

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2016 年 8 月 4 日(04.08.2016)



(10) 国際公開番号

WO 2016/121997 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 401/04 (2006.01) C07D 413/04 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01) C07D 417/04 (2006.01)
A01N 43/76 (2006.01) C07D 471/04 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01) C07D 498/04 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01) C07D 513/04 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2016/052841

(22) 国際出願日: 2016 年 1 月 29 日(29.01.2016)

(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 2015-015041 2015 年 1 月 29 日(29.01.2015) JP
特願 2015-256132 2015 年 12 月 28 日(28.12.2015) JP

(71) 出願人: 日本農薬株式会社(NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1048386 東京都中央区京橋 1 丁目 1 9 番 8 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 米村 樹(YONEMURA, Ikki); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 諏訪 明之(SUWA, Akiyuki); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町 3

4 5 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 松尾 宗一郎(MATSUO, Soichiro); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 青木 孝憲(AOKI, Takanori); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町 3 4 5 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 岩谷 龍(IWATANI, Ryo); 〒5300003 大阪府大阪市北区堂島 2 丁目 1 番 3 1 号 京阪堂島ビル 3 階 Osaka (JP).

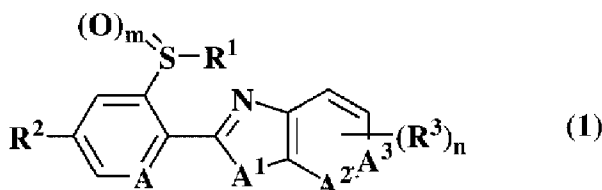
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG,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

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユー

[続葉有]

(54) Title: FUSED HETEROCYCLIC COMPOUND HAVING CYCLOALKYLPYRIDYL GROUP OR SALT THEREOF, AND AGRICULTURAL OR HORTICULTURAL INSECTICIDE CONTAINING SAID COMPOUND AND USE METHOD THEREFOR

(54) 発明の名称: シクロアルキルピリジル基を有する縮合複素環化合物又はその塩類及び該化合物を含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法



(57) Abstract: The present invention addresses the problem of developing and providing a novel agricultural or horticultural insecticide, because in crop production in agriculture, horticulture, etc., damage caused by pests, etc. is still serious and because of, for example, the growth of pests having resistance to existing pesticides. Provided are: a fused heterocyclic compound represented by general formula (1) or a salt thereof; an agricultural or horticultural insecticide containing the compound or salt as an active ingredient; and a method for using the insecticide. (In the formula, R¹ represents an ethyl group; R² represents a cycloalkyl group; R³ represents a haloalkyl group; A, A², and A³ each represent a nitrogen atom or a CH group; A¹ represents N-Me; m is 0 or 2; and n is 1.)

(57) 要約: 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害が今なお大きいことから、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤を開発し、提供することを課題とする。一般式(1) {式中、R¹はエチル基を示し、R²は、シクロアルキル基を示し、R³はハロアルキル基を示し、A、A²、及びA³は窒素原子又はCH基を示し、A¹は、N-Meを示す。mは0、又は2を示し、nは1を示す。}で表される縮合複素環化合物又はその塩類、これを有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法を提供する。



WO 2016/121997 A1



ロシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨー
ロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV,
MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK,
SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

明 細 書

発明の名称：

シクロアルキルピリジル基を有する縮合複素環化合物又はその塩類及び該化合物を含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

技術分野

[0001] 本発明は、シクロアルキルピリジル基を有する縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びに該使用方法に関する。

背景技術

[0002] これまでに農園芸用殺虫剤として様々な化合物が検討されており、ある種の縮合複素環化合物が殺虫剤として有用であることが報告されている（例えば特許文献1～7参照）。かかる文献中には、シクロアルキルピリジル基が縮合複素環と結合した化合物は一切開示されていない。

先行技術文献

特許文献

- [0003] 特許文献1：特開2009-280574号公報
特許文献2：特開2010-275301号公報
特許文献3：特開2011-79774号公報
特許文献4：特開2012-131780号公報
特許文献5：国際公開第2012/086848号パンフレット
特許文献6：国際公開第2014/142135号パンフレット
特許文献7：国際公開第2014/715号パンフレット

発明の概要

発明が解決しようとする課題

- [0004] 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤の開発が望まれている。

課題を解決するための手段

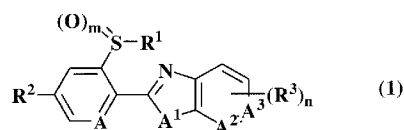
[0005] 本発明者等は上記の課題を解決すべく鋭意検討した結果、一般式（１）で表されるシクロアルキルピリジル基等を有する縮合複素環化合物又はその塩類が農園芸用害虫に対して優れた防除効果を有することを見出し、本発明に至った。

即ち、本発明は、

[1]

一般式（１）：

[化1]



{式中、 R^1 は、

- (a1) (C_1-C_6) アルキル基；
- (a2) (C_3-C_6) シクロアルキル基；
- (a3) (C_2-C_6) アルケニル基；又は
- (a4) (C_2-C_6) アルキニル基；を示す。

R^2 は、

- (b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基；
- (b2) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基；
- (b3) ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基；
- (b4) (C_1-C_6) アルキルチオ基；又は
- (b5) 同一又は異なっても良く、
- (a) ハロゲン原子、
- (b) シアノ基、
- (c) シアノ (C_1-C_6) アルキル基、
- (d) ホルミル基、
- (e) ヒドロキシ (C_1-C_6) アルキル基、

- (f) ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (g) ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (h) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (i) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (j) ($C_1 - C_6$) アルキルチオ ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (k) ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (l) ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (m) ($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル基、
- (n) カルボキシル基、
- (o) ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル基、
- (p) ハロ ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル基、
- (q) ($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル基、
- (r) ($C_1 - C_6$) アルキルカルボニルオキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (s) ($C_3 - C_6$) シクロアルキルカルボニルオキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (t) ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニルオキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、
- (u) $R^5 (R^6) N$ 基 (式中、 R^5 及び R^6 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、($C_3 - C_6$) シクロアルキル基、($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_1 - C_6$) アルキル基、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル基、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル基、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル基、又はジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノカルボニル基 (ここで、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノのアルキル基は同一又は異なってもよい) を示す。) ;
- (v) $R^5 (R^6) N (C_1 - C_6)$ アルキル基 (式中、 R^5 及び R^6 は、前記と同じ。)
- (w) $R^5 (R^6) N$ カルボニル基 (式中、 R^5 及び R^6 は、前記と同じ。)
- (x) $R^5 (R^6) N$ カルボニルオキシ ($C_1 - C_6$) アルキル基、(式中、 R^5 及び R^6 は、前記と同じ。) 及び
- (y) $C (R^5) = NOR^6$ 基 (式中、 R^5 及び R^6 は前記に同じ。) ; から選択さ

れる 1 ～ 2 の置換基を環上に有する (C_3-C_6) シクロアルキル基；を示す。

R^3 は、

- (c1) ハロゲン原子；
- (c2) シアノ基；
- (c3) ニトロ基；
- (c4) (C_1-C_6) アルキル基；
- (c5) (C_1-C_6) アルコキシ基；
- (c6) (C_2-C_6) アルケニルオキシ基；
- (c7) (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；
- (c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；
- (c9) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基；
- (c10) ハロ (C_2-C_6) アルケニルオキシ基；
- (c11) ハロ (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；
- (c12) (C_1-C_6) アルキルチオ基；
- (c13) (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基；
- (c14) (C_1-C_6) アルキルスルホニル基；
- (c15) ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基；
- (c16) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基又は
- (c17) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基を示す。

A 、 A^2 及び A^3 は、 CH 、又は窒素原子を示し、

A^1 は、 O 、 S 、又は $N-R^4$ を示す（ここで R^4 は、

- (d1) (C_1-C_6) アルキル基；
- (d2) (C_3-C_6) シクロアルキル基；
- (d3) (C_2-C_6) アルケニル基；又は
- (d4) (C_2-C_6) アルキニル基；を示す)。

但し、 A^1 が $N-R^4$ の場合、 A^2 、 A^3 が同時に窒素原子である場合を除く。

m は 0、1、又は 2 を示し、 n は 1、又は 2 を示す。}

で示される縮合複素環化合物又はその塩類、

[2] R^1 が(a1) (C_1-C_6) アルキル基であり、

R^2 が(b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基；

(b4) (C_1-C_6) アルキルチオ基；又は

(b5) 同一又は異なっても良く、

(b) シアノ基、

(c) シアノ (C_1-C_6) アルキル基、

(d) ホルミル基、

(e) ヒドロキシ (C_1-C_6) アルキル基、

(f) ハロ (C_1-C_6) アルキル基、

(g) (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基、

(h) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基、

(i) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基、

(j) (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、

(k) (C_1-C_6) アルキルスルフィニル (C_1-C_6) アルキル基、

(l) (C_1-C_6) アルキルスルホニル (C_1-C_6) アルキル基、

(m) (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、

(n) カルボキシル基、

(o) (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、

(p) ハロ (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、

(q) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、

(r) (C_1-C_6) アルキルカルボニルオキシ (C_1-C_6) アルキル基、

(s) (C_3-C_6) シクロアルキルカルボニルオキシ (C_1-C_6) アルキル基、

(t) (C_1-C_6) アルコキシカルボニルオキシ (C_1-C_6) アルキル基、

(u) R^5 (R^6) N基 (式中、 R^5 及び R^6 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_3-C_6) シクロアルキル基、(C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル

基、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル基、又はジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノカルボニル基（ここで、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノのアルキル基は同一又は異なってもよい）を示す。）；
(v) $R^5 (R^6) N (C_1 - C_6)$ アルキル基（式中、 R^5 及び R^6 は、前記と同じ。）

(w) $R^5 (R^6) N$ カルボニル基（式中、 R^5 及び R^6 は、前記と同じ。）

(x) $R^5 (R^6) N$ カルボニルオキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル基、（式中、 R^5 及び R^6 は、前記と同じ。）及び

(y) $C (R^5) = N O R^6$ 基（式中、 R^5 及び R^6 は前記に同じ。）；から選択される1～2の置換基を環上に有する $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル基であり、

R^3 が、

(c8) ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル基；

(c9) ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基；

(c12) $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基；又は

(c15) ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基であり、

A 、 A^2 及び A^3 が、 CH 、又は窒素原子であり、

A^1 が、 O 、 S 、又は $N - R^4$ であり（ここで R^4 は(d1) $(C_1 - C_6)$ アルキル基；を示す）、

A^1 が $N - R^4$ の場合、 A^2 及び A^3 が同時に窒素原子である場合を除き、

m が0、1、又は2であり、

n が1である

[1] に記載の縮合複素環化合物又はその塩類、

[3] R^1 が、(a1) $(C_1 - C_6)$ アルキル基を示し、

R^2 が、(b1) $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル基；又は

(b5) 同一又は異なっても良く、

(b) シアノ基、

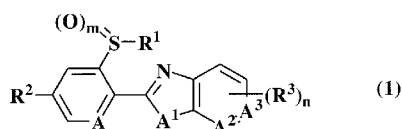
(n) カルボキシル基、

(o) (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、
 (t) (C_1-C_6) アルコキシカルボニルオキシ (C_1-C_6) アルキル基、若しくは
 (w) R^5 (R^6) Nカルボニル基 (式中、 R^5 及び R^6 は、前記と同じ。) ;
 から選択される 1 ~ 2 の置換基を環上に有する (C_3-C_6) シクロアルキル基 ; を示し、
 R^3 が、(c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基 ; を示し、
 A 、 A^2 及び A^3 が、窒素原子を示し、
 A^1 が、 $N-R^4$ を示し (ここで R^4 は (d1) (C_1-C_6) アルキル基を示し、 A^2 及び A^3 が同時に窒素原子である場合を除く)、
 m が 0、又は 2 を示し、
 n が 1 を示す

[1] に記載の縮合複素環化合物又はその塩類、

[4]

[化2]



{ 式中、 R^1 は、(a1) (C_1-C_6) アルキル基 ; (a2) (C_3-C_6) シクロアルキル基 ;

(a3) (C_2-C_6) アルケニル基 ; 又は (a4) (C_2-C_6) アルキニル基 ; を示す。
 。

R^2 は、(b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基 ; (b2) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基 ; (b3) ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基 ; 又は

(b4) (C_1-C_6) アルキルチオ基 ; を示す。

R^3 は、(c1) ハロゲン原子 ; (c2) シアノ基 ; (c3) ニトロ基 ; (c4) (C_1-C_6) アルキル基 ; (c5) (C_1-C_6) アルコキシ基 ; (c6) (C_2-C_6)

アルケニルオキシ基；(c7) (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；(c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；(c9) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基；(c10) ハロ (C_2-C_6) アルケニルオキシ基；(c11) ハロ (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；(c12) (C_1-C_6) アルキルチオ基；(c13) (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基；(c14) (C_1-C_6) アルキルスルホニル基；(c15) ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基；(c16) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基；又は(c17) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基を示す。

A 及び A^2 、 A^3 は、CH、又は窒素原子を示し、 A^1 は、O、S、又は $N-R^4$ を示す（ここで R^4 は、(d1) (C_1-C_6) アルキル基；(d2) (C_3-C_6) シクロアルキル基；(d3) (C_2-C_6) アルケニル基；又は(d4) (C_2-C_6) アルキニル基；を示す）。但し、 A^1 が $N-R^4$ の場合、 A^2 、 A^3 が同時に窒素原子である場合を除く。m は 0、1、又は 2 を示し、n は 1、又は 2 を示す。}

で示される縮合複素環化合物、

[5] R^1 が、(a1) (C_1-C_6) アルキル基；を示し、 R^2 が、(b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基；又は(b4) (C_1-C_6) アルキルチオ基；を示し、 R^3 が、(c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；(c9) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基；(c12) (C_1-C_6) アルキルチオ基；又は(c15) ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基；を示す。

A 及び A^2 、 A^3 が、CH、又は窒素原子を示し、 A^1 が、 $N-R^4$ を示す（ここで R^4 は、(d1) (C_1-C_6) アルキル基；を示す）。m が 0、又は 2 を示し、n は 1 を示す、[4] に記載の縮合複素環化合物、

[6] R^1 が、(a1) (C_1-C_6) アルキル基；を示し、 R^2 が、(b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基；を示し、 R^3 が、(c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；を示す。

A 及び A^2 、 A^3 が、CH、又は窒素原子を示し、 A^1 が、O、S、又は $N-R^4$ を示す（ここで R^4 は、(d1) (C_1-C_6) アルキル基；を示す）。m が 0、又は 2 を示し、n は 1 を示す、[4] に記載の縮合複素環化合物、

〔 7 〕〔 1 〕～〔 6 〕の何れかに記載の縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤、

〔 8 〕〔 1 〕～〔 6 〕の何れかに記載の縮合複素環化合物又はその塩類の有効量で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用方法、

〔 9 〕〔 1 〕～〔 6 〕の何れかに記載の縮合複素環化合物又はその塩類の有効量を有効成分として含有することを特徴とする外部寄生虫防除剤、に関する。

発明の効果

[0006] 本発明のシクロアルキルピリジル基を有する縮合複素環化合物又はその塩類は農園芸用殺虫剤として優れた効果を有するだけでなく、犬や猫といった愛玩動物、又は牛や羊等の家畜の体内外に寄生する害虫に対しても効果を有する。

発明を実施するための形態

[0007] 本発明の縮合複素環化合物又はその塩類の一般式（ 1 ）の定義において、「ハロ」とは「ハロゲン原子」を意味し、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子を示す。

[0008] 「（ C_1-C_6 ）アルキル基」とは、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペンチル基、イソペンチル基、ターシャリーペンチル基、ネオペンチル基、2，3-ジメチルプロピル基、1-エチルプロピル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、ノルマルヘキシル基、イソヘキシル基、2-ヘキシル基、3-ヘキシル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、1，1，2-トリメチルプロピル基、3，3-ジメチルブチル基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1 ～ 6 個のアルキル基を示す。

[0009] 「（ C_3-C_6 ）シクロアルキル基」とは、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素原子数 3 ～ 6 個

の環状のアルキル基を示し、「 (C_1-C_6) アルコキシ基」としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基、ノルマルブトキシ基、セカンダリーブトキシ基、ターシャリーブトキシ基、ノルマルペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ターシャリーペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、2, 3-ジメチルプロピルオキシ基、1-エチルプロピルオキシ基、1-メチルブチルオキシ基、ノルマルヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、1, 1, 2-トリメチルプロピルオキシ基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し、「 (C_2-C_6) アルケニルオキシ基」としては、例えば、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基、ペンテニルオキシ基、ヘキセニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルケニルオキシ基を示し、「 (C_2-C_6) アルキニルオキシ基」としては、例えば、プロピニルオキシ基、ブチニルオキシ基、ペンチニルオキシ基、ヘキシニルオキシ基等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルキニルオキシ基を示す。

[0010] 「 (C_1-C_6) アルキルチオ基」としては、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ノルマルブチルチオ基、セカンダリーブチルチオ基、ターシャリーブチルチオ基、ノルマルペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ターシャリーペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、2, 3-ジメチルプロピルチオ基、1-エチルプロピルチオ基、1-メチルブチルチオ基、ノルマルヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基、1, 1, 2-トリメチルプロピルチオ基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し、「 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基」としては、例えば、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ノルマルプロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ノルマルブチルスルフィニル基、セカンダリーブチルスルフィニル基、ターシャリーブチルスルフィニル基、ノルマルペンチルスルフィニル基、イソペンチルスルフィニル基、ターシャリーペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、2, 3-ジメチルプロピルスルフィニル基、1-エチルプロピ

ルスルフィニル基、1-メチルブチルスルフィニル基、ノルマルヘキシルスルフィニル基、イソヘキシルスルフィニル基、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルフィニル基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し、「(C₁-C₆) アルキルスルホニル基」としては、例えば、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ノルマルプロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ノルマルブチルスルホニル基、セカンダリーブチルスルホニル基、ターシャリーブチルスルホニル基、ノルマルペンチルスルホニル基、イソペンチルスルホニル基、ターシャリーペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、2, 3-ジメチルプロピルスルホニル基、1-エチルプロピルスルホニル基、1-メチルブチルスルホニル基、ノルマルヘキシルスルホニル基、イソヘキシルスルホニル基、1, 1, 2-トリメチルプロピルスルホニル基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。

- [0011] 上記「(C₁-C₆) アルキル基」、「(C₂-C₆) アルケニル基」、「(C₂-C₆) アルキニル基」、「(C₃-C₆) シクロアルキル基」、「(C₃-C₆) シクロアルキルオキシ基」、「(C₁-C₆) アルコキシ基」、「(C₂-C₆) アルケニルオキシ基」、「(C₂-C₆) アルキニルオキシ基」、「(C₁-C₆) アルキルチオ基」、「(C₁-C₆) アルキルスルフィニル基」、「(C₁-C₆) アルキルスルホニル基」、「(C₂-C₆) アルケニルチオ基」、「(C₂-C₆) アルキニルチオ基」、「(C₂-C₆) アルケニルスルフィニル基」、「(C₂-C₆) アルキニルスルフィニル基」、「(C₂-C₆) アルケニルスルホニル基」、「(C₂-C₆) アルキニルスルホニル基」、「(C₃-C₆) シクロアルキル基」、「(C₁-C₆) アルコキシ基」、「(C₂-C₆) アルケニルオキシ基」、「(C₂-C₆) アルキニルオキシ基」、「(C₃-C₆) シクロアルキルチオ基」、「(C₃-C₆) シクロアルキルスルフィニル基」又は「(C₃-C₆) シクロアルキルスルホニル基」の置換し得る位置に1又は2以上のハロゲン原子が置換されていても良く、置換されるハロゲン原子が2以上の場合は、ハロゲン原子は同一又は異なっても良い。

[0012] 上記 1 又は 2 以上のハロゲン原子が置換された置換基はそれぞれ、「ハロ (C_1-C_6) アルキル基」、「ハロ (C_2-C_6) アルケニル基」、「ハロ (C_2-C_6) アルキニル基」、「ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基」、「ハロ (C_3-C_6) シクロアルキルオキシ基」、「ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基」、「ハロ (C_2-C_6) アルケニルオキシ基」、「ハロ (C_2-C_6) アルキニルオキシ基」、「ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基」、「ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基」、「ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基」、「ハロ (C_2-C_6) アルケニルチオ基」、「ハロ (C_2-C_6) アルキニルチオ基」、「ハロ (C_2-C_6) アルケニルスルフィニル基」、「ハロ (C_2-C_6) アルキニルスルフィニル基」、「ハロ (C_2-C_6) アルケニルスルホニル基」、「ハロ (C_2-C_6) アルキニルスルホニル基」、「ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基」、「ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基」、「ハロ (C_2-C_6) アルケニルオキシ基」、「ハロ (C_2-C_6) アルキニルオキシ基」、「ハロ (C_3-C_6) シクロアルキルチオ基」、「ハロ (C_3-C_6) シクロアルキルスルフィニル基」又は「ハロ (C_3-C_6) シクロアルキルスルホニル基」と示す。

[0013] 「(C_1-C_6)」、「(C_2-C_6)」、「(C_3-C_6)」等の表現は各種置換基の炭素原子数の範囲を示す。更に、上記置換基が連結した基についても上記定義を示すことができ、例えば、「(C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基」の場合は直鎖又は分岐鎖状の炭素数 1～6 個のアルコキシ基が直鎖又は分岐鎖状の炭素数 1～6 個のアルキル基に結合していることを示す。

[0014] 本発明の一般式 (1) で表される縮合複素環化合物の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、トリメチルアンモニウム等の無機又は有機の塩基との塩類を例示することができる。

[0015] 本発明の一般式（１）で表される縮合複素環化合物及びその塩類は、その構造式中に１つ又は複数個の不斉中心を有する場合があります、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（１）で表される化合物及びその塩類は、その構造式中に炭素－炭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。

