原子、 $N-R^{3'}$ (式中、 $R^{3'}$ は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)、 $N-OR^{4'}$ (式中、 $R^{4'}$ は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1
- 15 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキル基を示す。)、 $N-NR^{5'}$ $R^{6'}$ (式中、 $R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ は同一又は異なっても良く、水素原子、フ

フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。又、 $R^{5'}$ と $R^{6'}$ は一緒になって (C_3-C_6) アルキレン基を示すこともできる。) 又は CR^7R^8 (式中、 R^7 及び R^8 は同一又は異なっても良く、水素原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、シアノ基又はニトロ基を示す。) を示す。

- J^1 は酸素原子、硫黄原子又は $N-R^9$ (式中、 R^9 は水素原子、(C_1-C_6) アルキル基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基 (複素環基は請求項 2 に同じ。)、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基 (複素環基は前記に同じ。)、複素環 (C_1-C_6) アルキル基 (複素環基は前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換複素環 (C_1-C_6) アルキル基 (複素環基は前記に同じ。)、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基を示す。) を示す。
- 20 J^2 及び J^3 は同一又は異なっても良く、酸素原子、硫黄原子、 $N-R^9$ (式中、 R^9 は前記に同じ。)、 $R^{10}-C-R^{11}$ (式中、 R^{10} 及び R^{11} は同一又は異なっても良く、水素原子、(C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル (C_1-C_6) アルキル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。) 、 $C=O$ 又は $C=S$ を

示す。

J⁴及びJ⁵は同一又は異なっても良く、C-R¹²（式中、R¹²は水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、
 5 (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル(C₁-C₆)アルキル基、同一又は異なっても良く、Y'（Y'は後記に示す。）から選択される1以上の置換基を環上に有するフェニル(C₁-C₆)アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、Y'（Y'は後記に示す。）から選択される1以上の置
 10 換基を有する置換フェニル基又はシアノ基を示す。）又は窒素原子を示す。

J⁶は酸素原子、硫黄原子、N-R⁹（式中、R⁹は前記に同じ。）又はR¹⁰-C-R¹¹（式中、R¹⁰及びR¹¹は前記に同じ。）を示す。

R⁹は前記に同じ。

R¹³及びR¹⁴は同一又は異なっても良く水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル(C₁-C₆)アルキル基、同一又は異なっても良く、Y'（Y'は後記に示す。）から選択される1以上の置換基
 15 を環上に有する置換フェニル(C₁-C₆)アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、Y'（Y'は後記に示す。）から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基（複素環基は前記に同じ。）、同一又は異なっても良く、Y'（Y'は後記に示す。）から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基（複素環基は前記に同じ。）、複素環(C₁-C₆)アルキル基（複素環基は前記に同じ。）、同一又は異なっても良く、Y'（Y'は後記に示す。）から選択される1
 20 以上の置換基を環上に有する置換複素環(C₁-C₆)アルキル基（複素環基は前記に同じ。）、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、Y'（Y'は後記に示す。）から選択される1
 25

以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基又はシアノ基を示す。

R^{15} 及び R^{16} は同一又は異なっても良く、水素原子又は (C_1-C_6) アルキル基を示す。

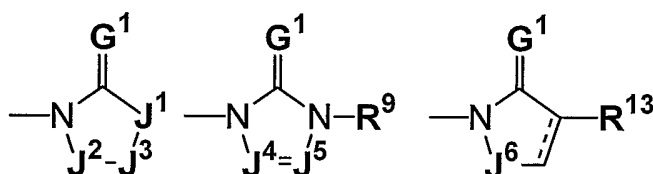
- 5 X' は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_2-C_6) アルキニル基、シクロ (C_3-C_7) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-7) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノカルボニル基、フェニル (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良く、 Y' (Y' は後記に示す。) から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される1~4個の置換

基を示す。

Y' は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、シクロ(C₃-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、シクロハロ(C₃-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、フェニル基、フェノキシ基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される1~5個の置換基を示す。}

を示す請求項2記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩類。

4. R¹がフルオロアルキル基を示し、R²が水素原子を示し、Qが



15 Q-1 Q-2 Q-3

(式中、G¹は酸素原子を示す。

R⁹はフェニル(C₁-C₆)アルキル基、同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、シクロ(C₃-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、シクロハロ(C₃-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカ

ルボニル基、ジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シ
 アノ基又はニトロ基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル
 (C_1-C_6) アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲ
 ン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シク
 5 ロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、
 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ
 (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル
 スルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニ
 ル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、(C_1-
 10 C_6) アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカ
 ルボニル基、ジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シ
 アノ基又はニトロ基から選択される 1 ~ 5 個の置換基を有する置換フェニル基、
 ピリジル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、ハ
 ロ (C_1-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基又はハロ (C_1-C_6) アルコキシ基から選
 15 択される 1 以上の置換基を有する置換ピリジル基、ピリミジル基又は同一若しく
 は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、
 (C_1-C_6) アルコキシ基又はハロ (C_1-C_6) アルコキシ基から選択される 1 以上の置換
 基を有する置換ピリミジル基を示す。

R^{13} はフェニル (C_1-C_6) アルキル基、同一又は異なっても良く、水素原子、ハロ
 20 ゲン原子、(C_1-C_6) アルキル基、(C_2-C_6) アルケニル基、(C_2-C_6) アルキニル基、シ
 クロ (C_3-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、シクロハロ (C_3-C_6) アルキル基、
 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ
 (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル
 スルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニ
 25 ル基、(C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (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、カルボキシル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノカ
 ルボニル基、ジ (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シ
 アノ基又はニトロ基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル
 (C_1-C_6) アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲ

ン原子、(C₁-C₆)アルキル基、(C₂-C₆)アルケニル基、(C₂-C₆)アルキニル基、シクロ(C₃-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、シクロハロ(C₃-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル

5 スルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルカルボニル基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基、カルボキシル基、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル基、水酸基、アミノ基、シアノ基又はニトロ基から選択される1~5個の置換基を有する置換フェニル基、

10 ピリジル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基又はハロ(C₁-C₆)アルコキシ基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基、ピリミジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ(C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基又はハロ(C₁-C₆)アルコキシ基から選択される1以上の置換

15 基を有する置換ピリミジル基を示す。)を示し、

Aが(C₁-C₆)アルキレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、水酸基、(C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル基又はシアノ基から選択される1以上の置換基を有する(C₁-C₆)アルキレン基を示し、

Gが酸素原子又はN-OR⁴(式中、R⁴は(C₁-C₆)アルキル基を示す。)を示し、

20 し、mが0又は1の整数を示し、

Xが同一又は異なっても良く、水素原子又は(C₁-C₆)アルキル基から選択される1~2個の置換基を示す請求項1記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体又はその塩。

5. 請求項1乃至4いずれか1項記載のハロアルキルスルホンアニリド誘導体

25 又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする除草剤。

6. 請求項5記載の除草剤の有効量を土壌又は植物に処理することを特徴とする除草剤の使用法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP03/09405

<p>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl⁷ C07D209/48, 237/32, 239/52, 249/04, 249/12, 251/08, 253/06 257/04, 277/34, 401/04, 403/04, A01N43/38, 43/50, 43/54, 43/58, 43/64, 43/647, 43/653, 43/707, 43/713, 43/78, 47/02 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC</p>											
<p>B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl⁷ C07D209/48, 237/32, 239/52, 249/04, 249/12, 251/08, 253/06 257/04, 277/34, 401/04, 403/04, A01N43/38, 43/50, 43/54, 43/58, 43/64, 43/647, 43/653, 43/707, 43/713, 43/78, 47/02 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAPLUS, REGISTRY (STN)</p>											
<p>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>Category*</th> <th>Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</th> <th>Relevant to claim No.</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>Y</td> <td>GB 1593809 A (CIBA-GEIGY A.-G.), 22 July, 1981 (22.07.81), & DE 2815820 A & CH 629076 A & CH 632131 A & NL 7803885 A & FR 2387219 A & AU 7835084 A & CA 1102801 A & IL 54501 A & BE 865979 A & SE 7804244 A & DK 7801646 A & BR 7802330 A & ZA 7802158 A & ES 468807 A & JP 53-130652 A</td> <td>1-6</td> </tr> <tr> <td>Y</td> <td>JP 57-130967 A (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.), 13 August, 1982 (13.08.82), & BR 8102220 A & JP 56-154452 A & AU 8169075 A & ES 501235 A & EP 38636 A2 & US 4321081 A & ZA 8102259 A & CA 1157471 A</td> <td>1-6</td> </tr> </tbody> </table>			Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	Y	GB 1593809 A (CIBA-GEIGY A.-G.), 22 July, 1981 (22.07.81), & DE 2815820 A & CH 629076 A & CH 632131 A & NL 7803885 A & FR 2387219 A & AU 7835084 A & CA 1102801 A & IL 54501 A & BE 865979 A & SE 7804244 A & DK 7801646 A & BR 7802330 A & ZA 7802158 A & ES 468807 A & JP 53-130652 A	1-6	Y	JP 57-130967 A (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.), 13 August, 1982 (13.08.82), & BR 8102220 A & JP 56-154452 A & AU 8169075 A & ES 501235 A & EP 38636 A2 & US 4321081 A & ZA 8102259 A & CA 1157471 A	1-6
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.									
Y	GB 1593809 A (CIBA-GEIGY A.-G.), 22 July, 1981 (22.07.81), & DE 2815820 A & CH 629076 A & CH 632131 A & NL 7803885 A & FR 2387219 A & AU 7835084 A & CA 1102801 A & IL 54501 A & BE 865979 A & SE 7804244 A & DK 7801646 A & BR 7802330 A & ZA 7802158 A & ES 468807 A & JP 53-130652 A	1-6									
Y	JP 57-130967 A (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.), 13 August, 1982 (13.08.82), & BR 8102220 A & JP 56-154452 A & AU 8169075 A & ES 501235 A & EP 38636 A2 & US 4321081 A & ZA 8102259 A & CA 1157471 A	1-6									
<p><input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.</p>											
<p>* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family</p>											
<p>Date of the actual completion of the international search 22 September, 2003 (22.09.03)</p>		<p>Date of mailing of the international search report 07 October, 2003 (07.10.03)</p>									
<p>Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office</p>		<p>Authorized officer</p>									
<p>Facsimile No.</p>		<p>Telephone No.</p>									