[0016] 本発明のひとつの態様において、一般式（１）で表される縮合複素環化合物及びその塩類は、

R^1 が、(a1) (C_1-C_6) アルキル基であり、

R^2 が、(b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基、又は、(b5)同一又は異なっても良く、(b) シアノ基、(n) カルボキシ基、(o) (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、(t) (C_1-C_6) アルコキシカルボニルオキシ (C_1-C_6) アルキル基、若しくは(w) R^5 (R^6) Nカルボニル基（式中、 R^5 及び R^6 は、前記と同じ。）；から選択される１～２の置換基を環上に有する (C_3-C_6) シクロアルキル基であり、

R^3 が、(c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基であり、

A、 A^2 及び A^3 が、窒素原子であり、

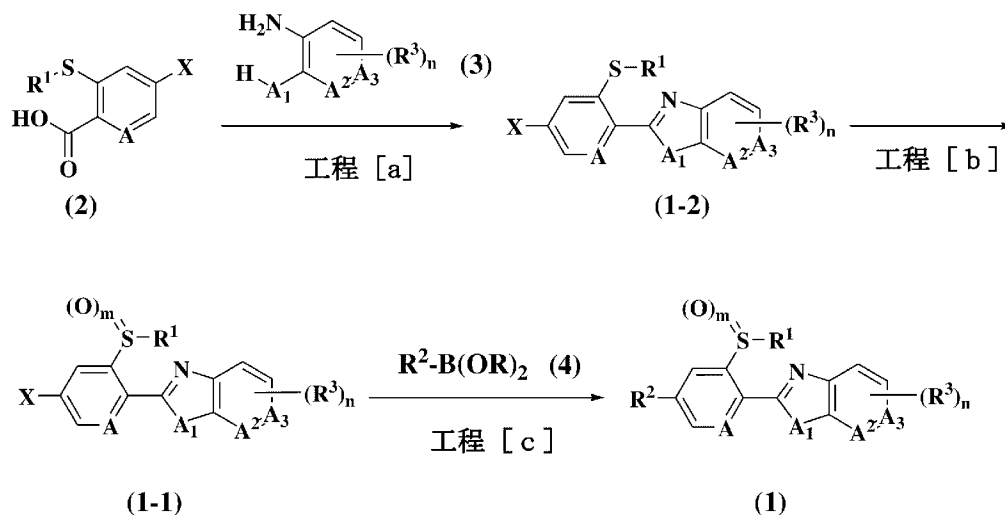
A^1 が、 $N-R^4$ であり（ここで R^4 は(d1) (C_1-C_6) アルキル基を示し、 A^2 及び A^3 が同時に窒素原子である場合を除く）、

mが0、又は2であり、nが1である縮合複素環化合物又はその塩類であることが好ましい。

[0017] 本発明の複合複素環化合物又はその塩類は、例えば下記製造方法によって製造することができるが、本発明はこれらに限定されるものではない。

[0018] 製造方法 1

[化3]



{式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 m 、 n 、 A 、 A^1 、 A^2 、及び A^3 は前記と同じであって、 X はハロゲン原子、 R は水素原子、又は $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル基等を示す。}

[0019] 工程 [a] の製造方法

一般式 (1 - 2) で表される縮合複素環化合物は、一般式 (2) で表されるカルボン酸と一般式 (3) で表される複素環化合物とを縮合剤、塩基及び不活性溶媒の存在下に反応させ、中間体を単離又は単離しないで、次いで酸性条件下で反応することにより製造することができる。

[0020] 本反応で使用する縮合剤としては、例えばシアノリン酸ジエチル (DEPC)、カルボニルジイミダゾール (CDI)、1, 3 - ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化 2 - クロロ - 1 - メチルピリジニウム等を例示することができ、その使用量は一般式 (2) で表され化合物に対して 1 倍モル～1. 5 倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

[0021] 塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム t - ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類；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

ビスクロ [5. 4. 0] ウンデック - 7 - エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式 (2) で表される化合物に対して通常 1 倍モル～10 倍モルの範囲で使用される。

[0022] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒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。

[0023] 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。反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。

[0024] 反応終了後、反応系から中間体を単離又は単離せずに、酸及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより製造することができる。

[0025] 本反応で使用する酸としては、例えば、塩酸、硫酸、硝酸等の無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、安息香酸等の有機酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等のスルホン酸、リン酸等を例示することができ、その使用量は一般式 (2 - 2) で表される縮合複素環化合物に対して0.01倍モル～10倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

[0026] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水

素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒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。

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

[0027] 工程 [b] の製造方法

本反応は、一般式 (1 - 2) で表される縮合複素環化合物を、不活性溶媒中、酸化剤と反応させることにより一般式 (1 - 1) で表される縮合複素環化合物を製造することができる。

[0028] 本反応で使用する酸化剤としては、過酸化水素水、過安息香酸、m-クロル過安息香酸などの過酸化物などが挙げられる。これら酸化剤は、一般式 (1 - 2) で表される縮合複素環化合物に対して0.8倍モル～5倍モルの範囲で適宜選択することができる。

[0029] 本反応で使用す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；アセトニトリル等のニトリル類、酢酸エチル等のエステル類、蟻酸、酢酸等の有機酸類；N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、水等の極性溶媒を挙げることができ、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。

[0030] 本反応における反応温度は -10°C から使用する不活性溶媒の還流温度の範囲で適宜選択すればよい。反応時間は反応規模、反応温度などにより変化し、一定ではないが数分～48時間の範囲で適宜選択すればよい。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すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0031] 工程 [c] の製造方法

一般式 (1-1) で表される縮合複素環化合物と一般式 (4) で表されるホウ酸化合物、又は当該化合物と等価の化合物（例えば、シクロプロピル環状トリオールボレートナトリウム等）とを金属触媒、塩基の存在下、不活性溶媒中にて、文献記載の方法（有機合成化学協会誌 Vol. 69 No. 7 2011 ; Chem. Rev. 2011, 4475 ; WO 2013 / 018928 号パンフレット）に準じてクロスカップリング反応を行い、一般式 (1) で表される縮合複素環化合物を製造することができる。

[0032] 本反応で 사용할 ことができる触媒としては入手可能な0価または2価のパラジウム金属や塩（錯体を含む）などのパラジウム化合物を用いる事ができ、活性炭などに担持されても良い。好ましく用いられる物として、パラジウム (0) / 炭素、酢酸パラジウム (II)、塩化パラジウム (II)、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) クロリド、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) 等を挙げる事ができる。

[0033] 本反応は配位子を加えて反応を行うこともできる。配位子としては、トリフェニルホスフィン (PPh_3)、メチルジフェニルホスフィン (Ph_2PCH_3)、トリフリルホスフィン ($\text{P}(2\text{-furyl})_3$)、トリ (o-トリル) ホスフィン ($\text{P}(\text{o-tol})_3$)、トリ (シクロヘキシル) ホスフィン (PCy_3)、ジシクロヘキシルフェニルホスフィン (PhPCy_2)、トリ (t-ブチル) ホスフィン (P^tBu_3)、2, 2'-ビス (ジフェニルホスフィノ) -1, 1'-ビナフチル (BINAP)、ジフェニルホスフィノフェロセン (DPPF)、1, 1'-ビス (ジ-t-ブチルホス

フィノ) フェロセン (D⁺BPF)、N, N-ジメチル-1-[2-(ジフェニルホスフィノ) フェロセニル] エチルアミン、1-[2-(ジフェニルホスフィノ) フェロセニル] エチルメチルエーテル、Xantphos等のホスフィン系配位子や、イミダゾル-2-イリデンカルベン類等のホスフィンミミック配位子 (アンゲバンテ・ケミー・インターナショナル・エディション・イン・イングリッシュ (Angewandte Chemie International Edition in English) 第36巻、第2163頁 (1997年) 参照) 等が挙げられる。

[0034] 本反応で利用できる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類；水素化ナトリウム、水素化カリウム等の水素化アルカリ金属、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルコキシド類が挙げられる。塩基の使用量は一般式(4)で表される化合物に対して通常約1倍モル～5倍モルの範囲で使用される。

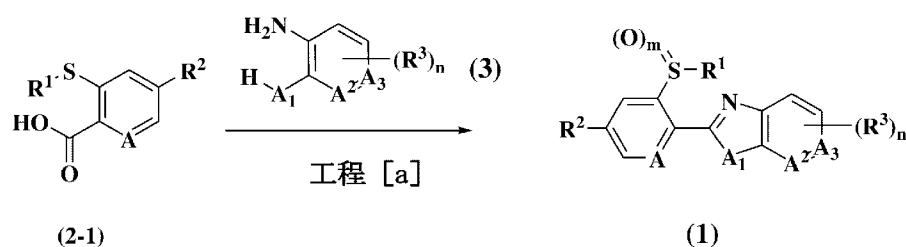
[0035] 本反応で利用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、2-プロパノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸エチル等のエステル類、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒を挙げることができ、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。

[0036] 本反応における反応温度は通常約0℃から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、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～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。一般式(4)で表される化合物、又は

当該化合物と等価の化合物は一般式（１－１）で表される縮合複素環化合物に対して通常約１倍モル～５倍モルの範囲で使用される。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。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すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0037] 製造方法２

[化４]

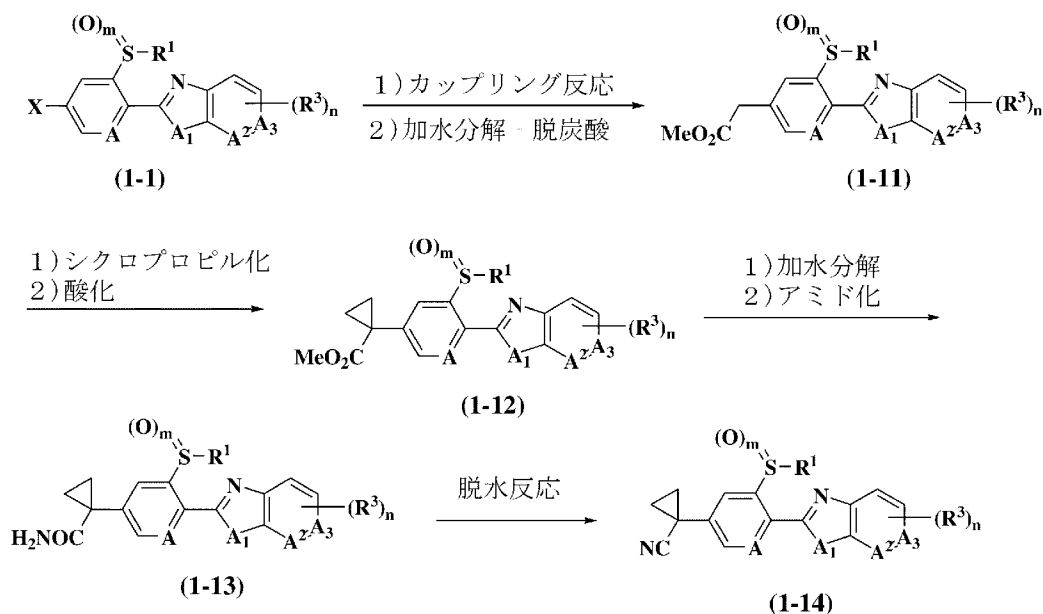


{式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 m 、 n 、 A 、 A^1 、 A^2 、及び A^3 は前記と同じ。}

[0038] また、一般式（１）で表される縮合複素環化合物は、一般式（２－１）で表されるカルボン酸と一般式（３）で表される複素環化合物と上記工程 [a] 及び又は [b] に記載された方法に準じて製造することができる。

[0039] 製造方法３

[化5]



{式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 m 、 n 、 A 、 A^1 、 A^2 、及び A^3 は前記と同じ。}

[0040] また、一般式(1-11)で表される縮合複素環化合物は、文献に記載された方法(Organic Letters、Vol. 9(17)、3469-3472、2007年、Angewandte Chemie International Edition、Vol. 54(47)、13975-13979、2015)に従って一般式(1-1)で表される縮合複素環化合物とマロン酸エステル類とを金属触媒、塩基の存在下、不活性溶媒中にてカップリング反応を行った後、酸性条件下加水分解を行い、その後脱炭酸することにより製造することができる。

[0041] 一般式(1-12)で表される縮合複素環化合物は、一般式(1-11)で表される縮合複素環化合物を、文献に記載された方法(国際公開第2014/113485号パンフレット、Journal of Medicinal Chemistry、57(7)、2963-2988; 2014)に従って、製造することができる。

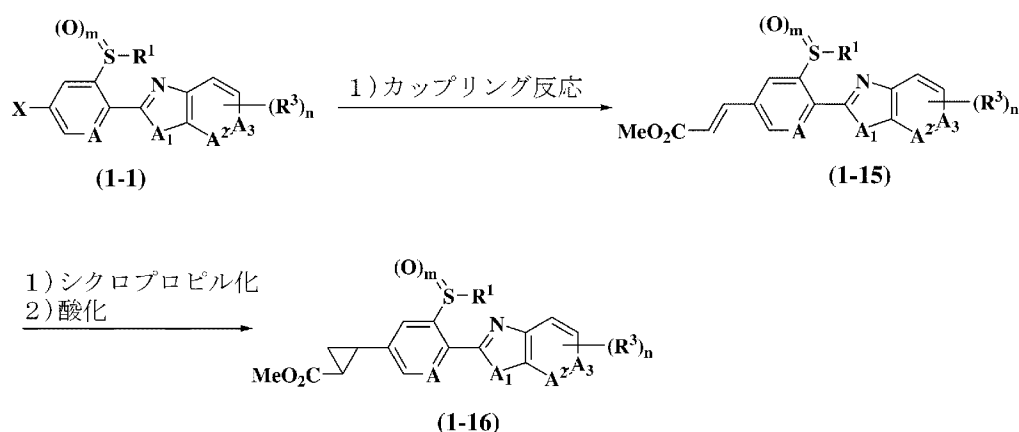
[0042] 一般式(1-13)で表される縮合複素環化合物は、一般式(1-12)で表される縮合複素環化合物を、通常の方法で加水分解し、塩化チオニル又

はシュウ酸ジクロリド等の塩素化剤と反応させ、カルボン酸クロリドとし、アンモニアと反応させることにより製造することができる。

[0043] 一般式(1-14)で表される縮合複素環化合物は、一般式(1-13)で表される縮合複素環化合物を、通常の方法によりオキシ塩化リン等の塩素化剤と反応させることにより製造することができる。

[0044] 製造方法4

[化6]



{式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 m 、 n 、 A 、 A^1 、 A^2 、及び A^3 は前記と同じ。 X はハロゲン原子等の脱離基を示す。}

[0045] 一般式(1-15)で表される縮合複素環化合物は、一般式(1-1)で表される縮合複素環化合物を、文献に記載された方法(Modern Arylation Methods、221-269、Wiley-VCH)に従って製造することができる。

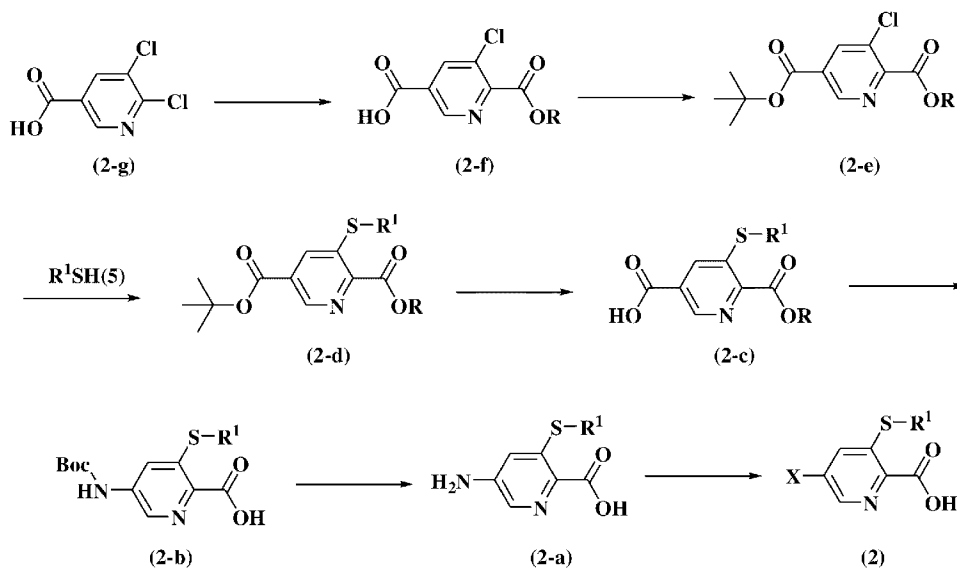
[0046] 一般式(1-16)で表される縮合複素環化合物は、一般式(1-15)で表される縮合複素環化合物を、文献に記載された方法(国際公開第2011/115065号パンフレット)に従って製造することができる。

[0047] 一般式(1-12)及び(1-16)で表される縮合複素環化合物は、メトキシカルボニル基を有することから、当該官能基をカルボン酸に誘導し、Curtius rearrangementにより、アミノ化合物を製造できる。また、メトキシカルボニル基を水素化アルミニウム等により還元し、アルコール化合物を製

造できる。

[0048] 中間体 (2) の製造方法

[化7]



(式中、 R^1 は前記と同じくし、Bocはターシャリーブトキシカルボニル基、 R は $C_1 \sim C_3$ のアルキル基、 X はハロゲン原子を示す。)

[0049] 一般式 (2) で表わされる本発明化合物の製造中間体は、以下の方法により製造することができる。

[0050] 入手可能なジクロロピリジンカルボン酸 (2 - g) をヘック反応、特開 2005-272338号に記載された方法に従って、エステル基が導入されたピリジンカルボン酸 (2 - f) を合成することができる。

[0051] ピリジンジカルボン酸エステル (2 - e) は、まずエステル基が導入されたピリジンカルボン酸 (2 - f) と塩素化剤等とを不活性溶媒下、塩素化させることにより、ピリジンカルボン酸クロリド体に変換することができる。

[0052] 本反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。反応に用いられる塩素化剤としては、塩化チオニル、二塩化オキサリル等

が挙げられる。本反応は、エステル基が導入されたピリジンカルボン酸（2 - f）1 倍モルに対して、塩素化剤が通常 1 ～ 10 倍モルの割合で使うことができる。本反応は、通常 0 ～ 100℃の範囲で行えばよく、反応時間は通常 0.1 ～ 24 時間の範囲である。反応終了後、溶媒、過剰の塩素化剤等を留去することにより、ピリジンカルボン酸クロリド体を製造することができる。

[0053] 次いでかかるピリジンカルボン酸クロリド体を塩基及び不活性溶媒の存在下、ターシャリーブチルアルコールと反応させることにより一般式（2 - e）で表されるピリジンのターシャリーブチルエステル化合物を製造することができる。本反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム t-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類；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]ウンデック-7-エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量はピリジンカルボン酸クロリド体に対して対して通常1倍モル～10倍モルの範囲で使うことができる。

[0054] ピリジンカルボン酸エステル（2 - d）は、一般式（2 - e）で表されるピリジンのターシャリーブチルエステル化合物と一般式（5）で表わされる化合物とを不活性溶媒下、反応させることにより、製造することができる。

[0055] 本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリ

ウム等の無機塩基類、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩類、カリウム *t*-ブトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類；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]ウンデック-7-エン等の第三級アミン類、ピリジン、ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式(2-e)で表されるターシャリーブチルエステル化合物に対して通常1倍モル～10倍モルの範囲で使用される。

また一般式(5)で表わされる化合物のアルカリ塩を使用する場合は、塩基を使用しなくてもよい。

[0056] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒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。

[0057] 本反応は等モル反応であるので、一般式(5)で表わされる化合物と一般式(2-e)で表されるピリジンのターシャリーブチルエステル化合物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-10℃から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0058] ピリジンジカルボン酸(2-c)は、一般式(2-d)で表されるピリジ

ンのターシャリーブチルエステル化合物を酸及び/又は不活性溶媒下、反応させることにより製造することができる。

[0059] 本反応で使用する酸としては、例えば、塩酸、硫酸、硝酸等の無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、安息香酸等の有機酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等のスルホン酸等を例示することができ、その使用量は一般式(2-d)で表されるターシャリーブチルエステル化合物に対して1倍モル～10倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。場合によっては、当該酸類を溶媒として使用することもできる。

[0060] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒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。また前記酸類を溶媒として使用する場合は溶媒を使用しなくてもよい。

[0061] 反応温度は室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。

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

[0062] ピリジンカルボン酸(2-b)は、一般式(2-c)で表されるピリジンカルボン酸とDPPA(ジフェニルリン酸アジド)とをターシャリーブチルアルコール存在下、J. A. Chem. Soc. 1972, 94, 6203

- 6205に記載の方法に従って製造することができる。

[0063] アミノピリジンカルボン酸(2-a)は、一般式(2-b)で表されるピリジンカルボン酸化合物とを、酸、不活性溶媒下、反応させることにより製造することができる。

[0064] 本反応で使用する酸としては、例えば、塩酸、硫酸、硝酸等の無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、安息香酸等の有機酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等のスルホン酸等を例示することができ、その使用量は一般式(2-d)で表されるターシャリーブチルエステル化合物に対して1倍モル～10倍モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。場合によっては、溶媒として使用することもできる。

[0065] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、メチルターシャリーブチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の極性溶媒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。

[0066] 反応温度は-10℃から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲で行えば良い。

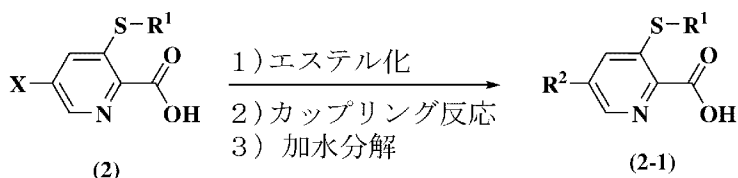
反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0067] ハロピリジンカルボン酸(2)は、一般式(2-a)で表されるアミノピリジンカルボン酸化合物とを、所謂Sandmeyer反応、Chem. R

e v. 1988, 88, 765に記載された方法に準じて製造することができる。

[0068] 中間体 (2 - 1) の製造方法

[化8]



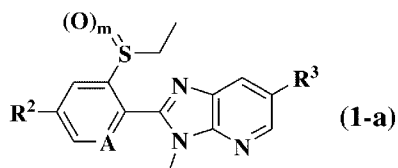
[0069] ハロピリジンカルボン酸エステル化合物 (2 - 1) は、一般式 (2) で表されるピリジンカルボン酸化合物を、通常の方法でエステル化合物にした後、上記工程 [C] に記載した方法でカップリング反応を行い、通常の方法で加水分解することにより製造することができる。

[0070] 中間体 (3) の製造方法

一般式 (3) で表わされる化合物の製造中間体は公知化合物であり、例えば、WO2012/086848号パンフレット、WO2014/142135号パンフレットに記載されている方法により製造することができる。

[0071] 次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。下記の表において、Meはメチル基を、Etはエチル基を、i-Prはイソプロピル基を、c-Prはシクロプロピル基を、t-Buはターシャリーブチル基を、c-Buはシクロブチル基を、c-Pentはシクロペンチル基を示す。Acはアセチル基を示す。物性は融点 (°C) 又はNMRを示し、当該データは別途表に記載する。

[0072] [化9]



[0073]

[表1]

第1表

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
1-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
1-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
1-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
1-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
1-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
1-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
1-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
1-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
1-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
1-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
1-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
1-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
1-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
1-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
1-15	c-Pr	CF ₃	N	2	NMR
1-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	NMR
1-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
1-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	NMR

[0074]

[表2]

第 1 表 続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
1-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
1-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
1-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
1-22	SMe	CF ₃	CH	0	
1-23	SMe	CF ₃	CH	1	
1-24	SMe	CF ₃	CH	2	
1-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
1-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
1-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
1-28	SMe	SCF ₃	N	0	
1-29	SMe	SCF ₃	N	1	
1-30	SMe	SCF ₃	N	2	
1-31	SMe	CF ₃	N	0	
1-32	SMe	CF ₃	N	1	
1-33	SMe	CF ₃	N	2	
1-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
1-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
1-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

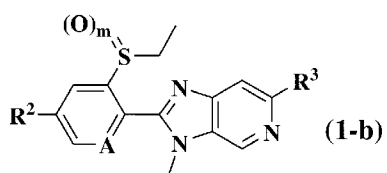
[0075]

[表3]

第1表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
1-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
1-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
1-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
1-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
1-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
1-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
1-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
1-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
1-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
1-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
1-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
1-48	c-Pen	CF ₃	N	2	

[0076] [化10]



[0077]

[表4]

第 2 表

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
2-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
2-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
2-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
2-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
2-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
2-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
2-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
2-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
2-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
2-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
2-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
2-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
2-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
2-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
2-15	c-Pr	CF ₃	N	2	169-173
2-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
2-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
2-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

[0078]

[表5]

第2表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
2-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
2-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
2-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
2-22	SMe	CF ₃	CH	0	
2-23	SMe	CF ₃	CH	1	
2-24	SMe	CF ₃	CH	2	
2-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
2-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
2-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
2-28	SMe	SCF ₃	N	0	
2-29	SMe	SCF ₃	N	1	
2-30	SMe	SCF ₃	N	2	
2-31	SMe	CF ₃	N	0	
2-32	SMe	CF ₃	N	1	
2-33	SMe	CF ₃	N	2	
2-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
2-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
2-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

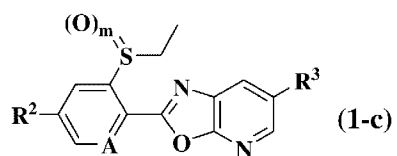
[0079]

[表6]

第2表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
2-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
2-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
2-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
2-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
2-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
2-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
2-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
2-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
2-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
2-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
2-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
2-48	c-Pen	CF ₃	N	2	

[0080] [化11]



[0081]

[表7]

第3表

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
3-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
3-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
3-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
3-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
3-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
3-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
3-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
3-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
3-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
3-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
3-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
3-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
3-13	c-Pr	CF ₃	N	0	NMR
3-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
3-15	c-Pr	CF ₃	N	2	140-141
3-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
3-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
3-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

[0082]

[表8]

第3表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
3-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
3-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
3-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
3-22	SMe	CF ₃	CH	0	
3-23	SMe	CF ₃	CH	1	
3-24	SMe	CF ₃	CH	2	
3-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
3-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
3-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
3-28	SMe	SCF ₃	N	0	
3-29	SMe	SCF ₃	N	1	
3-30	SMe	SCF ₃	N	2	
3-31	SMe	CF ₃	N	0	
3-32	SMe	CF ₃	N	1	
3-33	SMe	CF ₃	N	2	
3-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
3-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
3-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

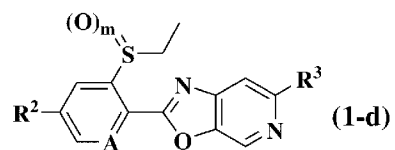
[0083]

[表9]

第3表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
3-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
3-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
3-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
3-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
3-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
3-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
3-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
3-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
3-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
3-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
3-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
3-48	c-Pen	CF ₃	N	2	

[0084] [化12]



[0085]

[表10]

第4表

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
4-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
4-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
4-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
4-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
4-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
4-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
4-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
4-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
4-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
4-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
4-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
4-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
4-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
4-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
4-15	c-Pr	CF ₃	N	2	
4-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
4-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
4-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

[0086]

[表11]

第4表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
4-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
4-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
4-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
4-22	SMe	CF ₃	CH	0	
4-23	SMe	CF ₃	CH	1	
4-24	SMe	CF ₃	CH	2	
4-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
4-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
4-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
4-28	SMe	SCF ₃	N	0	
4-29	SMe	SCF ₃	N	1	
4-30	SMe	SCF ₃	N	2	
4-31	SMe	CF ₃	N	0	
4-32	SMe	CF ₃	N	1	
4-33	SMe	CF ₃	N	2	
4-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
4-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
4-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

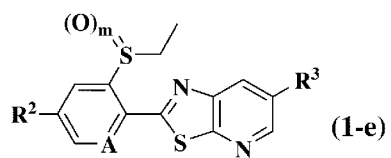
[0087]

[表12]

第4表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
4-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
4-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
4-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
4-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
4-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
4-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
4-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
4-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
4-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
4-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
4-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
4-48	c-Pen	CF ₃	N	2	

[0088] [化13]



[0089]

[表13]

第5表

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
5-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
5-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
5-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
5-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
5-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
5-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
5-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
5-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
5-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
5-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
5-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
5-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
5-13	c-Pr	CF ₃	N	0	177-178
5-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
5-15	c-Pr	CF ₃	N	2	140-141
5-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
5-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
5-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

[0090]

[表14]

第5表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
5-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
5-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
5-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
5-22	SMe	CF ₃	CH	0	
5-23	SMe	CF ₃	CH	1	
5-24	SMe	CF ₃	CH	2	
5-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
5-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
5-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
5-28	SMe	SCF ₃	N	0	
5-29	SMe	SCF ₃	N	1	
5-30	SMe	SCF ₃	N	2	
5-31	SMe	CF ₃	N	0	
5-32	SMe	CF ₃	N	1	
5-33	SMe	CF ₃	N	2	
5-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
5-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
5-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

[0091]

[表16]

第 6 表

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
6-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
6-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
6-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
6-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
6-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
6-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
6-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
6-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
6-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
6-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
6-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
6-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
6-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
6-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
6-15	c-Pr	CF ₃	N	2	
6-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
6-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
6-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

[0094]

[表17]

第6表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
6-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
6-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
6-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
6-22	SMe	CF ₃	CH	0	
6-23	SMe	CF ₃	CH	1	
6-24	SMe	CF ₃	CH	2	
6-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
6-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
6-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
6-28	SMe	SCF ₃	N	0	
6-29	SMe	SCF ₃	N	1	
6-30	SMe	SCF ₃	N	2	
6-31	SMe	CF ₃	N	0	
6-32	SMe	CF ₃	N	1	
6-33	SMe	CF ₃	N	2	
6-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
6-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
6-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

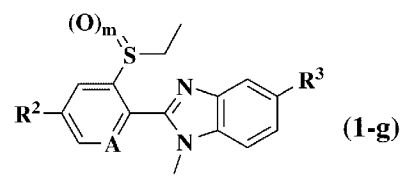
[0095]

[表18]

第 6 表 続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
6-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
6-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
6-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
6-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
6-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
6-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
6-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
6-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
6-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
6-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
6-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
6-48	c-Pen	CF ₃	N	2	

[0096] [化15]



[0097]

[表19]

第7表

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
7-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
7-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
7-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
7-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
7-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
7-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
7-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
7-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
7-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
7-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	
7-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
7-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	
7-13	c-Pr	CF ₃	N	0	NMR
7-14	c-Pr	CF ₃	N	1	192-193
7-15	c-Pr	CF ₃	N	2	88-90
7-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
7-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
7-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

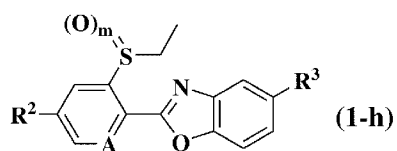
[0098]

[表20]

第 7 表 続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
7-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
7-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
7-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
7-22	SMe	CF ₃	CH	0	
7-23	SMe	CF ₃	CH	1	
7-24	SMe	CF ₃	CH	2	
7-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
7-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
7-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
7-28	SMe	SCF ₃	N	0	
7-29	SMe	SCF ₃	N	1	
7-30	SMe	SCF ₃	N	2	
7-31	SMe	CF ₃	N	0	
7-32	SMe	CF ₃	N	1	
7-33	SMe	CF ₃	N	2	
7-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
7-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
7-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

[0099] [化16]



[0100]

[表21]

第8表

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
8-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
8-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
8-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
8-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
8-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
8-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
8-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
8-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
8-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
8-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	128.6-133.6
8-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
8-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	118.4-121.4
8-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
8-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
8-15	c-Pr	CF ₃	N	2	NMR
8-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	135.7-137.0
8-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
8-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	131.4-132.6

[0101]

[表22]

第8表続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
8-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
8-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
8-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
8-22	SMe	CF ₃	CH	0	
8-23	SMe	CF ₃	CH	1	
8-24	SMe	CF ₃	CH	2	
8-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
8-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
8-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
8-28	SMe	SCF ₃	N	0	
8-29	SMe	SCF ₃	N	1	
8-30	SMe	SCF ₃	N	2	
8-31	SMe	CF ₃	N	0	
8-32	SMe	CF ₃	N	1	
8-33	SMe	CF ₃	N	2	
8-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
8-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
8-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

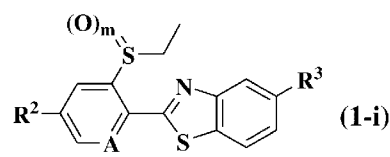
[0102]

[表23]

第 8 表 続き

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
8-37	c-Bu	SCF ₃	N	0	
8-38	c-Bu	SCF ₃	N	1	
8-39	c-Bu	SCF ₃	N	2	
8-40	c-Bu	CF ₃	N	0	
8-41	c-Bu	CF ₃	N	1	
8-42	c-Bu	CF ₃	N	2	
8-43	c-Pen	SCF ₃	N	0	
8-44	c-Pen	SCF ₃	N	1	
8-45	c-Pen	SCF ₃	N	2	
8-46	c-Pen	CF ₃	N	0	
8-47	c-Pen	CF ₃	N	1	
8-48	c-Pen	CF ₃	N	2	

[0103] [化17]



[0104]

[表24]

第 9 表

化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
9-1	c-Pr	SCF ₃	CH	0	
9-2	c-Pr	SCF ₃	CH	1	
9-3	c-Pr	SCF ₃	CH	2	
9-4	c-Pr	CF ₃	CH	0	
9-5	c-Pr	CF ₃	CH	1	
9-6	c-Pr	CF ₃	CH	2	
9-7	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	0	
9-8	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	1	
9-9	c-Pr	CF ₂ CF ₃	CH	2	
9-10	c-Pr	SCF ₃	N	0	148-149
9-11	c-Pr	SCF ₃	N	1	
9-12	c-Pr	SCF ₃	N	2	198-199
9-13	c-Pr	CF ₃	N	0	
9-14	c-Pr	CF ₃	N	1	
9-15	c-Pr	CF ₃	N	2	
9-16	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	0	
9-17	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	1	
9-18	c-Pr	CF ₂ CF ₃	N	2	

[0105]

[表25]

第 9 表続き

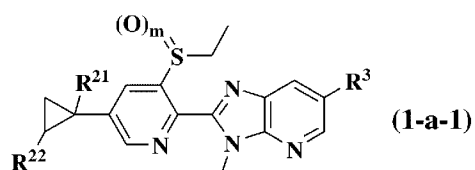
化合物番号	R ²	R ³	A	m	物性値
9-19	SMe	SCF ₃	CH	0	
9-20	SMe	SCF ₃	CH	1	
9-21	SMe	SCF ₃	CH	2	
9-22	SMe	CF ₃	CH	0	
9-23	SMe	CF ₃	CH	1	
9-24	SMe	CF ₃	CH	2	
9-25	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	0	
9-26	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	1	
9-27	SMe	CF ₂ CF ₃	CH	2	
9-28	SMe	SCF ₃	N	0	
9-29	SMe	SCF ₃	N	1	
9-30	SMe	SCF ₃	N	2	
9-31	SMe	CF ₃	N	0	
9-32	SMe	CF ₃	N	1	
9-33	SMe	CF ₃	N	2	
9-34	SMe	CF ₂ CF ₃	N	0	
9-35	SMe	CF ₂ CF ₃	N	1	
9-36	SMe	CF ₂ CF ₃	N	2	

[0106]

[表26]

化合物番号	¹ H-NMR 測定値
1-15	8.74(d, 2H), 8.28(d, 1H), 8.07(d,1H), 3.85(s, 3H), 3.79(dd, 2H), 2.17-2.09(m, 1H), 1.34(t, 3H), 1.31-1.24(m, 2H), 0.98-0.94(m, 2H)
1-16	8.65(d, 1H), 8.35(d, 1H), 8.28(d,1H), 7.40(d, 1H), 4.02(s, 3H), 2.95(dd, 2H), 2.02-1.97(m, 1H), 1.31(t, 3H), 1.18-1.13(m, 2H), 0.92-0.85(m, 2H)
1-18	8.74(d, 1H), 8.69(d, 1H), 8.26(d,1H), 8.07(d, 1H), 3.85(s, 3H), 3.80(dd, 2H), 2.17-2.09(m, 1H), 1.35(t, 3H), 1.31-1.25(m, 2H), 0.99-0.94(m, 2H)
3-13	8.71-8.72 (d,1H), 8.42-8.43(d,1H), 8.34-8.35 (d,1H), 7.37-7.38 (d,1H), 3.04-3.06(q,2H), 1.98-2.05 (m,1H), 1.44-1.47 (t,3H), 1.18-1.21 (m,2H), 0.88-0.90 (m,2H)
7-13	8.26-8.27 (d,1H), 8.16 (s,1H), 7.59-7.60 (dd,1H), 7.48-7.50 (d,1H), 7.37-7.38 (d,1H), 3.90 (s,3H), 2.89-2.94 (q,2H), 1.95-2.02 (m,1H), 1.29-1.33 (d,3H), 1.11-1.17 (m,2H), 0.82-0.86 (m,2H)
8-15	8.76(d, 1H), 8.12 (m, 2H), 7.78-7.73 (m, 2H), 4.01 (q, 2H), 2.16-2.09 (m, 1H), 1.42 (t, 3H), 1.31-1.25 (m, 2H), 0.99-0.96 (m, 2H)
11-1	8.87 (brs, 1H), 8.76 (brs, 1H), 8.47 (brs, 1H), 8.35 (brs, 1H), 3.83-3.71 (brm, 5H), 1.77 (brs, 2H), 1.27-1.11 (brm, 5H),

[0107] [化18]



[0108]

[表27]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
11-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	NMR
11-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	166-167
11-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	131-133
11-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	215-218
11-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
11-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
11-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
11-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	192-194
11-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
11-13	CN	H	CF ₃	2	176-177
11-14	CHO	H	CF ₃	2	80-82
11-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
11-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	92-94
11-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
11-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
11-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
11-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
11-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
11-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
11-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
11-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
11-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	82-83
11-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
11-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
11-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
11-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
11-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
11-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
11-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
11-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
11-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
11-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

[0109] [表28]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
11-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
11-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
11-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
11-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
11-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
11-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
11-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
11-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
11-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
11-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	194-195
11-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
11-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
11-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	82-83
11-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
11-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
11-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
11-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-60	NH ₂	H	CF ₃	2	83-86
11-61	NHMe	H	CF ₃	2	
11-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
11-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
11-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-68	NHAc	H	CF ₃	2	240-241
11-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
11-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
11-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	101-102
11-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
11-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
11-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
11-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
11-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
11-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
11-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	158-159

[0110] [表29]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
11-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	190-192
11-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	164-165
11-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
11-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	160-164
11-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
11-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
11-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
11-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
11-93	H	CN	CF ₃	2	70-72
11-94	H	CHO	CF ₃	2	50-52
11-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
11-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	77-80
11-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
11-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
11-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
11-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
11-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
11-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
11-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
11-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
11-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
11-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
11-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
11-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
11-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
11-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
11-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
11-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
11-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
11-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
11-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

[0111] [表30]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
11-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
11-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
11-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
11-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
11-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
11-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
11-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
11-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
11-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
11-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
11-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	50-51
11-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
11-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
11-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
11-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
11-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-140	H	NH ₂	CF ₃	2	54-55
11-141	H	NHMe	CF ₃	2	68-70
11-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
11-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
11-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-148	H	NHAc	CF ₃	2	72-74
11-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
11-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
11-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
11-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
11-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
11-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
11-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
11-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
11-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
11-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

[0112] [表31]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
11-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
11-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
11-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
11-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
11-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
11-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-173	CN	H	SCF ₃	2	
11-174	CHO	H	SCF ₃	2	
11-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
11-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
11-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
11-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
11-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
11-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
11-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
11-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
11-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
11-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
11-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
11-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
11-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

[0113] [表32]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
11-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
11-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
11-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
11-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
11-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
11-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
11-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
11-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
11-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
11-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
11-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
11-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
11-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
11-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
11-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
11-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
11-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
11-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
11-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
11-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
11-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
11-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
11-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
11-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
11-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
11-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

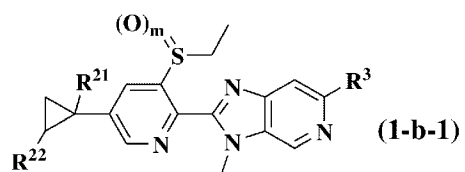
[0114] [表33]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
11-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
11-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
11-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
11-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
11-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
11-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
11-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
11-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
11-253	H	CN	SCF ₃	2	
11-254	H	CHO	SCF ₃	2	
11-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
11-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
11-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
11-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
11-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
11-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
11-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
11-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
11-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
11-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
11-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
11-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
11-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
11-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
11-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
11-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
11-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
11-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
11-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
11-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
11-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

[0115] [表34]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
11-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
11-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
11-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
11-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
11-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
11-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
11-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
11-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
11-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
11-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
11-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
11-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
11-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
11-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
11-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
11-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
11-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
11-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
11-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
11-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
11-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
11-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
11-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
11-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
11-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
11-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
11-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
11-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
11-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
11-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

[0116] [化19]



[0117]

[表35]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
12-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	217-221
12-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	172-174
12-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
12-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	207-211
12-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
12-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
12-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
12-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
12-13	CN	H	CF ₃	2	196-200
12-14	CHO	H	CF ₃	2	
12-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
12-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
12-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
12-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
12-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
12-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
12-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
12-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
12-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
12-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
12-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
12-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
12-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
12-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
12-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
12-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
12-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
12-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
12-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
12-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
12-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

[0118] [表36]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
12-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
12-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
12-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
12-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
12-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
12-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
12-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
12-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
12-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
12-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
12-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
12-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
12-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
12-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
12-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
12-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
12-61	NHMe	H	CF ₃	2	
12-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
12-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
12-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-68	NHAc	H	CF ₃	2	
12-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
12-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
12-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
12-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
12-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
12-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
12-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
12-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
12-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
12-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

[0119] [表37]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
12-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
12-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
12-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
12-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
12-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
12-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
12-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
12-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
12-93	H	CN	CF ₃	2	
12-94	H	CHO	CF ₃	2	
12-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
12-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
12-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
12-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
12-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
12-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
12-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
12-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
12-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
12-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
12-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
12-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
12-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
12-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
12-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
12-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
12-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
12-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
12-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
12-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
12-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

[0120] [表38]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
12-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
12-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
12-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
12-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
12-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
12-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
12-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
12-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
12-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
12-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
12-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
12-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
12-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
12-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
12-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
12-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
12-141	H	NHMe	CF ₃	2	
12-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
12-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
12-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-148	H	NHAc	CF ₃	2	
12-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
12-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
12-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
12-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
12-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
12-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
12-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
12-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
12-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
12-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

[0121] [表39]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
12-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
12-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
12-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
12-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
12-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
12-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-173	CN	H	SCF ₃	2	
12-174	CHO	H	SCF ₃	2	
12-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
12-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
12-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
12-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
12-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
12-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
12-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
12-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
12-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
12-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
12-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
12-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
12-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

[0122] [表40]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
12-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
12-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
12-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
12-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
12-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
12-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
12-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
12-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
12-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
12-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
12-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
12-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
12-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
12-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
12-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
12-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
12-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
12-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
12-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
12-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
12-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
12-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
12-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
12-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
12-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
12-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