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/09405

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP 2000-281513 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.), 10 October, 2000 (10.10.00), (Family: none)	1-6
Y	JP 2000-247814 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.), 12 September, 2000 (12.09.00), (Family: none)	1-6
Y	JP 10-7657 A (SANKYO CO., LTD.), 13 January, 1998 (13.01.98), (Family: none)	1-6
Y	JP 8-291146 A (SANKYO CO., LTD.), 05 November, 1996 (05.11.96), (Family: none)	1-6
Y	WO 93/09099 A2 (SCHERING AGROCHEMICALS LTD.), 13 May, 1993 (13.05.93), & AU 9229202 A & EP 625970 A1 & JP 7-501053 A & HU 67634 A & JP 2002-234889 A & IL 103635 A & ZA 9208564 A & BR 9206727 A & FI 9402090 A & US 5559081 A & US 5885935 A	1-6
Y	JP 57-209266 A (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.), 22 December, 1982 (22.12.82), (Family: none)	1-6
P,X	WO 02/088094 A1 (EISAI CO., LTD.), 07 November, 2002 (07.11.02), RN=474830-95-0 (Family: none)	1
X	WO 02/26228 A1 (BRISTOL MYERS SQUIBB CO.), 04 April, 2002 (04.04.02), RN=406943-63-3 & US 6506738 B1	1
X	WO 02/00656 A2 (LILLY ICOS LLC), 03 January, 2002 (03.01.02), RN=385770-68-3, 385770-93-4 & AU 2001061707 A	1
X	EP 822185 A1 (PFIZER INC.), 04 February, 1998 (04.02.98), RN=202650-25-7, 202650-26-8, 202650-27-9 & CA 2211866 A & JP 10-87615 A & US 5859044 A	1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/09405

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 93/07128 A1 (DU PONT MERCK PHARMACEUTICAL CO.), 02 April, 1993 (02.04.93), RN=152929-26-5 & AU 9228715 A & EP 607334 A1 & HU 67285 A & BR 9206623 A & EP 765873 A1 & EP 1153921 A1 & FI 9401649 A & NO 9401278 A & AU 9461808 A	1
X	WO 96/02542 A1 (TAKEDA CHEMICAL IND., LTD.), 01 February, 1996 (01.02.96), & CA 2193223 A & AU 9529358 A & EP 771319 A1 & CN 1153516 A & US 5958942 A & US 2001/051631 A1	1
X	WO 93/13077 A1 (WARNER-LAMBERT CO.), 08 July, 1993 (08.07.93), RN=152146-37-7, 152146-38-8 & US 5308853 A & AU 9332762 A	1
X	WO 92/19594 A1 (SMITHKLINE BECKMAN CORP.), 12 November, 1992 (12.11.92), RN=146426-86-0 & CA 2102106 A & AU 9219170 A & CN 1067244 A & EP 584208 A1 & JP 6-507405 A & ZA 9203210 A	1
X	EP 516392 A2 (IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC.), 02 December, 1992 (02.12.92), RN=146720-01-6 & ZA 9203478 A & AU 9216251 A & HU 61303 A & CA 2068946 A & GB 2256196 A & NO 9202147 A & US 5217976 A & CN 1073174 A & BR 9202099 A & JP 5-163271 A & US 5294620 A	1
X	EP 324377 A2 (DU PONT DE NEMOURS, E.I., & CO.), 19 July, 1989 (19.07.89), RN=114773-55-6, 114798-54-8, 114798-55-9 & US 5138069 A & CA 1338238 A & WO 89/06233 A1 & JP 3-501020 A & EP 733366 A2 & DK 8900051 A & FI 8900070 A & NO 8900075 A & AU 8927771 A & ZA 8900127 A & SU 1814646 A & HU 64038 A & US 5128355 A & US 5153197 A & US 5155118 A & US 5210079 A & US 5354867 A	1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/09405