[0123] [表41]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
12-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
12-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
12-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
12-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
12-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
12-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
12-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
12-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
12-253	H	CN	SCF ₃	2	
12-254	H	CHO	SCF ₃	2	
12-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
12-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
12-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
12-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
12-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
12-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
12-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
12-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
12-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
12-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
12-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
12-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
12-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
12-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
12-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
12-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
12-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
12-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
12-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
12-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
12-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

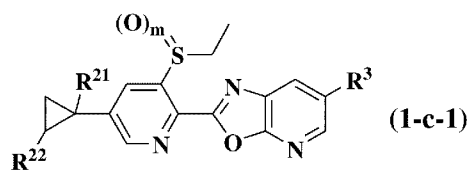
[0124] [表42]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
12-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
12-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
12-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
12-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
12-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
12-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
12-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
12-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
12-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
12-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
12-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
12-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
12-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
12-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
12-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
12-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
12-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
12-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
12-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
12-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
12-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
12-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
12-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
12-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
12-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
12-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
12-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
12-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

[0125] [表43]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
12-321	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
12-322	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
12-323	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
12-324	H	NHCONHMe	SCF ₃	2	
12-325	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
12-326	H	N(CONHMe)Me	SCF ₃	2	
12-327	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	

[0126] [化20]



[0127]

[表44]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
13-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
13-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
13-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
13-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
13-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
13-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
13-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
13-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
13-13	CN	H	CF ₃	2	
13-14	CHO	H	CF ₃	2	
13-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
13-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
13-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
13-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
13-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
13-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
13-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
13-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
13-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
13-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
13-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
13-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
13-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
13-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
13-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
13-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
13-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
13-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
13-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
13-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
13-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

[0128] [表45]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
13-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
13-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
13-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
13-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
13-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
13-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
13-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
13-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
13-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
13-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
13-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
13-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
13-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
13-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
13-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
13-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
13-61	NHMe	H	CF ₃	2	
13-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
13-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
13-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-68	NHAc	H	CF ₃	2	
13-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
13-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
13-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
13-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
13-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
13-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
13-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
13-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
13-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
13-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

[0129] [表46]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
13-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
13-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
13-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
13-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
13-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
13-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
13-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
13-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
13-93	H	CN	CF ₃	2	
13-94	H	CHO	CF ₃	2	
13-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
13-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
13-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
13-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
13-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
13-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
13-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
13-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
13-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
13-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
13-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
13-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
13-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
13-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
13-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
13-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
13-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
13-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
13-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
13-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
13-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

[0130] [表47]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
13-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
13-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
13-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
13-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
13-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
13-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
13-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
13-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
13-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
13-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
13-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
13-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
13-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
13-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
13-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
13-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
13-141	H	NHMe	CF ₃	2	
13-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
13-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
13-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-148	H	NHAc	CF ₃	2	
13-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
13-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
13-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
13-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
13-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
13-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
13-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
13-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
13-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
13-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

[0131] [表48]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
13-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
13-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
13-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
13-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
13-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
13-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-173	CN	H	SCF ₃	2	
13-174	CHO	H	SCF ₃	2	
13-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
13-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
13-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
13-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
13-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
13-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
13-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
13-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
13-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
13-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
13-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
13-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
13-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

[0132] [表49]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
13-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
13-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
13-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
13-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
13-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
13-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
13-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
13-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
13-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
13-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
13-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
13-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
13-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
13-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
13-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
13-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
13-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
13-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
13-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
13-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
13-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
13-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
13-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
13-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
13-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
13-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

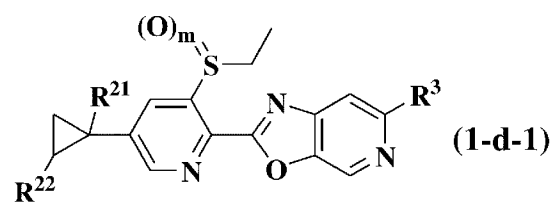
[0133] [表50]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
13-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
13-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
13-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
13-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
13-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
13-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
13-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
13-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
13-253	H	CN	SCF ₃	2	
13-254	H	CHO	SCF ₃	2	
13-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
13-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
13-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
13-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
13-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
13-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
13-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
13-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
13-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
13-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
13-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
13-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
13-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
13-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
13-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
13-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
13-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
13-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
13-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
13-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
13-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

[0134] [表51]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
13-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
13-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
13-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
13-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
13-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
13-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
13-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
13-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
13-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
13-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
13-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
13-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
13-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
13-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
13-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
13-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
13-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
13-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
13-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
13-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
13-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
13-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
13-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
13-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
13-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
13-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
13-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
13-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
13-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
13-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

[0135] [化21]



[0136]

[表52]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
14-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
14-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
14-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
14-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
14-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
14-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
14-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
14-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
14-13	CN	H	CF ₃	2	
14-14	CHO	H	CF ₃	2	
14-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
14-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
14-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
14-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
14-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
14-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
14-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
14-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
14-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
14-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
14-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
14-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
14-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
14-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
14-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
14-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
14-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
14-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
14-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
14-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
14-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

[0137] [表53]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
14-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
14-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
14-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
14-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
14-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
14-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
14-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
14-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
14-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
14-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
14-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
14-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
14-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
14-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
14-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
14-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
14-61	NHMe	H	CF ₃	2	
14-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
14-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
14-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-68	NHAc	H	CF ₃	2	
14-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
14-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
14-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
14-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
14-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
14-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
14-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
14-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
14-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
14-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

[0138] [表54]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
14-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
14-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
14-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
14-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
14-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
14-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
14-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
14-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
14-93	H	CN	CF ₃	2	
14-94	H	CHO	CF ₃	2	
14-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
14-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
14-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
14-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
14-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
14-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
14-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
14-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
14-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
14-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
14-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
14-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
14-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
14-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
14-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
14-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
14-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
14-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
14-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
14-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
14-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

[0139] [表55]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
14-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
14-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
14-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
14-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
14-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
14-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
14-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
14-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
14-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
14-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
14-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
14-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
14-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
14-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
14-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
14-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
14-141	H	NHMe	CF ₃	2	
14-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
14-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
14-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-148	H	NHAc	CF ₃	2	
14-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
14-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
14-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
14-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
14-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
14-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
14-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
14-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
14-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
14-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

[0140] [表56]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
14-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
14-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
14-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
14-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
14-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
14-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-173	CN	H	SCF ₃	2	
14-174	CHO	H	SCF ₃	2	
14-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
14-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
14-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
14-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
14-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
14-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
14-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
14-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
14-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
14-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
14-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
14-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
14-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

[0141] [表57]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
14-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
14-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
14-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
14-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
14-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
14-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
14-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
14-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
14-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
14-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
14-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
14-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
14-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
14-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
14-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
14-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
14-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
14-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
14-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
14-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
14-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
14-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
14-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
14-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
14-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
14-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

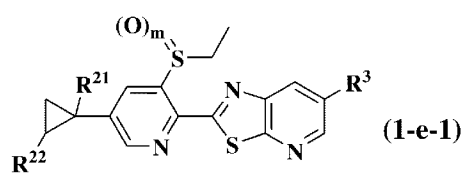
[0142] [表58]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
14-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
14-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
14-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
14-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
14-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
14-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
14-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
14-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
14-253	H	CN	SCF ₃	2	
14-254	H	CHO	SCF ₃	2	
14-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
14-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
14-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
14-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
14-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
14-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
14-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
14-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
14-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
14-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
14-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
14-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
14-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
14-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
14-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
14-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
14-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
14-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
14-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
14-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
14-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

[0143] [表59]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
14-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
14-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
14-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
14-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
14-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
14-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
14-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
14-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
14-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
14-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
14-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
14-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
14-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
14-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
14-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
14-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
14-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
14-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
14-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
14-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
14-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
14-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
14-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
14-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
14-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
14-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
14-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
14-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
14-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
14-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

[0144] [化22]



[0145]

[表60]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
15-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
15-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
15-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
15-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
15-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
15-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
15-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
15-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
15-13	CN	H	CF ₃	2	
15-14	CHO	H	CF ₃	2	
15-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
15-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
15-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
15-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
15-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
15-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
15-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
15-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
15-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
15-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
15-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
15-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
15-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
15-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
15-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
15-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
15-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
15-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
15-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
15-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
15-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

[0146] [表61]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
15-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
15-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
15-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
15-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
15-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
15-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
15-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
15-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
15-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
15-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
15-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
15-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
15-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
15-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
15-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
15-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
15-61	NHMe	H	CF ₃	2	
15-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
15-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
15-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-68	NHAc	H	CF ₃	2	
15-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
15-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
15-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
15-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
15-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
15-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
15-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
15-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
15-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
15-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

[0147] [表62]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
15-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
15-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
15-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
15-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
15-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
15-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
15-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
15-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
15-93	H	CN	CF ₃	2	
15-94	H	CHO	CF ₃	2	
15-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
15-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
15-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
15-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
15-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
15-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
15-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
15-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
15-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
15-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
15-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
15-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
15-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
15-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
15-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
15-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
15-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
15-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
15-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
15-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
15-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

[0148] [表63]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
15-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
15-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
15-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
15-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
15-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
15-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
15-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
15-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
15-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
15-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
15-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
15-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
15-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
15-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
15-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
15-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
15-141	H	NHMe	CF ₃	2	
15-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
15-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
15-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-148	H	NHAc	CF ₃	2	
15-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
15-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
15-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
15-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
15-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
15-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
15-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
15-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
15-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
15-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

[0149] [表64]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
15-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
15-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
15-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
15-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
15-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
15-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-173	CN	H	SCF ₃	2	
15-174	CHO	H	SCF ₃	2	
15-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
15-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
15-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
15-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
15-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
15-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
15-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
15-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
15-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
15-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
15-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
15-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
15-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

[0150] [表65]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
15-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
15-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
15-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
15-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
15-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
15-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
15-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
15-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
15-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
15-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
15-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
15-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
15-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
15-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
15-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
15-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
15-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
15-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
15-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
15-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
15-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
15-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
15-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
15-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
15-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
15-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

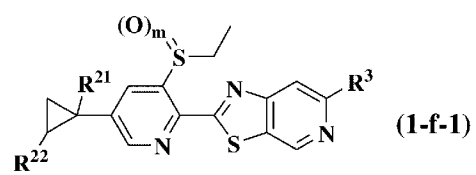
[0151] [表66]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
15-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
15-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
15-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
15-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
15-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
15-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
15-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
15-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
15-253	H	CN	SCF ₃	2	
15-254	H	CHO	SCF ₃	2	
15-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
15-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
15-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
15-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
15-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
15-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
15-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
15-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
15-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
15-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
15-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
15-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
15-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
15-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
15-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
15-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
15-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
15-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
15-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
15-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
15-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

[0152] [表67]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
15-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
15-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
15-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
15-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
15-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
15-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
15-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
15-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
15-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
15-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
15-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
15-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
15-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
15-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
15-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
15-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
15-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
15-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
15-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
15-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
15-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
15-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
15-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
15-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
15-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
15-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
15-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
15-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
15-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
15-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

[0153] [化23]



[0154]

[表68]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
16-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
16-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
16-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
16-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
16-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
16-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
16-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
16-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
16-13	CN	H	CF ₃	2	
16-14	CHO	H	CF ₃	2	
16-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
16-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
16-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
16-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
16-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
16-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
16-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
16-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
16-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
16-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
16-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
16-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
16-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
16-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
16-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
16-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
16-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
16-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
16-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
16-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
16-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

[0155] [表69]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
16-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
16-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
16-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
16-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
16-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
16-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
16-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
16-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
16-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
16-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
16-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
16-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
16-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
16-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
16-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
16-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
16-61	NHMe	H	CF ₃	2	
16-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
16-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
16-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-68	NHAc	H	CF ₃	2	
16-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
16-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
16-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
16-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
16-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
16-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
16-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
16-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
16-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
16-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

[0156] [表70]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
16-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
16-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
16-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
16-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
16-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
16-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
16-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
16-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
16-93	H	CN	CF ₃	2	
16-94	H	CHO	CF ₃	2	
16-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
16-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
16-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
16-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
16-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
16-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
16-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
16-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
16-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
16-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
16-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
16-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
16-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
16-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
16-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
16-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
16-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
16-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
16-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
16-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
16-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

[0157] [表71]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
16-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
16-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
16-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
16-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
16-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
16-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
16-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
16-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
16-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
16-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
16-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
16-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
16-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
16-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
16-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
16-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
16-141	H	NHMe	CF ₃	2	
16-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
16-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
16-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-148	H	NHAc	CF ₃	2	
16-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
16-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
16-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
16-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
16-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
16-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
16-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
16-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
16-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
16-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

[0158] [表72]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
16-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
16-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
16-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
16-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
16-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
16-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-173	CN	H	SCF ₃	2	
16-174	CHO	H	SCF ₃	2	
16-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
16-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
16-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
16-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
16-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
16-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
16-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
16-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
16-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
16-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
16-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
16-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
16-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

[0159] [表73]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
16-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
16-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
16-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
16-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
16-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
16-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
16-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
16-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
16-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
16-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
16-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
16-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
16-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
16-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
16-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
16-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
16-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
16-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
16-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
16-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
16-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
16-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
16-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
16-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
16-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
16-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

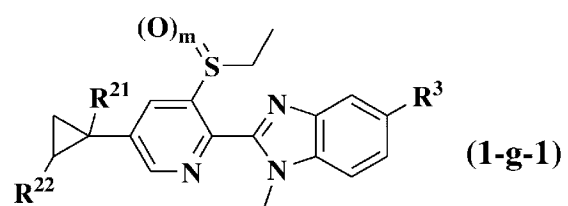
[0160] [表74]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
16-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
16-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
16-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
16-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
16-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
16-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
16-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
16-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
16-253	H	CN	SCF ₃	2	
16-254	H	CHO	SCF ₃	2	
16-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
16-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
16-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
16-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
16-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
16-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
16-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
16-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
16-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
16-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
16-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
16-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
16-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
16-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
16-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
16-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
16-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
16-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
16-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
16-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
16-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

[0161] [表75]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
16-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
16-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
16-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
16-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
16-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
16-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
16-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
16-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
16-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
16-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
16-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
16-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
16-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
16-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
16-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
16-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
16-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
16-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
16-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
16-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
16-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
16-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
16-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
16-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
16-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
16-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
16-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
16-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
16-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
16-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

[0162] [化24]



[0163]

[表76]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
17-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
17-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
17-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
17-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
17-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
17-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
17-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
17-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
17-13	CN	H	CF ₃	2	
17-14	CHO	H	CF ₃	2	
17-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
17-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
17-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
17-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
17-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
17-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
17-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
17-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
17-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
17-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
17-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
17-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
17-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
17-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
17-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
17-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
17-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
17-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
17-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
17-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
17-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

[0164] [表77]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
17-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
17-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
17-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
17-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
17-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
17-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
17-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
17-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
17-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
17-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
17-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
17-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
17-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
17-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
17-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
17-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
17-61	NHMe	H	CF ₃	2	
17-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
17-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
17-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-68	NHAc	H	CF ₃	2	
17-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
17-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
17-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
17-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
17-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
17-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
17-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
17-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
17-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
17-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

[0165] [表78]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
17-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
17-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
17-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
17-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
17-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
17-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
17-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
17-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
17-93	H	CN	CF ₃	2	
17-94	H	CHO	CF ₃	2	
17-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
17-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
17-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
17-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
17-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
17-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
17-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
17-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
17-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
17-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
17-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
17-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
17-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
17-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
17-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
17-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
17-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
17-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
17-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
17-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
17-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

[0166] [表79]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
17-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
17-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
17-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
17-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
17-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
17-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
17-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
17-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
17-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
17-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
17-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
17-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
17-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
17-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
17-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
17-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
17-141	H	NHMe	CF ₃	2	
17-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
17-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
17-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-148	H	NHAc	CF ₃	2	
17-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
17-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
17-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
17-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
17-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
17-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
17-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
17-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
17-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
17-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

[0167] [表80]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
17-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
17-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
17-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
17-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
17-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
17-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-173	CN	H	SCF ₃	2	
17-174	CHO	H	SCF ₃	2	
17-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
17-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
17-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
17-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
17-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
17-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
17-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
17-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
17-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
17-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
17-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
17-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
17-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

[0168] [表81]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
17-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
17-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
17-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
17-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
17-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
17-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
17-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
17-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
17-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
17-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
17-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
17-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
17-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
17-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
17-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
17-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
17-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
17-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
17-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
17-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
17-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
17-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
17-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
17-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
17-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
17-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

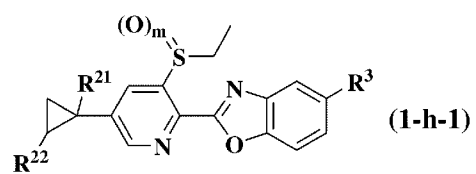
[0169] [表82]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
17-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
17-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
17-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
17-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
17-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
17-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
17-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
17-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
17-253	H	CN	SCF ₃	2	
17-254	H	CHO	SCF ₃	2	
17-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
17-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
17-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
17-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
17-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
17-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
17-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
17-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
17-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
17-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
17-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
17-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
17-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
17-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
17-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
17-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
17-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
17-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
17-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
17-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
17-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

[0170] [表83]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
17-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
17-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
17-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
17-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
17-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
17-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
17-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
17-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
17-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
17-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
17-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
17-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
17-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
17-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
17-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
17-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
17-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
17-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
17-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
17-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
17-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
17-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
17-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
17-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
17-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
17-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
17-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
17-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
17-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
17-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

[0171] [化25]



[0172]

[表84]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
18-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	208-211
18-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	175-176
18-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
18-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	150
18-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
18-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
18-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
18-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
18-13	CN	H	CF ₃	2	212-217
18-14	CHO	H	CF ₃	2	
18-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
18-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
18-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
18-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
18-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
18-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
18-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
18-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
18-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
18-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
18-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
18-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
18-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
18-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
18-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
18-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
18-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
18-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
18-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
18-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
18-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

[0173] [表85]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
18-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
18-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
18-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
18-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
18-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
18-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
18-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
18-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
18-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
18-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
18-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
18-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
18-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
18-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
18-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
18-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
18-61	NHMe	H	CF ₃	2	
18-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
18-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
18-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-68	NHAc	H	CF ₃	2	
18-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
18-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
18-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
18-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
18-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
18-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
18-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
18-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
18-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
18-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

[0174] [表86]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
18-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
18-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
18-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
18-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
18-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
18-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
18-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
18-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
18-93	H	CN	CF ₃	2	
18-94	H	CHO	CF ₃	2	
18-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
18-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
18-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
18-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
18-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
18-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
18-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
18-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
18-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
18-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
18-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
18-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
18-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
18-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
18-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
18-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
18-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
18-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
18-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
18-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
18-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

[0175] [表87]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
18-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
18-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
18-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
18-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
18-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
18-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
18-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
18-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
18-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
18-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
18-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
18-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
18-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
18-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
18-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
18-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
18-141	H	NHMe	CF ₃	2	
18-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
18-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
18-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-148	H	NHAc	CF ₃	2	
18-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
18-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
18-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
18-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
18-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
18-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
18-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
18-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
18-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
18-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

[0176] [表88]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
18-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	173-176
18-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	113-115
18-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	214-216
18-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
18-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
18-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-173	CN	H	SCF ₃	2	188-189
18-174	CHO	H	SCF ₃	2	135-136
18-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
18-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	126-127
18-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
18-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
18-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
18-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
18-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	151-152
18-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
18-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
18-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
18-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
18-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
18-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

[0177] [表89]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
18-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
18-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
18-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
18-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
18-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
18-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
18-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
18-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
18-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
18-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	157-159
18-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	155-157
18-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	125-127
18-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
18-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
18-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	153-155
18-221	NHMe	H	SCF ₃	2	90-91
18-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
18-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-228	NHAc	H	SCF ₃	2	206-207
18-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
18-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	76-79
18-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	129-131
18-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
18-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
18-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
18-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
18-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
18-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

[0178]

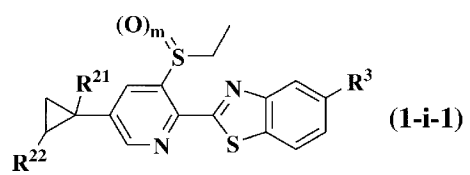
[表90]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
18-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
18-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
18-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
18-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
18-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
18-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
18-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
18-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
18-253	H	CN	SCF ₃	2	
18-254	H	CHO	SCF ₃	2	
18-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
18-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
18-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
18-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
18-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
18-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
18-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
18-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
18-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
18-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
18-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
18-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
18-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
18-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
18-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
18-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
18-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
18-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
18-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
18-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
18-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

[0179] [表91]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
18-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
18-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
18-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
18-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
18-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
18-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
18-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
18-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
18-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
18-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
18-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
18-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
18-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
18-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
18-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
18-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
18-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
18-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
18-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
18-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
18-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
18-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
18-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
18-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
18-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
18-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
18-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
18-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
18-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
18-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

[0180] [化26]



[0181]