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 88/06580 A1 (SCHERING A.-G.), 07 September, 1988 (07.09.88), RN=119343-67-8, 119343-99-6, 119343-68-9, 119344-00-2, 1193-44-01-3 & DE 3706585 A & EP 346367 A1 & JP 2-502376 A	1, 2
X	EP 253310 A2 (DU PONT DE NEMOURS, E.I., & CO.), 20 January, 1988 (20.01.88), RN=114773-55-6, 114798-54-8, 114798-55-9 & CA 1334092 A & NO 8702863 A & DK 8703596 A & FI 8703071 A & AU 8775596 A & HU 45976 A & ZA 8705052 A & SU 1694062 A & IL 83153 A & US 5128355 A & US 5153197 A & US 5155118 A	1
X	J.Med.Chem., (1995), 38(19), p.3759-71 RN=171515-70-1, 171515-71-2, 171515-69-8	1
X	Eur.J.Med.Chem., (1993), 28(3), p.195-9 RN=152342-79-5 etc.	1, 2
X	Bull.Chem.Soc.Japan, (1993), 66(2), p.432-6 PN=146831-91-6	1
X	J.Med.Chem., (1987), 30(4), pages 696 to 704 RN=107037-64-9, 107037-54-7	1, 2

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D209/48, 237/32, 239/52, 249/04, 249/12, 251/08, 253/06, 257/04, 277/34, 401/04, 403/04, A01N43/38, 43/50, 43/54, 43/58, 43/64, 43/647, 43/653, 43/707, 43/713, 43/78, 47/02

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D209/48, 237/32, 239/52, 249/04, 249/12, 251/08, 253/06, 257/04, 277/34, 401/04, 403/04, A01N43/38, 43/50, 43/54, 43/58, 43/64, 43/647, 43/653, 43/707, 43/713, 43/78, 47/02

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で利用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	GB 1593809 A (CIBA-GEIGY A.-G.) 1981.07.22 & DE 2815820 A & CH 629076 A & CH 632131 A & NL 7803885 A & FR 2387219 A & AU 7835084 A & CA 1102801 A & IL 54501 A & BE 865979 A & SE 7804244 A & DK 7801646 A & BR 7802330 A & ZA 7802158 A & ES 468807 A & JP 53-130652 A	1-6
Y	JP 57-130967 A (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.) 1982.08.13 & BR 8102220 A & JP 56-154452 A & AU 8169075 A & ES 501235 A & EP 38636 A2 & US 4321081 A & ZA 8102259 A & CA 1157471 A	1-6

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

* 引用文献のカテゴリー	の日の後に公表された文献
「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの	「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの	「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)	「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献	「&」 同一パテントファミリー文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願	

国際調査を完了した日 22.09.03

国際調査報告の発送日 07.10.03

国際調査機関の名称及びあて先
日本国特許庁 (ISA/JP)
郵便番号100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員) 4P 9159
富永 保
電話番号 03-3581-1101 内線 3490