[表92]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
19-1	CO ₂ H	H	CF ₃	2	
19-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
19-3	CO ₂ i-Pr	H	CF ₃	2	
19-4	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-5	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-6	CONH ₂	H	CF ₃	2	
19-7	CONHMe	H	CF ₃	2	
19-8	CONHi-Pr	H	CF ₃	2	
19-9	CONHc-Pr	H	CF ₃	2	
19-10	CONHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-11	CONHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-12	CONMe ₂	H	CF ₃	2	
19-13	CN	H	CF ₃	2	
19-14	CHO	H	CF ₃	2	
19-15	C(=O)Me	H	CF ₃	2	
19-16	CH ₂ OH	H	CF ₃	2	
19-17	CH ₂ OMe	H	CF ₃	2	
19-18	CH ₂ Oi-Pr	H	CF ₃	2	
19-19	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-20	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-21	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	2	
19-22	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	CF ₃	2	
19-23	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	CF ₃	2	
19-24	CH ₂ OC(=O)OMe	H	CF ₃	2	
19-25	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	CF ₃	2	
19-26	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	CF ₃	2	
19-27	CH ₂ CN	H	CF ₃	2	
19-28	CH ₂ NH ₂	H	CF ₃	2	
19-29	CH ₂ NHMe	H	CF ₃	2	
19-30	CH ₂ NHi-Pr	H	CF ₃	2	
19-31	CH ₂ NHc-Pr	H	CF ₃	2	
19-32	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-33	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-34	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	2	
19-35	CH ₂ NHAc	H	CF ₃	2	
19-36	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
19-37	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
19-38	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	CF ₃	2	
19-39	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-40	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	

[表93]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
19-41	CH ₂ NHCOOMe	H	CF ₃	2	
19-42	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	CF ₃	2	
19-43	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	CF ₃	2	
19-44	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	CF ₃	2	
19-45	CH ₂ NHCONHMe	H	CF ₃	2	
19-46	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	CF ₃	2	
19-47	CH ₂ SMe	H	CF ₃	2	
19-48	CH ₂ SOMe	H	CF ₃	2	
19-49	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃	2	
19-50	CH=NOH	H	CF ₃	2	
19-51	CH=NOMe	H	CF ₃	2	
19-52	CH=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
19-53	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-54	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-55	C(Me)=NOH	H	CF ₃	2	
19-56	C(Me)=NOMe	H	CF ₃	2	
19-57	C(Me)=NOi-Pr	H	CF ₃	2	
19-58	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-59	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-60	NH ₂	H	CF ₃	2	
19-61	NHMe	H	CF ₃	2	
19-62	NHi-Pr	H	CF ₃	2	
19-63	NHCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-64	NHCH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-65	NMe ₂	H	CF ₃	2	
19-66	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-67	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-68	NHAc	H	CF ₃	2	
19-69	N(Ac)Me	H	CF ₃	2	
19-70	N(Ac)i-Pr	H	CF ₃	2	
19-71	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-72	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-73	NHCOOMe	H	CF ₃	2	
19-74	N(COOMe)Me	H	CF ₃	2	
19-75	N(COOMe)i-Pr	H	CF ₃	2	
19-76	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	2	
19-77	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	CF ₃	2	
19-78	NHCONMe ₂	H	CF ₃	2	
19-79	N(CONMe ₂)Me	H	CF ₃	2	
19-80	CH ₂ Cl	H	CF ₃	2	

[0183] [表94]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
19-81	H	CO ₂ H	CF ₃	2	
19-82	H	CO ₂ Me	CF ₃	2	
19-83	H	CO ₂ i-Pr	CF ₃	2	
19-84	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-85	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-86	H	CONH ₂	CF ₃	2	
19-87	H	CONHMe	CF ₃	2	
19-88	H	CONHi-Pr	CF ₃	2	
19-89	H	CONHc-Pr	CF ₃	2	
19-90	H	CONHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-91	H	CONHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-92	H	CONMe ₂	CF ₃	2	
19-93	H	CN	CF ₃	2	
19-94	H	CHO	CF ₃	2	
19-95	H	C(=O)Me	CF ₃	2	
19-96	H	CH ₂ OH	CF ₃	2	
19-97	H	CH ₂ OMe	CF ₃	2	
19-98	H	CH ₂ Oi-Pr	CF ₃	2	
19-99	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-100	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-101	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	2	
19-102	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	CF ₃	2	
19-103	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	CF ₃	2	
19-104	H	CH ₂ OC(=O)OMe	CF ₃	2	
19-105	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	CF ₃	2	
19-106	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	CF ₃	2	
19-107	H	CH ₂ CN	CF ₃	2	
19-108	H	CH ₂ NH ₂	CF ₃	2	
19-109	H	CH ₂ NHMe	CF ₃	2	
19-110	H	CH ₂ NHi-Pr	CF ₃	2	
19-111	H	CH ₂ NHc-Pr	CF ₃	2	
19-112	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-113	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-114	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	2	
19-115	H	CH ₂ NHAc	CF ₃	2	
19-116	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	2	
19-117	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
19-118	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	CF ₃	2	
19-119	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-120	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	

[0184] [表95]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
19-121	H	CH ₂ NHCOOMe	CF ₃	2	
19-122	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	CF ₃	2	
19-123	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	CF ₃	2	
19-124	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	CF ₃	2	
19-125	H	CH ₂ NHCONHMe	CF ₃	2	
19-126	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	CF ₃	2	
19-127	H	CH ₂ SMe	CF ₃	2	
19-128	H	CH ₂ SOMe	CF ₃	2	
19-129	H	CH ₂ SO ₂ Me	CF ₃	2	
19-130	H	CH=NOH	CF ₃	2	
19-131	H	CH=NOMe	CF ₃	2	
19-132	H	CH=NOi-Pr	CF ₃	2	
19-133	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-134	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-135	H	C(Me)=NOH	CF ₃	2	
19-136	H	C(Me)=NOMe	CF ₃	2	
19-137	H	C(Me)=NOi-Pr	CF ₃	2	
19-138	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-139	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-140	H	NH ₂	CF ₃	2	
19-141	H	NHMe	CF ₃	2	
19-142	H	NHi-Pr	CF ₃	2	
19-143	H	NHCH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-144	H	NHCH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-145	H	NMe ₂	CF ₃	2	
19-146	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-147	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-148	H	NHAc	CF ₃	2	
19-149	H	N(Ac)Me	CF ₃	2	
19-150	H	N(Ac)i-Pr	CF ₃	2	
19-151	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-152	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-153	H	NHCOOMe	CF ₃	2	
19-154	H	N(COOMe)Me	CF ₃	2	
19-155	H	N(COOMe)i-Pr	CF ₃	2	
19-156	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	CF ₃	2	
19-157	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	CF ₃	2	
19-158	H	NHCONMe ₂	CF ₃	2	
19-159	H	N(CONMe ₂)Me	CF ₃	2	
19-160	H	CH ₂ Cl	CF ₃	2	

[0185] [表96]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
19-161	CO ₂ H	H	SCF ₃	2	
19-162	CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
19-163	CO ₂ i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-164	CO ₂ CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-165	CO ₂ CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-166	CONH ₂	H	SCF ₃	2	
19-167	CONHMe	H	SCF ₃	2	
19-168	CONHi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-169	CONHc-Pr	H	SCF ₃	2	
19-170	CONHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-171	CONHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-172	CONMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-173	CN	H	SCF ₃	2	
19-174	CHO	H	SCF ₃	2	
19-175	C(=O)Me	H	SCF ₃	2	
19-176	CH ₂ OH	H	SCF ₃	2	
19-177	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	2	
19-178	CH ₂ Oi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-179	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-180	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-181	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	2	
19-182	CH ₂ OC(=O)i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-183	CH ₂ OC(=O)c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-184	CH ₂ OC(=O)OMe	H	SCF ₃	2	
19-185	CH ₂ OC(=O)NHMe	H	SCF ₃	2	
19-186	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-187	CH ₂ CN	H	SCF ₃	2	
19-188	CH ₂ NH ₂	H	SCF ₃	2	
19-189	CH ₂ NHMe	H	SCF ₃	2	
19-190	CH ₂ NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-191	CH ₂ NHc-Pr	H	SCF ₃	2	
19-192	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-193	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-194	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-195	CH ₂ NHAc	H	SCF ₃	2	
19-196	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
19-197	CH ₂ N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-198	CH ₂ N(Ac)c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-199	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-200	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	

[0186] [表97]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
19-201	CH ₂ NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
19-202	CH ₂ NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	2	
19-203	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
19-204	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	H	SCF ₃	2	
19-205	CH ₂ NHCONHMe	H	SCF ₃	2	
19-206	CH ₂ N(Me)CONHMe	H	SCF ₃	2	
19-207	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	2	
19-208	CH ₂ SOMe	H	SCF ₃	2	
19-209	CH ₂ SO ₂ Me	H	SCF ₃	2	
19-210	CH=NOH	H	SCF ₃	2	
19-211	CH=NOMe	H	SCF ₃	2	
19-212	CH=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-213	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-214	CH=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-215	C(Me)=NOH	H	SCF ₃	2	
19-216	C(Me)=NOMe	H	SCF ₃	2	
19-217	C(Me)=NOi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-218	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-219	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-220	NH ₂	H	SCF ₃	2	
19-221	NHMe	H	SCF ₃	2	
19-222	NHi-Pr	H	SCF ₃	2	
19-223	NHCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-224	NHCH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-225	NMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-226	N(Me)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-227	N(Me)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-228	NHAc	H	SCF ₃	2	
19-229	N(Ac)Me	H	SCF ₃	2	
19-230	N(Ac)i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-231	N(Ac)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-232	N(Ac)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-233	NHCOOMe	H	SCF ₃	2	
19-234	N(COOMe)Me	H	SCF ₃	2	
19-235	N(COOMe)i-Pr	H	SCF ₃	2	
19-236	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	2	
19-237	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	H	SCF ₃	2	
19-238	NHCONMe ₂	H	SCF ₃	2	
19-239	N(CONMe ₂)Me	H	SCF ₃	2	
19-240	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	2	

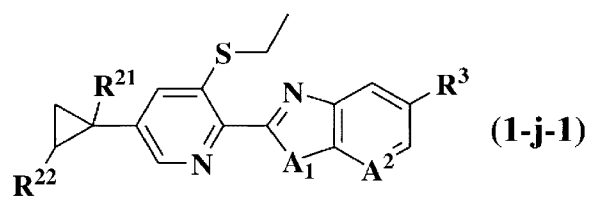
[0187] [表98]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
19-241	H	CO ₂ H	SCF ₃	2	
19-242	H	CO ₂ Me	SCF ₃	2	
19-243	H	CO ₂ i-Pr	SCF ₃	2	
19-244	H	CO ₂ CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-245	H	CO ₂ CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-246	H	CONH ₂	SCF ₃	2	
19-247	H	CONHMe	SCF ₃	2	
19-248	H	CONHi-Pr	SCF ₃	2	
19-249	H	CONHc-Pr	SCF ₃	2	
19-250	H	CONHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-251	H	CONHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-252	H	CONMe ₂	SCF ₃	2	
19-253	H	CN	SCF ₃	2	
19-254	H	CHO	SCF ₃	2	
19-255	H	C(=O)Me	SCF ₃	2	
19-256	H	CH ₂ OH	SCF ₃	2	
19-257	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	2	
19-258	H	CH ₂ Oi-Pr	SCF ₃	2	
19-259	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-260	H	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-261	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	2	
19-262	H	CH ₂ OC(=O)i-Pr	SCF ₃	2	
19-263	H	CH ₂ OC(=O)c-Pr	SCF ₃	2	
19-264	H	CH ₂ OC(=O)OMe	SCF ₃	2	
19-265	H	CH ₂ OC(=O)NHMe	SCF ₃	2	
19-266	H	CH ₂ OC(=O)NMe ₂	SCF ₃	2	
19-267	H	CH ₂ CN	SCF ₃	2	
19-268	H	CH ₂ NH ₂	SCF ₃	2	
19-269	H	CH ₂ NHMe	SCF ₃	2	
19-270	H	CH ₂ NHi-Pr	SCF ₃	2	
19-271	H	CH ₂ NHc-Pr	SCF ₃	2	
19-272	H	CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-273	H	CH ₂ NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-274	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	2	
19-275	H	CH ₂ NHAc	SCF ₃	2	
19-276	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	2	
19-277	H	CH ₂ N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
19-278	H	CH ₂ N(Ac)c-Pr	SCF ₃	2	
19-279	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-280	H	CH ₂ N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	

[0188] [表99]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	m	物性値
19-281	H	CH ₂ NHCOOMe	SCF ₃	2	
19-282	H	CH ₂ NHCOOt-Bu	SCF ₃	2	
19-283	H	CH ₂ N(Me)CO ₂ Me	SCF ₃	2	
19-284	H	CH ₂ N(Me)COOt-Bu	SCF ₃	2	
19-285	H	CH ₂ NHCONHMe	SCF ₃	2	
19-286	H	CH ₂ N(Me)CONHMe	SCF ₃	2	
19-287	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	2	
19-288	H	CH ₂ SOMe	SCF ₃	2	
19-289	H	CH ₂ SO ₂ Me	SCF ₃	2	
19-290	H	CH=NOH	SCF ₃	2	
19-291	H	CH=NOMe	SCF ₃	2	
19-292	H	CH=NOi-Pr	SCF ₃	2	
19-293	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-294	H	CH=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-295	H	C(Me)=NOH	SCF ₃	2	
19-296	H	C(Me)=NOMe	SCF ₃	2	
19-297	H	C(Me)=NOi-Pr	SCF ₃	2	
19-298	H	C(Me)=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-299	H	C(Me)=NOCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-300	H	NH ₂	SCF ₃	2	
19-301	H	NHMe	SCF ₃	2	
19-302	H	NHi-Pr	SCF ₃	2	
19-303	H	NHCH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-304	H	NHCH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-305	H	NMe ₂	SCF ₃	2	
19-306	H	N(Me)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-307	H	N(Me)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-308	H	NHAc	SCF ₃	2	
19-309	H	N(Ac)Me	SCF ₃	2	
19-310	H	N(Ac)i-Pr	SCF ₃	2	
19-311	H	N(Ac)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-312	H	N(Ac)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-313	H	NHCOOMe	SCF ₃	2	
19-314	H	N(COOMe)Me	SCF ₃	2	
19-315	H	N(COOMe)i-Pr	SCF ₃	2	
19-316	H	N(COOMe)CH ₂ CF ₃	SCF ₃	2	
19-317	H	N(COOMe)CH ₂ c-Pr	SCF ₃	2	
19-318	H	NHCONMe ₂	SCF ₃	2	
19-319	H	N(CONMe ₂)Me	SCF ₃	2	
19-320	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	2	

[0189] [化27]



[0190]

[表100]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	A ¹	A ²	物性値
20-1	CO ₂ H	H	CF ₃	NMe	N	
20-2	CO ₂ Me	H	CF ₃	NMe	N	122-124
20-3	CONH ₂	H	CF ₃	NMe	N	
20-4	CN	H	CF ₃	NMe	N	
20-5	CHO	H	CF ₃	NMe	N	
20-6	CH ₂ OH	H	CF ₃	NMe	N	
20-7	CH ₂ OMe	H	CF ₃	NMe	N	
20-8	CH ₂ OC(=O)Me	H	CF ₃	NMe	N	
20-9	CH ₂ CN	H	CF ₃	NMe	N	
20-10	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	NMe	N	
20-11	CH ₂ N(Ac)Me	H	CF ₃	NMe	N	
20-12	CH ₂ SMe	H	CF ₃	NMe	N	
20-13	CH=NOH	H	CF ₃	NMe	N	
20-14	CH=NOMe	H	CF ₃	NMe	N	
20-15	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	NMe	N	
20-16	NH ₂	H	CF ₃	NMe	N	
20-17	NHAc	H	CF ₃	NMe	N	
20-18	NHCOOMe	H	CF ₃	NMe	N	
20-19	NHCOOt-Bu	H	CF ₃	NMe	N	
20-20	CH ₂ Cl	H	CF ₃	NMe	N	
20-21	H	CO ₂ H	CF ₃	NMe	N	139-141
20-22	H	CO ₂ Me	CF ₃	NMe	N	118-120
20-23	H	CONH ₂	CF ₃	NMe	N	
20-24	H	CN	CF ₃	NMe	N	156-158
20-25	H	CHO	CF ₃	NMe	N	
20-26	H	CH ₂ OH	CF ₃	NMe	N	55-58
20-27	H	CH ₂ OMe	CF ₃	NMe	N	
20-28	H	CH ₂ OC(=O)Me	CF ₃	NMe	N	
20-29	H	CH ₂ CN	CF ₃	NMe	N	
20-30	H	CH ₂ NMe ₂	CF ₃	NMe	N	
20-31	H	CH ₂ N(Ac)Me	CF ₃	NMe	N	
20-32	H	CH ₂ SMe	CF ₃	NMe	N	
20-33	H	CH=NOH	CF ₃	NMe	N	
20-34	H	CH=NOMe	CF ₃	NMe	N	
20-35	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	CF ₃	NMe	N	
20-36	H	NH ₂	CF ₃	NMe	N	
20-37	H	NHAc	CF ₃	NMe	N	
20-38	H	NHCOOMe	CF ₃	NMe	N	
20-39	H	NHCOOt-Bu	CF ₃	NMe	N	101-103
20-40	H	CH ₂ Cl	CF ₃	NMe	N	

[0191] [表101]

化合物番号	R ²¹	R ²²	R ³	A ¹	A ²	物性値
20-41	CO ₂ H	H	SCF ₃	O	CH	221-225
20-42	CO ₂ Me	H	SCF ₃	O	CH	172-174
20-43	CONH ₂	H	SCF ₃	O	CH	
20-44	CN	H	SCF ₃	O	CH	202-204
20-45	CHO	H	SCF ₃	O	CH	109-110
20-46	CH ₂ OH	H	SCF ₃	O	CH	123-125
20-47	CH ₂ OMe	H	SCF ₃	O	CH	
20-48	CH ₂ OC(=O)Me	H	SCF ₃	O	CH	
20-49	CH ₂ CN	H	SCF ₃	O	CH	
20-50	CH ₂ NMe ₂	H	SCF ₃	O	CH	
20-51	CH ₂ N(Ac)Me	H	SCF ₃	O	CH	
20-52	CH ₂ SMe	H	SCF ₃	O	CH	
20-53	CH=NOH	H	SCF ₃	O	CH	105-108
20-54	CH=NOMe	H	SCF ₃	O	CH	
20-55	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	O	CH	
20-56	NH ₂	H	SCF ₃	O	CH	
20-57	NHAc	H	SCF ₃	O	CH	
20-58	NHCOOMe	H	SCF ₃	O	CH	
20-59	NHCOOt-Bu	H	SCF ₃	O	CH	
20-60	CH ₂ Cl	H	SCF ₃	O	CH	
20-61	H	CO ₂ H	SCF ₃	O	CH	
20-62	H	CO ₂ Me	SCF ₃	O	CH	
20-63	H	CONH ₂	SCF ₃	O	CH	
20-64	H	CN	SCF ₃	O	CH	
20-65	H	CHO	SCF ₃	O	CH	
20-66	H	CH ₂ OH	SCF ₃	O	CH	
20-67	H	CH ₂ OMe	SCF ₃	O	CH	
20-68	H	CH ₂ OC(=O)Me	SCF ₃	O	CH	
20-69	H	CH ₂ CN	SCF ₃	O	CH	
20-70	H	CH ₂ NMe ₂	SCF ₃	O	CH	
20-71	H	CH ₂ N(Ac)Me	SCF ₃	O	CH	
20-72	H	CH ₂ SMe	SCF ₃	O	CH	
20-73	H	CH=NOH	SCF ₃	O	CH	
20-74	H	CH=NOMe	SCF ₃	O	CH	
20-75	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	SCF ₃	O	CH	
20-76	H	NH ₂	SCF ₃	O	CH	
20-77	H	NHAc	SCF ₃	O	CH	
20-78	H	NHCOOMe	SCF ₃	O	CH	
20-79	H	NHCOOt-Bu	SCF ₃	O	CH	
20-80	H	CH ₂ Cl	SCF ₃	O	CH	

[0192] 本発明の一般式（１）で表される縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉類を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫類等の害虫防除に適している。

[0193] 上記害虫又は線虫類等として以下のものが例示される。

鱗翅目(チョウ目) 害虫として例えば、アオイラガ(*Parasa consocia*)、アカキリバ(*Anomis mesogona*)、アゲハ(*Papilio xuthus*)、アズキサヤムシガ(*Matsumuraeses azukivora*)、アズキノメイガ(*Ostrinia scapulalis*)、アフリカヨトウ(*Spodoptera exempta*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、アワノメイガ(*Ostrinia furnacalis*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イガ(*Tinea translucens*)、イグサシンムシガ(*Bactra furfurana*)、イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、イネタテハマキ(*Marasmia exigua*)、イネツトムシ(*Parnara guttata*)、イネヨトウ(*Sesamia inferens*)、イモキバガ(*Brachmia triannulella*)、イラガ(*Monema flavescens*)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、ウコンノメイガ(*Pleuroptya ruralis*)、ウメエダシャク(*Cystidia couaggaria*)、ウラナミシジミ(*Lampides boeticus*)、オオスカシバ(*Cephonodes hylas*)、オオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)、オオトビモンシャチホコ(*Phalerodonta manleyi*)、オオミノガ(*Eumeta japonica*)、オオモンシロチョウ(*Pieris brassicae*)、オビカレハ(*Malacosoma neustria testacea*)、カキノヘタムシガ(*Stathmopoda masinissa*)、カキホソガ(*Cuphodes diospyrosella*)、カクモンハマキ(*Archips xylosteanus*)、カブラヤガ(*Agrotis segetum*)、カンショシンクイハマキ(*Tetramoera schistaceana*)、キアゲハ(*Papilio machaon hippocrates*)、キマダラコウモリ(*Endoclyta sinensis*)、ギンモンハモグリガ(*Lyonetia prunifoliella*)、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoneella*)、クリミガ(*Cydia kurokoi*)、クリミドリシンクイガ(*Eucoenogenes aestuosa*)、グレープベリーモス(*Lobesia botrana*)、クロシタアオイラガ(*Latoia sinica*)、クロフタモンマダラメイガ(*Euzophera batangensis*)、クワイホソハマキ(*Phalonidia mesotypa*)、クワゴマダラヒトリ(*Spilosoma*

imparilis)、クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、クワヒメハマキ(*Olethreutes mori*)、コイガ (*Tineola bisselliella*) 、コウモリガ(*Endoclyta excrescens*)、コクガ(*Nemapogon granellus*)、コスカシバ(*Synanthedon hector*)、コドリリング(*Cydia pomonella*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、サザンピンクボーラー(*Sesamia calamistis*)、サンカメイガ(*Scirpophaga incertulas*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*) 、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*) 、シャチホコガ(*Stauropus fagi persimilis*)、シロイチモジマダラメイガ(*Etiella zinckenella*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) 、シロテンコウモリ(*Palpifer sexnotata*)、シロナヨトウ(*Spodoptera mauritia*)、イネシロオオメイガ(*Scirpophaga innotata*)、シロモンヤガ(*Xestia c-nigrum*)、スジキリヨトウ(*Spodoptera depravata*)、スジコナマダラメイガ(*Ephestia kuehniella*)、スモモエダシャク(*Angerona prunaria*)、セグロシャチホコ (*Clostera anastomosis*) 、ソイビーンルーパー(*Pseudoplusia includens*)、ダイズサヤムシガ(*Matsumuraeses falcana*)、タバコガ(*Helicoverpa assulta*)、タマナギンウワバ(*Autographa nigrisigna*)、タマナヤガ(*Agrotis ipsilon*)、チャドクガ(*Euproctis pseudoconspersa*)、チャノコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)、チャノホソガ(*Caloptilia theivora*)、チャハマキ(*Homona magnanima*)、チャマダラメイガ(*Ephestia elutella*)、チャミノガ(*Eumeta minuscula*)、ツマアカシャチホコ(*Clostera anachoreta*)、ツメクサガ(*Heliothis maritima*)、テングハマキ(*Sparganothis pilleriana*)、トウモロコシメイガ(*Busseola fusca*)、ドクガ(*Euproctis subflava*)、トビモンオオエダシャク (*Biston robustum*)、トマトフルーツワーム(*Heliothis zea*)、ナカジロシタバ(*Aedia leucomelas*)、ナシイラガ(*Narosoideus flavidorsalis*)、ナシケンモン (*Viminia runcis*) 、ナシチビガ(*Bucculatrix pyrivorella*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、ナシホソガ(*Spulerina astaurola*)、ナシマダラメイガ(*Ectomyelois pyrivorella*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、ネギコガ(*Acrolepiopsis sapporensis*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*) 、ハイ

マダラノメイガ (*Hellula undalis*)、バクガ (*Sitotroga cerealella*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、ハマキガの一種 (*Eucosma aporema*)、バラハマキ (*Acleris comariana*)、ヒメクロイラガ (*Scopelodes contractus*)、ヒメシロモンドクガ (*Orgyia thyellina*)、フォールアーミーワーム (*Spodoptera frugiperda*)、フキノメイガ (*Ostrinia zaguliaevi*)、フタオビコヤガ (*Naranga aenescens*)、フタテンカギバモドキ (*Andraca bipunctata*)、ブドウスカシバ (*Paranthrene regalis*)、ブドウスズメ (*Acosmeryx castanea*)、ブドウハモグリガ (*Phyllocnistis toparcha*)、ブドウヒメハマキ (*Endopiza viteana*)、ブドウホソハマキ (*Eupoecillia ambiguella*)、ベルベットビーンキャタピラー (*Anticarsia gemmatalis*)、ホソバハイイロハマキ (*Cnephasia cinereipalpata*)、マイマイガ (*Lymantria dispar*)、マツカレハ (*Dendrolimus spectabilis*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、マメノメイガ (*Maruca testulalis*)、マメヒメサヤムシガ (*Matsumuraeses phaseoli*)、マメホソガ (*Caloptilia soyella*)、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)、マエウスキノメイガ (*Omiodes indicata*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*)、ミツモンキンウワバ (*Acanthopplusia agnata*)、ミノガ (*Bambalina* sp.)、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*)、モモノゴマダラノメイガ (*Conogethes punctiferalis*)、モモスカシバ類 (*Synanthedon* sp.)、モモハモグリガ (*Lyonetia clerkella*)、モンキアゲハ (*Papilio helenus*)、モンキチョウ (*Colias erate poliographus*)、モンクロシャチホコ (*Phalera flavescens*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類、モンシロドクガ (*Euproctis similis*)、ヤマノイモコガ (*Acrolepiopsis suzukiella*)、ヨーロピアンコーンボラー (*Ostrinia nubilalis*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、ヨモギエダシャク (*Ascotis selenaria*)、ヨモギオオホソハマキ (*Phtheochroides clandestina*)、リンゴオオハマキ (*Hoshinoa adumbratana*)、リンゴカレハ (*Odonestis pruni japonensis*)、リンゴケンモン (*Triaena intermedia*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、リンゴコシンクイ (*Grapholita inopinata*)、リンゴ

シロヒメハマキ(*Spilonota ocellana*)、リングハイイロハマキ(*Spilonota lechriaspis*)、リングハマキクロバ(*Illiberis pruni*)、リングヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、リングホソガ(*Caloptilia zachrysa*)、リングモンハマキ(*Archips breviplicanus*)、ワタアカキリバ(*Anomis flava*)、ワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella*)、ワタノメイガ(*Notarcha derogata*)、ワタヘリクロノメイガ(*Diaphania indica*)、ニセアメリカタバコガ(*Heliothis virescens*)、及びワタリングア(*Earias cupreoviridis*)等が挙げられる。

[0194] 半翅目(カメムシ目)害虫として例えば、アオクサカメムシ(*Nezara antennata*)、アカスジカスミカメ(*Stenotus rubrovittatus*)、アカスジカメムシ(*Graphosoma rubrolineatum*)、アカヒゲホソミドリカスミカメ(*Trigonotylus coelestialium*)等、アカヒメヘリカメムシ(*Aeschynteles maculatus*)、アカホシカスミカメ(*Creontiades pallidifer*)、アカホシカメムシ(*Dysdercus cingulatus*)、アカホシマルカイアガラムシ(*Chrysomphalus ficus*)、アカマルカイガラムシ(*Aonidiella aurantii*)、アブラゼミ(*Graptopsaltria nigrofuscata*)、アメリカコバネナガカメムシ(*Blissus leucopterus*)、イセリヤカイガラムシ(*Icerya purchasi*)、イチモンジカメムシ(*Piezodorus hybneri*)、イネカメムシ(*Lagynotomus elongatus*)、イネキイロヒメヨコバイ(*Thaia subrufa*)、イネクロカメムシ(*Scotinophara lurida*)、イバラヒゲナガアブラムシ(*Sitobion ibarae*)、イワサキカメムシ(*Stariodes iwasakii*)、ウスイロマルカイガラムシ(*Aspidiotus destructor*)、ウスモンミドリカスミカメ(*Taylorilygus pallidulus*)、ウメコブアブラムシ(*Myzus umecola*)、ウメシロカイガラムシ(*Pseudaulacaspis prunicola*)、エンドウヒゲナガアブラムシ(*Acyrtosiphon pisum*)、オオクモヘリカメムシ(*Anacanthocoris stricornis*)、オオクロトビカスミカメ(*Ectometopterus micantulus*)、オオトゲシラホシカメムシ(*Eysarcoris lewisi*)、オオヘリカメムシ(*Molipteryx fuliginosa*)、オオヨコバイ(*Cicadella viridis*)、オカボノアカアブラムシ(*Rhopalosiphum rufiabdominalis*)、オリーブカタカイガラムシ(*Saissetia oleae*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)、カシヒメヨコ

バイ (*Aguriahana quercus*)、カスミカメムシ類 (*Lygus* spp.)、カバワタフ
キマダラアブラムシ (*Euceraphis punctipennis*)、カンキツカイガラムシ (*Andaspis kashicola*)、カンキツカタカイガラムシ (*Coccus pseudomagnoliarum*)、カンシャコバネナガカメムシ (*Cavelerius saccharivorus*)、キクグン
バイ (*Galeatus spinifrons*)、キクヒメヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphoniella sanborni*)、キマルカイガラムシ (*Aonidiella citrina*)、クサギカメム
シ (*Halyomorpha mista*)、クスグンバイ (*Stephanitis fasciicarina*)、クスト
ガリキジラミ (*Trioza camphorae*)、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*)、クリトガリキジラミ (*Trioza quercicola*)、クルミグンバイ (*Uhlrites latius*)、グレープリーフホッパー (*Erythroneura comes*)、クロアシホ
ソナガカメムシ (*Paromius exiguus*)、クロカタマルカイガラムシ (*Duplaspidiotus claviger*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus*)
、クロトビカスミカメ (*Halticicellus insularis*)、クロフツノウンカ (*Perkinsiella saccharicida*)、クロリンゴキジラミ (*Psylla malivorella*)、ク
ワキジラミ (*Anomomeura mori*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinis*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、クワワタカ
イガラムシ (*Pulvinaria kuwacola*)、コアオカスミカメ (*Apolygus lucorum*)
、コバネヒョウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、コミカンアブラムシ
(*Toxoptera aurantii*)、サトウキビコナカイガラムシ (*Saccharicoccus sacchari*)、サトウキビネワタムシ (*Geoica lucifuga*)、サトウノウスイロウン
カ (*Numata muii*)、サンホーゼカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)
、シトラススノースケール (*Unaspis citri*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ
(*Aulacorthum solani*)、シラホシカメムシ (*Eysarcoris ventralis*)、シル
バーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*)、シロオオヨコバイ (*Cicadella spectra*)、シロマルカイガラムシ (*Aspidiotus hederae*)、スカシヒメヘ
リカメムシ (*Liorhyssus hyalinus*)、セグロヒメキジラミ (*Calophya nigridorsalis*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、ソラマメヒゲナガアブラム
シ (*Megoura crassicauda*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)

、ダイズアブラムシ(*Aphis glycines*)、タイワンクモヘリカメムシ (*Leptocoris oratorius*)、タイワンツマグロヨコバイ(*Nephotettix virescens*)、タイワンヒゲナガアブラムシ (*Uroeucon formosanum*)、タバコカスミカメ (*Cyrtopeltis tenuis*)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、チャノカタカイガラムシ (*Lecanium persicae*)、チャノクロホシカイガラムシ (*Parlatoria theae*)、チャノマルカイガラムシ (*Pseudaonidia paeoniae*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)、チャバネアオカメムシ(*Plautia stali*)、チューリップネアブラムシ (*Dysaphis tulipae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphum euphorbiae*)、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyrioides*)、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ツバキクロホシカイガラムシ (*Parlatoria camelliae*)、ツマグロアオカスミカメ(*Apolygus spinolai*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、ツヤアオカメムシ(*Glaucias subpunctatus*)、テンサイカスミカメ(*Orthotylus flavosparsus*)、トウモロコシアブラムシ(*Rhopalosiphum maidis*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、トゲシラホシカメムシ(*Eysarcoris parvus*)、トコジラミ(*Cimex lectularius*)、トドキジラミ (*Psylla abietis*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、トベラキジラミ (*Psylla tobirae*)、ナガメ (*Eurydema rugosum*)、ナシアブラムシ (*Schizaphis piricola*)、ナシキジラミ (*Psylla pyricola*)、ナシクロホシカイガラムシ (*Parlatoreopsis pyri*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、ナシコナカイガラムシ (*Dysmicoccus wisteriae*)、ナシシロナガカイガラムシ (*Lepholeucaspis japonica*)、ナシマルアブラムシ (*Sappaphis piri*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、ネギアブラムシ (*Neotoxoptera formosana*)、ハスクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum nymphaeae*)、バラヒメヨコバイ (*Edwardsianarosae*)、ハランナガカイガラムシ (*Pinnaspis aspidistrae*)、ハンノキジラミ (*Psylla alni*)、ハンノナガヨコバイ (*Speusotettix subfuscus*)、ハンノヒメヨコバイ (*Alnetoidia alneti*)、ヒエウンカ (*Sogatella panicicola*)、ヒゲナガカスミカメ (*Adelphocoris lineolatus*)、ヒメアカホシカメムシ (*Dysder*

cus poecilus)、ヒメクロカイガラムシ (*Parlatoria ziziphi*)、ヒメグンバイ (*Uhlerites debile*)、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、ヒメハリカメムシ (*Cletus trigonus*)、ヒメフタテンナガアワフキ (*Clovio punctata*)、ヒメヨコバイ類 (*Empoasca* sp.)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ヒラタヒョウタンナガカメムシ (*Pachybrachius luridus*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhi* ae)、フタスジカスミカメ (*Stenotus binotatus*)、フタテンヒメヨコバイ (*Arboridia apicalis*)、フタテンヨコバイ (*Macrosteles fascifrons*)、ブチヒゲカメムシ (*Dolycoris baccarum*)、ブチヒゲクロカスミカメ (*Adelphocoris triannulatus*)、ブドウネアブラムシ (*Viteus vitifolii*)、ホオズキカメムシ (*Acanthocoris sordidus*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocorisa acuta*)、ホソコバネナガカメムシ (*Macropes obnubilus*)、ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、ポテトピシリド (*Paratrioza cockerelli*)、マエキアワフキ (*Aphrophora costalis*)、マキバカスミカメ (*Lygus disponi*)、マダラカスミカメ (*Lygus saundersi*)、マツコナカイガラムシ (*Crisicoccus pini*)、マツヒメヨコバイ (*Empoasca abietis*)、マツモトコナカイガラムシ (*Crisicoccus matsumotoi*)、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、マルカメムシ (*Megacopta punctatissimum*)、マルシラホシカメムシ (*Eysarcoris guttiger*)、ミカンカキカイガラムシ (*Lepidosaphes beckii*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*)、ミカンヒメコナカイガラムシ (*Pseudococcus citriculus*)、ミカンヒメヨコバイ (*Zyginella citri*)、ミカンヒメワタカイガラムシ (*Pulvinaria citricola*)、ミカンヒラタカイガラムシ (*Coccus discrepans*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria aurantii*)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、ムギカスミカメ (*S*

tenodema calcaratum)、ムギクビレアブラムシ(Rhopalosiphum padi)、ムギヒゲナガアブラムシ(Sitobion akebiae)、ムギミドリアブラムシ(Schizaphis graminum)、ムギヨコバイ(Sorhoanus tritici)、ムギワラギクオマルアブラムシ(Brachycaudus helichrysi)、ムラサキカメムシ(Carpocoris purpureipennis)、モモアカアブラムシ(Myzus persicae)、モモコフキアブラムシ(Hyalopterus pruni)、ヤナギアブラムシ(Aphis farinose yanagicola)、ヤナギグンバイ(Metasalis populi)、ヤノネカイガラムシ(Unaspis yanonensis)、ヤマアサキジラミ(Mesohomotoma camphorae)、ユキヤナギアブラムシ(Aphis spiraeicola)、リンゴアブラムシ(Aphis pomi)、リンゴカキカイガラムシ(Lepidosaphes ulmi)、リンゴキジラミ(Psylla mali)、リンゴクロカスミカメ(Heterocordylus flavipes)、リンゴコブアブラムシ(Myzus malisuctus)、リンゴネアブラムシ(Aphidonuguis mali)、リンゴマダラヨコバイ(Orientus ishidai)、リンゴミドリアブラムシ(Ovatus malicollens)、リンゴワタムシ(Eriosoma lanigerum)、ルビーロウムシ(Ceroplastes rubens)、及びワタアブラムシ(Aphis gossypii)等が挙げられる。

- [0195] 鞘翅目(コウチュウ目)害虫として例えば、アオスジカミキリ(Xystrocera globosa)、アオバアリガタハネカクシ(Paederus fuscipes)、アオハナムグリ(Eucetonia roelofsi)、アズキゾウムシ(Callosobruchus chinensis)、アリモドキゾウムシ(Cylas formicarius)、アルファルファタコゾウムシ(Hypera postica)、イネゾウムシ(Echinocnemus squameus)、イネドロオイムシ(Oulema oryzae)、イネネクイハムシ(Donacia provosti)、イネミズゾウムシ(Lissorhoptrus oryzophilus)、イモサルハムシ(Colasposoma dauricum)、イモゾウムシ(Euscepes postfasciatus)、インゲンテントウ(Epilachna varivestis)、インゲンマメゾウムシ(Acanthoscelides obtectus)、ウエスタンコーンルートワーム(Diabrotica virgifera virgifera)、ウメチョッキリゾウムシ(Involvulus cupreus)、ウリハムシ(Aulacophora femoralis)、エンドウゾウムシ(Bruchus pisorum)、オオニジュウヤホシテントウ(Epilachna vigintioctomaculata)、ガイマイデオキスイ(Carpophilus dimidiatus)、カメノ

コハムシ(*Cassida nebulosa*)、キアシノミハムシ(*Luperomorpha tenebrosa*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、キボシカミキリ(*Psacotheta hilaris*)、キマダラカミキリ(*Aeolesthes chrysothrix*)、クリシギゾウムシ(*Curculio sikkimensis*)、クリヤケシキスイ (*Carpophilus hemipterus*)、コアオハナムグリ (*Oxycetonia jucunda*)、コーンルートワーム類 (*Diabrotica* spp.)、コガネムシ (*Mimela splendens*)、コクゾウムシ(*Sitophilus zeamais*)、コクヌストモドキ(*Tribolium castaneum*)、ココクゾウムシ(*Sitophilus oryzae*)、コヒメコクヌストモドキ (*Palorus subdepressus*)、コフキコガネ (*Melolontha japonica*)、ゴマダラカミキリ(*Anoplophora malasiaca*)、ゴミムシダマシ (*Neatus picipes*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、サザンコーンルートワーム(*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、シバオサゾウムシ(*Sphenophorus venatus*)、ジュウシホシクビナガハムシ(*Crioceris quatuordecimpunctata*)、スモモゾウムシ(*Conotrachelus nenuphar*)、ダイコンサルゾウムシ(*Ceuthorrhynchidius albosuturalis*)、ダイコンハムシ(*Phaedon brassicae*)、タバコシバンムシ(*Lasioderma serricorne*)、チビコフキゾウムシ(*Sitona japonicus*)、チャイロコガネ(*Adoretus tenuimaculatus*)、チャイロコメノゴミムシダマシ(*Tenebrio molitor*)、チャイロサルハムシ(*Basilepta balyi*)、ツメクサタコゾウムシ(*Hypera nigrirostris*)、テンサイトビハムシ(*Chaetocnema concinna*)、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ナガチャコガネ (*Heptophylla picea*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*)、ノーザンコーンルートワーム(*Diabrotica longicornis*)、ハナムグリ(*Eucetonia pilifera*)、ハリガネムシ類(*Agriotes* spp.)、ヒメカツオブシムシ(*Attagenus unicolor japonicus*)、ヒメキバネサルハムシ(*Pagria signata*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、ヒメコクヌストモドキ(*Palorus ratzeburgii*)、ヒメゴミムシダマシ (*Alphitobius laevigatus*)、ヒメマルカツオブシムシ(*Anthrenus verbasci*)、ヒラタキクイムシ(*Lyctus brunneus*)、ヒラタコクヌストモドキ(*Tribolium confusum*)、フタスジヒメハムシ(*Medythia nigrobilineata*)、ブドウトラカミキリ(X

ylotrechus pyrrhoderus)、ポテトフリービートル(*Epitrix cucumeris*)、マツノクイムシ(*Tomicus piniperda*)、マツノマダラカミキリ(*Monochamus alternatus*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、マメハンミョウ(*Epicauta gorhami*)、メイズウィービル(*Sitophilus zeamais*)、モモチョッキリゾウムシ(*Rhynchites heros*)、ヤサイゾウムシ(*Listroderes costirostris*)、ヨツモンマメゾウムシ(*Callosobruchus maculatus*)、リンゴコフキゾウムシ(*Phyllobius armatus*)、リンゴハナゾウムシ(*Anthonomus pomorum*)、ルリハムシ(*Lineidea aenea*)、及びワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*)等が挙げられる。

[0196] 双翅目(ハエ目)害虫として例えば、アカイエカ(*Culex pipiens pallens*)、アカザモグリハナバエ(*Pegomya hyoscyami*)、アシグロハモグリバエ(*Liriomyza huidobrensis*)、イエバエ(*Musca domestica*)、イネキモグリバエ(*Chlorops oryzae*)、イネクキミギワバエ(*Hydrellia sasakii*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、イネヒメハモグリバエ(*Hydrellia griseola*)、イネミギワバエ(*Hydrellia griseola*)、インゲンモグリバエ(*Ophiomyia phaseoli*)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、オウトウショウジョウバエ(*Drosophila suzukii*)、オウトウハマダラミバエ(*Rhacochlaena japonica*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、オオキモンノミバエ(*Megaselia spiracularis*)等のノミバエ類、オオチョウバエ(*Clogmia albipunctata*)、キリウジガガンボ(*Tipula aino*)、クロキンバエ(*Phormia regina*)、コガタアカイエカ(*Culex tritaeniorhynchus*)、シナハマダラカ(*Anopheles sinensis*)、ダイコンバエ(*Hylemya brassicae*)、ダイズサヤタマバエ(*Asphondylia* sp.)、タネバエ(*Delia platura*)、タマネギバエ(*Delia antiqua*)、ヨーロッパオウトウミバエ(*Rhagoletis cerasi*)、チカイエカ(*Culex pipiens molestus* Forskal)、チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)、チビクロバネキノコバエ(*Bradysia agrestis*)、テンサイモグリハナバエ(*Pegomya cunicularia*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、ナスハモグリバエ(*Liriomyza bryoniae*)、ナモグリバエ(*Chromatomyia horticola*)、ネギハモグリバエ(*Liriomyza chinensis*)、ネッタイイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、ネッタイ

シマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、マメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、ミカンコミバエ(*Dacus dorsalis*)、ミカンバエ(*Dacus tsuneonis*)、ムギアカタマバエ(*Sitodiplosis mosellana*)、ムギキモグリバエ(*Meromyza nigritris*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、及びリンゴミバエ(*Rhagoletis pomonella*)等が挙げられる。