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	JP 2000-281513 A(KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO.,LTD.) 2000.10.10 (ファミリーなし)	1-6
Y	JP 2000-247814 A(KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO.,LTD.) 2000.09.12 (ファミリーなし)	1-6
Y	JP 10-7657 A(SANKYO CO.,LTD.) 1998.01.13 (ファミリーなし)	1-6
Y	JP 8-291146 A(SANKYO CO.,LTD.) 1996.11.05 (ファミリーなし)	1-6
Y	WO 93/09099 A2(SCHERING AGROCHEMICALS LTD.) 1993.05.13 & AU 9229202 A & EP 625970 A1 & JP 7-501053 A & HU 67634 A & JP 2002-234889 A & IL 103635 A & ZA 9208564 A & BR 9206727 A & FI 9402090 A & US 5559081 A & US 5885935 A	1-6
Y	JP 57-209266 A(SUMITOMO CHEMICAL CO.,LTD.) 1982.12.22 (ファミリーなし)	1-6
PX	WO 02/088094 A1(EISAI CO.,LTD.) 2002.11.07 RN=474830-95-0 (ファミリーなし)	1
X	WO 02/26228 A1(BRISTOL MYERS SQUIBB COMPANY) 2002.04.04 RN=406943-63-3 & US 6506738 B1	1
X	WO 02/00656 A2(LILLY ICOS LLC) 2002.01.03 RN=385770-68-3, 385770-93-4 & AU 2001061707 A	1
X	EP 822185 A1(PFIZER INC.) 1998.02.04 RN=202650-25-7, 202650-2 6-8, 202650-27-9 & CA 2211866 A & JP 10-87615 A & US 5859044 A	1
X	WO 93/07128 A1(DU PONT MERCK PHARMACEUTICAL COMPANY) 1993.04. 02 RN=152929-26-5 & AU 9228715 A & EP 607334 A1 & HU 67285 A & BR 9206623 A & EP 765873 A1 & EP 1153921 A1 & FI 9401649 A & NO 9401278 A & AU 9461808 A	1
X	WO 96/02542 A1(TAKEDA CHEMICAL IND.,LTD.) 1996.02.01 & CA 2193223 A & AU 9529358 A & EP 771319 A1 & CN 1153516 A & US 5958942 A & US 2001/051631 A1	1
X	WO 93/13077 A1(WARNER-LAMBERT CO.) 1993.07.08 RN=152146-37- 7, 152146-38-8 & US 5308853 A & AU 9332762 A	1

C (続き) . 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO 92/19594 A1(SMITHKLINE BECKMAN CORP.) 1992. 11. 12 RN=14642 6-86-0 & CA 2102106 A & AU 9219170 A & CN 1067244 A & EP 584208 A1 & JP 6-507405 A & ZA 9203210 A	1
X	EP 516392 A2(IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC) 1992. 12. 02 RN =146720-01-6 & ZA 9203478 A & AU 9216251 A & HU 61303 A & CA 2068946 A & GB 2256196 A & NO 9202147 A & US 5217976 A & CN 1073174 A & BR 9202099 A & JP 5-163271 A & US 5294620 A	1
X	EP 324377 A2(DU PONT DE NEMOURS, E. I., & CO.) 1989. 07. 19 RN=114773-55-6, 114798-54-8, 114798-55-9 & US 5138069 A & CA 1338238 A & WO 89/06233 A1 & JP 3-501020 A & EP 733366 A2 & DK 8900051 A & FI 8900070 A & NO 8900075 A & AU 8927771 A & ZA 8900127 A & SU 1814646 A & HU 64038 A & US 5128355 A & US 5153197 A & US 5155118 A & US 5210079 A & US 5354867 A	1
X	WO 88/06580 A1(SCHERING A. -G.) 1988. 09. 07 RN=119343-67-8, 119 343-99-6, 119343-68-9, 119344-00-2, 1193-44-01-3 & DE 3706585 A & EP 346367 A1 & JP 2-502376 A	1, 2
X	EP 253310 A2(DU PONT DE NEMOURS E. I., & CO.) 1988. 01. 20 RN=11 4773-55-6, 114798-54-8, 114798-55-9 & CA 1334092 A & NO 8702863 A & DK 8703596 A & FI 8703071 A & AU 8775596 A & HU 45976 A & ZA 8705052 A & SU 1694062 A & IL 83153 A & US 5128355 A & US 5153197 A & US 5155118 A	1
X	J. Med. Chem., (1995), 38(19), p. 3759-71 RN=171515-70-1, 171515-71 -2, 171515-69-8	1
X	Eur. J. Med. Chem., (1993), 28(3), p. 195-9 RN=152342-79-5 etc.	1, 2
X	Bull. Chem. Soc. Japan, (1993), 66(2), p. 432-6 RN=146831-91-6	1
X	J. Med. Chem., (1987), 30(4), p. 696-704 RN=107037-64-9, 107037-54- 7	1, 2