[0197] 膜翅目(ハチ目)害虫として例えば、アミメアリ(*Pristomyrmex pungens*)、アリガタバチ類、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis*)、オオズアリ(*Pheidole noda*)、カブラハバチ(*Athalia rosae*)、クリタマバチ(*Dryocosmus kuriphilus*)、クロヤマアリ(*Formica fusca japonica*)、スズメバチ類、セグロカブラハバチ(*Athalia infumata infumata*)、チュウレンジハバチ(*Arge pagana*)、ニホンカブラハバチ(*Athalia japonica*)、ハキリアリ(*Acromyrmex* spp.)、ファイヤーアント(*Solenopsis* spp.)、リンゴハバチ(*Arge mali*)、及びルリアリ(*Ochetellus glaber*)等が挙げられる。

[0198] 直翅目(バッタ目)害虫として例えば、クサキリ(*Homorocoryphus lineosus*)、ケラ(*Gryllotalpa* sp.)、コイナゴ(*Oxya hyla intricata*)、コバネイナゴ(*Oxya yezoensis*)、トノサマバッタ(*Locusta migratoria*)、ハネナガイナゴ(*Oxya japonica*)、ヒメクサキリ(*Homorocoryphus jezoensis*)、及びエンマコオロギ(*Teleogryllus emma*)等が挙げられる。

[0199] アザミウマ目害虫として例えば、アカオビアザミウマ(*Selenothrips rubrocinctus*)、イネアザミウマ(*Stenchaetothrips biformis*)、イネクダアザミウマ(*Haplothrips aculeatus*)、カキクダアザミウマ(*Ponticulothrips diospyrosi*)、キイロハナアザミウマ(*Thrips flavus*)、クサキイロアザミウマ(*Anaphothrips obscurus*)、クスクダアザミウマ(*Liothrips floridensis*)、グラジオラスアザミウマ(*Thrips simplex*)、クロゲハナアザミウマ(*Thrips nigropilosus*)、クロトンアザミウマ(*Heliothrips haemorrhoidalis*)、クワアザミウマ(*Pseudodendrothrips mori*)、コスモスアザミウマ(*Microcephalothrips abdominalis*)、シイオナガクダアザミウマ(*Leeuwenia pasanii*)、シイマルク

letus moorei)、ミナミヒメハダニ(*Brevipalpus phoenicis*)、ミミヒゼンダニ(*Octodectes cynotis*)、ヤケヒョウヒダニ(*Dermatophagoides pteromyssus*)、ヤマトチマダニ(*Haemaphysalis flava*)、ヤマトマダニ(*Ixodes ovatus*)、リュウキュウミカンサビダニ(*Phyllocoptruta citri*)、リンゴサビダニ(*Aculus schlechtendali*)、リンゴハダニ(*Panonychus ulmi*)、ローンスターチツク(*Amblyomma americanum*)、及びワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、ロビンネダニ(*Rhyzoglyphus robini*)、ネダニモドキの一種(*Sancassania* sp.)等が挙げられる。

[0201] シロアリ目害虫として例えば、アマミシロアリ(*Reticulitermes miyatakei*)、アメリカカンザイシロアリ(*Incisitermes minor*)、イエシロアリ(*Coptotermes formosanus*)、オオシロアリ(*Hodotermopsis japonica*)、カンモンシロアリ(*Reticulitermes* sp.)、キアシシロアリ(*Reticulitermes flaviceps amamianus*)、クシモトシロアリ(*Glyptotermes kushimensis*)、コウシュウイエシロアリ(*Coptotermes guangzhouensis*)、コウシュンシロアリ(*Neotermes koshunensis*)、コダマシロアリ(*Glyptotermes kodamai*)、サツマシロアリ(*Glyptotermes satsumensis*)、ダイコクシロアリ(*Cryptotermes domesticus*)、タイワンシロアリ(*Odontotermes formosanus*)、ナカジマシロアリ(*Glyptotermes nakajimai*)、ニトベシロアリ(*Pericapritermes nitobei*)、及びヤマトシロアリ(*Reticulitermes speratus*)等が挙げられる。

[0202] ゴキブリ目害虫として例えば、クロゴキブリ(*Periplaneta fuliginosa*)、チャバネゴキブリ(*Blattella germanica*)、トウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis*)、トビイロゴキブリ(*Periplaneta brunnea*)、ヒメチャバネゴキブリ(*Blattella lituricollis*)、ヤマトゴキブリ(*Periplaneta japonica*)、及びワモンゴキブリ(*Periplaneta americana*)等が挙げられる。

[0203] ノミ目として例えば、ヒトノミ(*Pulex irritans*)、ネコノミ(*Ctenocephalides felis*)、及びニワトリノミ(*Ceratophyllus gallinae*)等が挙げられる。

[0204] 線虫類として例えば、イチゴメセンチュウ(*Nothotylenchus acris*)、イネシンガレセンチュウ(*Aphelenchoides besseyi*)、キタネグサレセンチュウ

ウ(*Pratylenchus penetrans*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ(*Meloidogyne incognita*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、及びミカンネセンチュウ(*Tylenchus semipennatus*)等が挙げられる。

[0205] 軟体動物類として例えば、スクミリンゴガイ(*Pomacea canaliculata*)、アフリカマイマイ(*Achatina fulica*)、ナメクジ(*Meghimatium bilineatum*)、チャコウラナメクジ(*Lehmannina valentiana*)、コウラナメクジ(*Limax flavus*)、及びウスカワマイマイ(*Acusta despecta sieboldiana*)等が挙げられる。

[0206] また、本発明の農園芸用殺虫剤は、その他の害虫としてトマトキバガ (*Tuta absoluta*) に対しても強い殺虫効果を有するものである。

[0207] また防除対象の一つである動物寄生性のダニとして例えば、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campanulata*)、イスカチマダニ (*Haemaphysalis concinna*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis japonica*)、ヒゲナガチマダニ (*Haemaphysalis kitaokai*)、イヤスチマダニ (*Haemaphysalis ias*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*)、シュルツエマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megaspinosa*)、アミノカクマダニ (*Dermacentor reticulatus*)、及びタイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanensis*) のようなマダニ類、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、及びミナミトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*) のようなトリサシダニ類、ナンヨウツツガムシ (*Eutrombicula wichmanni*)、アカツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*)、フトゲツツガムシ (*Leptotrombidium pallidum*)

、フジツツガムシ (*Leptotrombidium fuji*)、トサツツガムシ (*Leptotrombidium tosa*)、ヨーロッパアキダニ (*Neotrombicula autumnalis*)、アメリカツツガムシ (*Eutrombicula alfreddugesi*)、及びミヤガワタマツツガムシ (*Helenicula miyagawai*) のようなツツガムシ類、イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*)、ウサギツメダニ (*Cheyletiella parasitivorax*)、及びネコツメダニ (*Cheyletiella blakei*) のようなツメダニ類、ウサギキュウセンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウシシヨクヒダニ (*Chorioptes bovis*)、イヌミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、及びネコシヨウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*) のようなヒゼンダニ類、並びにイヌニキビダニ (*Demodex canis*) のようなニキビダニ類等が挙げられる。

[0208] 他の防除対象であるノミとして例えば、ノミ目 (Siphonaptera) に属する外部寄生性無翅昆虫、より具体的には、ヒトノミ科 (Pulicidae)、及びナガノミ科 (Ceratophyllus) などに属するノミ類が挙げられる。ヒトノミ科に属するノミ類としては、例えば、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、ニワトリフトノミ (*Echidnophaga gallinacea*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)、メクラネズミノミ (*Leptopsylla segnis*)、ヨーロッパネズミノミ (*Nosopsyllus fasciatus*)、及びヤマトネズミノミ (*Monopsyllus anisus*) 等が挙げられる。

[0209] さらに他の防除対象である外部寄生生物としては例えば、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ウマジラミ (*Haematopinus asini*)、ヒツジジラミ (*Dalmanella ovis*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ケジラミ (*Phthirus pubis*)、及びアタマジラミ (*Pediculus capitis*) のようなシラミ類、並びにイヌハジラミ (*Trichodectes canis*) のようなハジラミ類、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、ウアイヌカカ (*Culicoides schultzei*)、及びツメトゲブユ (*Simulium ornatum*) のような吸血性双翅目害虫などが挙げられる。また内部寄生生物としては例えば、肺虫、ベンチュウ、

結節状ウオーム、胃内寄生虫、回虫、及び糸状虫類のような線虫類、マンソン裂頭条虫、広節裂頭条虫、瓜実条虫、多頭条虫、単包条虫、及び多包条虫のような条虫類、日本住血吸虫、及び肝蛭のような吸虫類、並びにコクシジウム、マラリア原虫、腸内肉胞子虫、トキソプラズマ、及びクリプトスポリジウムのような原生動物等が挙げられる。

[0210] 本発明の一般式（１）で表される縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で育苗施設、水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌等の栽培担体等に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。中でも、作物、花卉等の育苗土壌、移植時の植え穴土壌、株元、灌漑水、水耕栽培における栽培水等に処理して、土壌を介し又は介さずして根から本発明化合物を吸収させることによるいわゆる浸透移行性を利用した施用が好ましい使用形態である。

[0211] 本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる有用植物は特に限定されるものではないが、例えば穀類（例えば、稲、大麦、小麦、ライ麦、オート麦、とうもろこし等）、豆類（大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、いんげん豆、落花生等）、果樹・果実類（林檎、柑橘類、梨、葡萄、桃、梅、桜桃、胡桃、栗、アーモンド、バナナ等）、葉・果菜類（キャベツ、トマト、ほうれんそう、ブロッコリー、レタス、たまねぎ、ねぎ（あさつき、わけぎ）、ピーマン、なす、いちご、ペッパー、おくら、にら等）、根菜類（にんじん、馬鈴薯、さつまいも、さといも、だいこん、かぶ、れんこん、ごぼう、にんにく、らっきょう等）、加工用作物（棉、麻、ビート、ホップ、さとうきび、てんさい、オリーブ、ゴム、コーヒー、タバコ、茶等）、ウリ類（かぼちゃ、きゅうり、すいか、まくわうり、メロン等）、牧草類（オーチャードグラス、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファ等）、芝類（高麗芝、ベントグラス等）、香料等鑑賞用作物（ラベンダー、ローズマリー、

タイム、パセリ、胡椒、生姜等）、花卉類（きく、ばら、カーネーション、蘭、チューリップ、ゆり等）、庭木（いちょう、さくら類、あおき等）、林木（トドマツ類、エゾマツ類、松類、ヒバ、杉、桧、ユウカリ等）等の植物を挙げることができる。

[0212] 上記「植物」には、イソキサフルトール等のH P P D阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のA L S阻害剤、グリホサート等のE P S P合成酵素阻害剤、グルホシネート等のグルタミン合成酵素阻害剤、セトキシジム等のアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤、ブロモキシニル、ジカンバ、2, 4-D等の除草剤に対する耐性を古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により耐性を付与された植物も含まれる。

[0213] 古典的な育種法により耐性を付与された「植物」の例としては、イマゼタピル等のイミダゾリノン系A L S阻害型除草剤に耐性のナタネ、コムギ、ヒマワリ、イネがありC l e a r f i e l d（登録商標）の商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によるチフェンスルフロンメチル等のスルホニルウレア系A L S阻害型除草剤に耐性のダイズがあり、S T Sダイズの商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によりトリオンオキシム系、アリールオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤などのアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物の例としてS Rコーン等がある。

またアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物はP r o c. N a t l. A c a d. S c i. U S A 87巻、7175～7179頁（1990年）等に記載されている。またアセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の変異アセチルC o Aカルボキシラーゼがウィード・サイエンス（W e e d S c i e n c e）53巻、728～746頁（2005年）等に報告されており、こうした変異アセチルC o Aカルボキシラーゼ遺伝子を遺伝子組換え技術により植物に導入するかもしくは抵抗性付与に関わる変異を植物

アセチルC o Aカルボキシラーゼに導入する事により、アセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の植物を作出することができ、さらに、キメラプラスティ技術（Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285 : 316-318.）に代表される塩基置換変異導入核酸を植物細胞内に導入して植物のアセチルC o Aカルボキシラーゼ遺伝子やALS遺伝子等に部位特異的アミノ酸置換変異を導入することにより、アセチルC o Aカルボキシラーゼ阻害剤やALS阻害剤等に耐性の植物を作出することができ、これらの植物に対しても本発明の農園芸用殺虫剤を使用することができる。

[0214] 更に遺伝子組換え植物で発現される毒素として、バチルス・セレウスやバチルス・ポピリエ由来の殺虫性タンパク；バチルス・チューリンゲンシス由来のCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C等の δ -エンドトキシン、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫タンパク；線虫由来の殺虫タンパク；さそり毒素、クモ毒素、ハチ毒素または昆虫特異的神経毒素等動物によって産生される毒素；糸状菌類毒素；植物レクチン；アグルチニン；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤等のプロテアーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サポリン、ブリオジン等のリボゾーム不活性化タンパク（RIP）；3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グルコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ等のステロイド代謝酵素；エクダイソン阻害剤；HMG-CoAリダクターゼ；ナトリウムチャネル、カルシウムチャネル阻害剤等のイオンチャネル阻害剤；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体；スチルベンシンターゼ；ビベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ等が挙げられる。

[0215] またこの様な遺伝子組換え植物で発現される毒素として、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、

C r y 3 B b 1、C r y 9 C、C r y 3 4 A bまたはC r y 3 5 A b等のδ-エンドトキシンタンパク、V I P 1、V I P 2、V I P 3またはV I P 3 A等の殺虫タンパクのハイブリッド毒素、一部を欠損した毒素、修飾された毒素も含まれる。ハイブリッド毒素は組換え技術を用いて、これらタンパクの異なるドメインの新しい組み合わせによって作り出される。一部を欠損した毒素としては、アミノ酸配列の一部を欠損したC r y 1 A bが知られている。修飾された毒素としては、天然型の毒素のアミノ酸の1つまたは複数が置換されている。

これら毒素の例及びこれら毒素を合成することができる組換え植物は、E P - A - 0 3 7 4 7 5 3、W O 9 3 / 0 7 2 7 8、W O 9 5 / 3 4 6 5 6、E P - A - 0 4 2 7 5 2 9、E P - A - 4 5 1 8 7 8、W O 0 3 / 0 5 2 0 7 3等に記載されている。

[0216] これらの組換え植物に含まれる毒素は、特に、甲虫目害虫、半翅目害虫、双翅目害虫、鱗翅目害虫、線虫類への耐性を植物に付与する。本発明の農園芸用殺虫剤はそれらの技術と併用、あるいは体系化して用いることもできる。

[0217] 本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫あるいは線虫防除に有効な量を当該害虫および線虫の発生が予測される植物に使用すればよく、例えば果樹、穀類、野菜等において発生する害虫および線虫に対しては茎葉部に散布する他に、種子の薬剤への浸漬、種子粉衣、カルパー処理等の種子処理、土壌全層混和、作条施用、床土混和、セル苗処理、植え穴処理、株元処理、トップドレス、イネの箱処理、水面施用等、土壌等に処理して根から吸収させて使用することもできる。加えて、養液（水耕）栽培における養液への施用、くん煙あるいは樹幹注入等による使用もできる。

更に、本発明の農園芸用殺虫剤は、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害虫防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される場所に使用すればよく、例えば貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫、森林害虫等に

散布する他に、家屋建材への塗布、くん煙、ベイト等として使用することもできる。

[0218] 種子処理の方法としては、例えば、液状又は固体状の製剤を希釈又は希釈せずして液体状態にて種子を浸漬して薬剤を浸透させる方法、固形製剤又は液状製剤を種子と混和、粉衣処理して種子の表面に付着させる方法、樹脂、ポリマー等の付着性の担体と混和して種子にコーティングする方法、植え付けと同時に種子付近に散布する方法等が挙げられる。

当該種子処理を行う「種子」とは、植物の繁殖に用いられる栽培初期の植物体を意味し、例えば、種子の他、球根、塊茎、種芋、株芽、むかご、鱗茎、あるいは挿し木栽培用の栄養繁殖用の植物体を挙げることができる。

本発明の使用方法を実施する場合の植物の「土壌」又は「栽培担体」とは、作物を栽培するための支持体、特に根を生えさせる支持体を示すものであり、材質は特に制限されないが、植物が生育しうる材質であれば良く、いわゆる土壌、育苗マット、水等であっても良く、具体的な素材としては例えば、砂、軽石、バーミキュライト、珪藻土、寒天、ゲル状物質、高分子物質、ロックウール、グラスウール、木材チップ、バーク等であっても良い。

[0219] 作物茎葉部又は貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫若しくは森林害虫等への散布方法としては、乳剤、フロアブル剤等の液体製剤又は水和剤もしくは顆粒水和剤等の固形製剤を水で適宜希釈し、散布する方法、粉剤を散布する方法、又はくん煙等が挙げられる。

土壌への施用方法としては、例えば、液体製剤を水に希釈又は希釈せずして植物体の株元または育苗用苗床等に施用する方法、粒剤を植物体の株元又は育苗のための苗床等に散布する方法、播種前または移植前に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布し土壌全体と混和する方法、播種前または植物体を植える前に植え穴、作条等に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布する方法等が挙げられる。

[0220] 水稻の育苗箱への施用方法としては、剤型は、例えば播種時施用、緑化期施用、移植時施用などの施用時期により異なる場合もあるが、粉剤、顆粒水

和剤、粒剤等の剤型で施用すればよい。培土との混和によっても施用することができ、培土と粉剤、顆粒水和剤又は粒剤等との混和、例えば、床土混和、覆土混和、培土全体への混和等することができる。単に、培土と各種製剤を交互に層状にして施用してもよい。

水田への施用方法としては、ジャンボ剤、パック剤、粒剤、顆粒水和剤等の固形製剤、フロアブル、乳剤等の液体状製剤を、通常は、湛水状態の水田に散布する。その他、田植え時には、適当な製剤をそのまま、あるいは、肥料に混和して土壌に散布、注入することもできる。また、水口や灌漑装置等の水田への水の流入元に乳剤、フロアブル等の薬液を利用することにより、水の供給に伴い省力的に施用することもできる。

[0221] 畑作物においては、播種から育苗期において、種子又は植物体に近接する栽培担体等へ処理ができる。畑に直接播種する植物においては、種子への直接処理の他、栽培中の植物の株元への処理が好適である。粒剤を用いて散布処理又は水に希釈あるいは希釈しない薬剤を液状にて灌注処理を行うこと等ができる。粒剤を播種前の栽培担体と混和させた後、播種するのも好ましい処理である。

移植を行う栽培植物の播種、育苗期の処理としては、種子への直接処理の他、育苗用苗床への、液状とした薬剤の灌注処理又は粒剤の散布処理が好ましい。また、定植時に粒剤を植え穴に処理をしたり、移植場所近辺の栽培担体に混和することも好ましい処理である。

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

即ち、本発明の一般式（１）で表される縮合複素環化合物又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

[0222] 本発明の組成物（農園芸用殺虫剤又は動物寄生生物防除剤）は、有効成分

の他に必要に応じて農薬製剤又は動物寄生生物防除剤に通常用いられる添加成分を含有することができる。この添加成分としては、固体担体、液体担体等の担体、界面活性剤、分散剤、湿潤剤、結合剤、粘着付与剤、増粘剤、着色剤、拡張剤、展着剤、凍結防止剤、固結防止剤、崩壊剤、分解防止剤等が挙げられる。その他必要に応じ、防腐剤、植物片等を添加成分に用いてもよい。これらの添加成分は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0223] 固体担体としては、例えば石英、クレー、カオリナイト、ピロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト、珪藻土等の天然鉱物類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、塩化カリウム等の無機塩類、合成ケイ酸、合成ケイ酸塩、デンプン、セルロース、植物粉末（例えばおがくず、ヤシガラ、トウモロコシ穂軸、タバコ茎等）等の有機固体担体、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、尿素、無機中空体、プラスチック中空体、フュームド シリカ（fumed silica, ホワイトカーボン）等が挙げられる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0224] 液体担体としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール等の一価アルコール類や、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ヘキシレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類のようなアルコール類、プロピレングリコールエーテル等の多価アルコール化合物類、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のケトン類、エチルエーテル、ジオキサン、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ノルマルパラフィン、ナフテン、イソパラフィン、ケロシン、鉱油等の脂肪族炭化水素類、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の芳香族炭化

水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート、アジピン酸ジメチル等のエステル類、 γ -ブチロラクトン等のラクトン類、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、N-アルキルピロリジノン等のアミド類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド等の硫黄化合物類、大豆油、ナタネ油、綿実油、ヒマシ油等の植物油、水等を挙げることができる。これらは単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0225] 分散剤や湿展剤として用いる界面活性剤としては、例えばソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸ジエステル、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンジアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルホルマリン縮合物、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリスチレンポリオキシエチレンブロックポリマー、アルキルポリオキシエチレンポリプロピレンブロックコポリマーエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアミン、ポリオキシエチレン脂肪酸アミド、ポリオキシエチレン脂肪酸ビスフェニルエーテル、ポリアルキレンベンジルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレンスチリルフェニルエーテル、アセチレンジオール、ポリオキシアルキレン付加アセチレンジオール、ポリオキシエチレンエーテル型シリコーン、エステル型シリコーン、フッ素系界面活性剤、ポリオキシエチレンひまし油、ポリオキシエチレン硬化ひまし油等の非イオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンス

ルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、脂肪酸塩、ポリカルボン酸塩、ポリアクリル酸塩、N-メチル-脂肪酸サルコシネート、樹脂酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルリン酸塩等のアニオン性界面活性剤、ラウリルアミン塩酸塩、ステアリルアミン塩酸塩、オレイルアミン塩酸塩、ステアリルアミン酢酸塩、ステアリルアミノプロピルアミン酢酸塩、アルキルトリメチルアンモニウムクロライド、アルキルジメチルベンザルコニウムクロライド等のアルキルアミン塩等のカチオン界面活性剤、アミノ酸型又はベタイン型等の両性界面活性剤等が挙げられる。これらの界面活性剤は単独で用いてもよいし、また、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0226] 結合剤や粘着付与剤としては、例えばカルボキシメチルセルロースやその塩、デキストリン、水溶性デンプン、キサンタンガム、グアーガム、蔗糖、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリビニルアセテート、ポリアクリル酸ナトリウム、平均分子量6000～20000のポリエチレングリコール、平均分子量10万～500万のポリエチレンオキサイド、燐脂質（例えばセファリン、レシチン等）セルロース粉末、デキストリン、加工デンプン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、架橋ポリビニルピロリドン、マレイン酸とスチレン類の共重合体、（メタ）アクリル酸系共重合体、多価アルコールからなるポリマーとジカルボン酸無水物とのハーフエステル、ポリスチレンスルホン酸の水溶性塩、パラフィン、テルペン、ポリアミド樹脂、ポリアクリル酸塩、ポリオキシエチレン、ワックス、ポリビニルアルキルエーテル、アルキルフェノールホルマリン縮合物、合成樹脂エマルジョン等が挙げられる。

[0227] 増粘剤としては、例えばキサンタンガム、グアーガム、ダイユウタンガム、カルボキシメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、アクリル系ポリマー、デンプン化合物、多糖類のような水溶性高分子、高純度ベントナイト、フュームド シリカ(fumed silica, ホワイトカ

ーボン)のような無機微粉等が挙げられる。

[0228] 着色剤としては、例えば酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルーのような無機顔料、アリザリン染料、アゾ染料、金属フタロシアニン染料のような有機染料等が挙げられる。

[0229] 凍結防止剤としては、例えば、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類等が挙げられる。

[0230] 固結防止や崩壊促進のための補助剤としては、例えばデンプン、アルギン酸、マンノース、ガラクトース等の多糖類、ポリビニルピロリドン、フェュームド シリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)、エステルガム、石油樹脂、トリポリリン酸ナトリウム、ヘキサメタリン酸ナトリウム、ステアリン酸金属塩、セルロース粉末、デキストリン、メタクリル酸エステルの共重合体、ポリビニルピロリドン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、スルホン化スチレン・イソブチレン・無水マレイン酸共重合体、デンプン・ポリアクリロニトリルグラフト共重合体等が挙げられる。

[0231] 分解防止剤としては、例えばゼオライト、生石灰、酸化マグネシウムのような乾燥剤、フェノール化合物、アミン化合物、硫黄化合物、リン酸化合物等の酸化防止剤、サリチル酸化合物、ベンゾフェノン化合物等の紫外線吸収剤等が挙げられる。

[0232] 防腐剤としては、例えばソルビン酸カリウム、1, 2-ベンゾチアゾリン-3-オン等が挙げられる。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の補助剤も使用することができる。

[0233] 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、本発明の農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01～90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば、粉剤、粒剤、乳剤又は水和剤とする場合は0.01～50重量部（農園芸用殺虫剤全体の重量に対して0.01～50重

量%)が適当である。

[0234] 本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g~10kg、好ましくは0.01g~1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

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

[0235] かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤として例えば、

3,5-xylyl methylcarbamate(XMC)、*Bacillus thuringiensis aizawai*、*Bacillus thuringiensis israelensis*、*Bacillus thuringiensis japonensis*、*Bacillus thuringiensis kurstaki*、*Bacillus thuringiensis tenebrionis*等の*Bacillus thuringiensis*種が生成する結晶タンパク毒素、BPMC、Btトキシン系殺虫性化合物、CPCBS(chlorfenson)、DCIP(dichlorodiisopropyl ether)、D-D(1, 3-Dichloropropene)、DDT、NAC、0-4-dimethylsulfamoylphenyl 0, 0-diethyl phosphorothioate(DSP)、0-ethyl 0-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate(EPN)、tripropylisocyanurate (TPIC)、アクリナトリン(acrinathrin)、アザディラクチン(azadirachtin)、アジンホス・メチル(azinphos-methyl)、アセキノシル(acequinocyl)、アセタミプリド(acetamiprid)、アセトプロール(acetoprole)、アセフェート(acephate)、アバメクチン(abamectin)、アベルメクチン(avermectin-B)、アミドフルメット(amidoflumet)、アミトラズ(amitraz)、アラニカルブ(alanycarb)、アルジカルブ(aldicarb)、アルドキシカルブ(aldoxycarb)、アルドリリン(aldrin)、アルファーエンドスルファン(alpha-endosulfan)、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、

アルベンダゾール(albendazole)、アレスリン(allethrin)、イサゾホス(isaz ofos)、イサミドホス(isamidofos)、イソアミドホス(isoamidofos)、イソキサチオン(isoxathion)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロカルブ(isop rocarb: MIPC)、イベルメクチン(ivermectin)、イミシアホス(imicyafos)、イミダクロプリド(imidacloprid)、イミプロトリン(imiprothrin)、インドキサカルブ(indoxacarb)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、エチオン(ethion)、エチプロール(ethiprole)、エトキサゾール(etoxazole)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrifos)、エマメクチン(emamectin)、エマメクチンベンゾエート(emamectin-benzoate)、エンドスルフアン(endosulfan)、エンペントリン(empenthrin)、オキサミル(oxamyl)、オキシジメトン・メチル(oxydemeton-methyl)、オキシデプロホス(oxydeprofos: ESP)、オキシベンダゾール(oxibendazole)、オクスフェンダゾール(oxfendazole)、オレイン酸カリウム(Potassium oleate)、オレイン酸ナトリウム(sodium oleate)、カズサホス(cadusafos)、カルタップ(cartap)、カルバリル(carbaryl)、カルボスルフアン(carbosulfan)、カルボフラン(carbofuran)、ガンマシハロトリン(gamma-cyhalothrin)、キシリルカルブ(xylylcarb)、キナルホス(quinalphos)、キノプレン(kinoprene)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロエトカルブ(cloethocarb)、クロチアニジン(clothianidin)、クロフェンテジン(clofentazine)、クロマフェノジド(chromafenozide)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルジメホルム(chlordimeform)、クロルデン(chlordane)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クロルフェナピル(chlorphenapyr)、クロルフェンソン(chlorfenson)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、クロルベンジレート(chlorobenzilate)、クロロベンゾエート(chlorobenzoate)、ケルセン(ジコホル: dicofol)、サリチオン(salithion)、シアノホス(cyanophos: CYAP)、ジアフェンチウロン(diafenthiuron)、ジアミダホス(dia

midafos)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole) 、シーターシペルメトリン (theta-cypermethrin) 、ジエノクロル(dienochlor)、シエノピラフェン(cyenopyrafen)、ジオキサベンゾホス(dioxabenzofos)、ジオフェノラン(diofenolan)、シグマサイパーメトリン(sigma-cypermethrin)、ジクロフェンチオン(dichlofenthion: ECP)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、ジクロルボス(dichlorvos: DDVP)、ジスルホトン(disulfoton)、ジノテフラン(dinotefuran)、シハロトリン(cyhalothrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、ジフロビダジン (diflovidazin) 、シヘキサチン(cyhexatin)、シペルメトリン(cypermethrin)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメフルスリン (dimefluthrin) 、シラフルオフエン(silafluofen)、シロマジン(cyromazine)、スピネトラム(spinetoram)、スピノサッド(spinosad)、スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロテトラマト(spirotetramat)、スピロメシフェン(spiromesifen)、スルフルラミド(sulfluramid)、スルプロホス(sulprofos)、スルホキサフロール (sulfoxaflor) 、ゼーターシペルメトリン(zeta-cypermethrin)、ダイアジノン(diazinon)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、ダゾメット(dazomet)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオシクラム(thiocyclam)、チオスルタップ(thiosultap)、チオスルタップナトリウム (thiosultap-sodium) 、チオナジン(thionazin)、チオメトン(thiometon)、ディート (deet) 、ディルドリン(dieldrin)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、テトラジホン(tetradifon)、テトラメチルフルトリン (tetramethylfluthrin) 、テトラメトリン(tetramethrin)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テブフェノジド(tebufenozide)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、テフルトリン(tefluthrin)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、デメトン-S-メチル (demeton-S-methyl) 、デメホス(temephos)、デルタメトリン(deltamethrin)、テルブホス(terbufos)、トラロピリル(tralopyril)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリ

ン(transfluthrin)、トリアザメート(triazamate)、トリアズロン(triazuron)、トリクラミド(trichlamide)、トリクロルホン(trichlorphon: DEP)、トリフルムロン(triflumuron)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、ナレッド(naled: BRP)、ニチアジン(nithiazine)、ニテンピラム(nitenpyram)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、ハイドロプレネ(hydroprene)、バニリプロール(vaniliprole)、バミドチオン(vamidothion)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、ハルフエンプロックス(halfenprox)、ハロフェノジド(halofenozide)、ビストリフルロン(bis-trifluron)、ビスルタップ(bisultap)、ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、ヒドロキシプロピルデンプン(hydroxy propyl starch)、ビナパクリル(binapacryl)、ビフェナゼート(bifenazate)、ビフェントリン(bifenthrin)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピラクロホス(pyraclorfos)、ピラフルプロール(pyrafluprole)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、ピリダベン(pyridaben)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、ピリプロール(pyriprole)、ピリプロキシフェン(pyriproxifen)、ピリミカーブ(pirimicarb)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ピレトリン(pyrethrins)、フィプロニル(fipronil)、フェナザキン(fenazaquin)、フェナミフォス(fenamiphos)、フェニソブロモレート(phenisobromolate)、フェニトロチオン(fenitrothion: MEP)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノトリン(phenothrin)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェンスルフォチオン(fensulfothion)、フェンチオン(fenthion: MPP)、フェントエート(phenthoate: PAP)、フェンバレレート(fenvalerate)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンベンダゾール(fenbendazole)、フォスチアゼート(fosthiazate)、フォルメタネート(formetanate)、ブタチオホス(butathiofos)、ブプロフェジン(buprofezin)、フラチオカルブ(furathiocarb)、プラレトリン(prallethrin)、フルアクリピリム(flucrypyrim)、フルアジナム(fluzinam)、フルアズロン(fluzuron)、フルエンスルホン(fluensulf

one)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルバリネート(fluvalinate)、フルピラゾホス(flupyrzofos)、フルフェネリム(flufenerim)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、フルフェンジン(flufenzine)、フルフェンプロックス(flufenoprox)、フルプロキシフェン(fluproxyfen)、フルブロシスリネート(flubrocythrinate)、フルベンジアミド(flubendiamide)、フルメトリン(flumethrin)、フルリムフェン(flurimfen)、プロチオホス(prothiofos)、プロトリフェンブト(protrifenbute)、フロニカミド(flonicamid)、プロパホス(propaphos)、プロパルギット(propargite: BPPS)、プロフェノホス(profenofos)、プロフルスリン(profluthrin)、プロポキスル(propoxur: PHC)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)、ヘプテノホス(heptenophos)、ペルメトリン(permethrin)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンスルタップ(bensultap)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ホキシム(phoxim)、ホサロン(phosalone)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ホスチエタン(fosthietan)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホスホカルブ(phosphocarb)、ホスメット(phosmet: PMP)、ポリナクチン複合体(polynactins)、ホルメタネート(formetanate)、ホルモチオン(formothion)、ホレート(phorate)、マシン油(machine oil)、マラチオン(malathion)、ミルベマイシン(milbemycin)、ミルベマイシンA(milbemycin-A)、ミルベメクチン(milbemectin)、メカルバム(mecarbam)、メスルフエンホス(mesulfenfos)、メソミル(methomyl)、メタアルデヒド(metaldehyde)、メタフルミゾン(metaflumizone)、メタミドホス(methamidophos)、メタム・アンモニウム(metam-ammonium)、メタム・ナトリウム(metam-sodium)、メチオカルブ(methiocarb)、メチダチオン(methidathion: DMTP)、メチルイソチオシアネート(methylisothiocyanate)、メチルネオデカナミド(methylneodecanamide)、メチルパラチオン(methylparathion)、メトキサジアゾン(metoxadiazone)、メトキシクロル(methoxychlor)、メトキシフェノジド(methoxyfeno

zide)、メトフルトリン(metofluthrin)、メトプレン(methoprene)、メトルカルブ(metolcarb)、メルフルスリン (meperfluthrin) 、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、モノスルタップ(monosultap)、ラムダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、リアノジン (ryanodine) 、ルフエヌロン(lufenuron)、レスメトリン(resmethrin)、レピメクチン(lepimectin)、ロテノン(rotenone)、塩酸レバミゾール(levamisol hydrochloride)、酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)、酒石酸モランテル(morantel tartarate)、臭化メチル(methyl bromide)、水酸化トリシクロヘキシルスズ(cyhexatin)、石灰窒素(calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤(calcium polysulfide)、硫黄(sulfur)、及び硫酸ニコチン(nicotine-sulfate)等を例示することができる。

[0236] 同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤として例えば、アウレオフンギン (aureofungin) 、アザコナゾール (azaconazole) 、アジチラム (azithiram) 、アシペタックス (acypetacs) 、アシベンゾラル (acibenzolar) 、アシベンゾラル S メチル(acibenzolar-S-methyl) 、アゾキシストロビン (azoxystrobin) 、アニラジン (anilazine) 、アミスルブロム (amisulbrom) 、アムプロピルホス (ampropylfos) 、アメトクトラジン (ametoctradin) 、アリルアルコール (allyl alcohol) 、アルジモルフ (aldimorph) 、アンバム(amobam) 、イソチアニル (isotianil) 、イソバレジオン (isovalledione) 、イソピラザム (isopyrazam) 、イソプロチオラン (isoprothiolane) 、イプコナゾール (ipconazole) 、イプロジオン (iprodione) 、イプロバリカルブ (iprovalicarb) 、イプロベンホス (iprobenfos) 、イマザリル (imazalil) 、イミノクタジン (iminocladine) 、イミノクタジンアルベシル酸塩(iminocladine-albesilate) 、イミノクタジン酢酸塩(iminocladine-triacetate) 、イミベンコナゾール (imibenconazole) 、ウニコナゾール (uniconazole) 、ウニコナゾール P (uniconazole-P) 、エクロメゾール(echlomezole) 、エジフェンホス(edifenphos) 、エタコナゾール (etaconazole) 、エタボキサム (ethaboxam) 、エチリモール (ethirimol) 、エテム (etem) 、エトキシキン (et

hoxyquin)、エトリジアゾール(etridiazole)、エネストロブリン(enestroburin)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、オキサジキシル(oxadixyl)、オキシカルボキシン(oxycarboxin)、オキシキノリン銅(copper-8-quinolinolate)、オキシテトラサイクリン(oxytetracycline)、オキシ銅(copper-oxinate)、オキスポコナゾール(oxpoconazole)、オキスポコナゾールフマル酸塩(oxpoconazole-fumarate)、オキシリニック酸(oxolinic acid)、オクチリノン(octhilinone)、オフラセ(ofurace)、オリサストロビン(orysastrobin)、カーバム(metam-sodium)、カスガマイシン(kasugamycin)、カルバモルフ(carbamorph)、カルプロパミド(carpropamid)、カルベンダジム(carbendazim)、カルボキシン(carboxin)、カルボン(carvone)、キナザミド(quinazamid)、キナセトール(quinacetol)、キノキシフェン(quinoxifen)、キノメチオネート(quinomethionate)、キャプタホール(captafol)、キャプタン(captan)、キララキシル(kiralaxyl)、キンコナゾール(quinconazole)、キントゼン(quintozene)、グアザチン(guazatine)、クフラネブ(cufraneb)、クプロバム(cuprobam)、グリオジン(glyodin)、グリセオフルビン(griseofulvin)、クリムバゾール(climbazole)、クレゾール(cresol)、クレソキシムメチル(kresoxim-methyl)、クロゾリネート(chlozolate)、クロトリマゾール(clotrimazole)、クロベンチアゾン(chlobenthiazone)、クロラニホルメタン(chloraniformethan)、クロラニル(chloranil)、クロルキノックス(chlorquinox)、クロルピクリン(chloropicrin)、クロルフェナゾール(chlorfenazole)、クロロジニトロナフタレン(chlorodinitronaphthalene)、クロロタロニル(chlorothalonil)、クロロネブ(chloroneb)、ザリラミド(zarilamid)、サリチルアニリド(salicylanilide)、シアゾファミド(cyazofamid)、ジエチルピロパカーボナート(diethyl pyrocarbonate)、ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、シクラフラミド(cyclafuramid)、シクロシメット(diclocymet)、ジクロゾリン(dichlozoline)、ジクロブトラゾール(diclobutrazol)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)、シクロヘキシミド(cyclohexi

mide)、ジクロメジン (diclomezine)、ジクロラン (dicloran)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジクロン (dichlone)、ジスルフィラム (disulfiram)、ジタリムフォス (ditalimfos)、ジチアノン (dithianon)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジニコナゾールM (diniconazole-M)、ジネブ (zineb)、ジノカップ (dinocap)、ジノクトン (dinocton)、ジノスルホン (dinosulfon)、ジノテルボン (dinoterbon)、ジノブトン (dinobuton)、ジノペントン (dinopenton)、ジピリチオン (dipyrithione)、ジフェニルアミン (diphenylamine)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、ジフルメトリム (diflumetorim)、シプロコナゾール (cyproconazole)、シプロジニル (cyprodinil)、シプロフラム (cyprofuram)、シペンダゾール (cypendazole)、シメコナゾール (simeconazole)、ジメチリモール (dimethirimol)、ジメトモルフ (dimethomorph)、シモキサニル (cymoxanil)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、臭化メチル (methyl bromide)、ジラム (ziram)、シルチオフアム (silthiofam)、ストレプトマイシン (streptomycin)、スピロキサミン (spiroxamine)、スルトロペン (sultropen)、セダキサン (sedaxane)、ゾキサミド (zoxamide)、ダゾメット (dazomet)、チアジアジン (thiadiazin)、チアジニル (tiadinil)、チアジフルオル (thiadifluor)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオキシミド (tioxymid)、チオクロルフェンフィム (thiochlorfenphim)、チオファネート (thiophanate)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl)、チシオフエン (thicyofen)、チノキノックス (thioquinox)、キノメチオネート (chinomethionat)、チオフルザミド (thifluzamide)、チラム (thiram)、デカフェンチン (decafentin)、テクナゼン (tecnazene)、テクロフタラム (tecloftalam)、テコラム (tecoram)、テトラコナゾール (tetraconazole)、デバカルブ (debacarb)、デヒドロ酢酸 (dehydroacetic acid)、テブコナゾール (tebuconazole)、テブフロキン (tebufloquin)、ドジシン (dodicin)、ドジン (dodine)、ドデシルベンゼンスルホン酸ビスエチレンジアミン銅錯塩 (II) (DBEDC)、ドデモルフ (dodemor

ph)、ドラゾキシロン (drazoxolon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアズブチル (triazbutil)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリアミホス (triamiphos)、トリアリモール (tri arimol)、トリクラミド (trichlamide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリチコナゾール (triticonazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリブチルチンオキシド (tributyltin oxide)、トリフルミゾール (triflumi zole)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、トリホリン (trifor ine)、トリルフルアラニド (tolylfluanid)、トルクロホスメチル (tolclo fos-methyl)、ナタマイシン (natamycin)、ナバム (nabam)、ニトロタサルイソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ニトロスチレン (nitrostyrene)、ヌアリモール (nuarimol)、ノニルフエノールスルホン酸銅 (copper nonyl phenol sulfonate)、ハラクリネート (halacrinat)、バリダマイシン (va lidamycin)、バリフェナラート (valifenalate)、ハルピンタンパク (harpi n protein)、ビキサフェン (bixafen)、ピコキシストロビン (picoxystrob in)、ピコベンザミド (picobenzamide)、ビチオノール (bithionol)、ビテルタノール (bitertanol)、ヒドロキシイソキサゾール (hydroxyisoxazole)、ヒドロキシイソキサゾールカリウム (hydroisoxazole-potassium)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ピペラリン (piperalin)、ヒメキサゾール (hymexazol)、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、ピラカルボリド (pyracarbolid)、ピラクロストロビン (pyraclostrobi n)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、ピリオフェノン (pyriofenone)、ピリジニトリル (pyridinitril)、ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキシクロル (pyroxychlor)、ピロキシフル (pyro xyfur)、ピロキロン (pyroquilon)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ファモキサドン (famoxadone)、フェナパニル (fenapanil)、フェナミドン (fenamidone)、フェナミノスルフ (fenaminosulf)、フェナリモール (fenar imol)、フェニトロパン (fenitropan)、フェノキサニル (fenoxanil)、フ

エリムゾン (ferimzone)、フェルバム (ferbam)、フェンチン (fentin)、フェンピクロニル (fenpiclonil)、フェンピラザミン (fenpyrazamine)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フェンフラム (fenfuram)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フタリド (phthalide)、ブチオベート (buthiobate)、ブチルアミン (butylamine)、ブピリメート (bupirimate)、フベリダゾール (fuberidazole)、ブラストサイジンS (blasticidin-S)、フラメトピル (furametpyr)、フララキシル (furalaxyl)、フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルアジナム (fluazinam)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、フルオトリマゾール (fluotrimazole)、フルオピコリド (fluopicolide)、フルオピラム (fluopyram)、フルオロイミド (fluoroimide)、フルカルバニル (furcarbanil)、フルキサピロキサド (fluxapyroxad)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルコナゾール (furconazole)、フルコナゾール-シス (furconazole-cis)、フルジオキシソニル (fludioxonil)、フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルチアニル (flutianil)、フルトラニル (flutolanil)、フルトリアホル (flutriafol)、フルフラール (furfural)、フルメシクロックス (furmecyclox)、フルメットベル (flumetover)、フルモルフ (flumorph)、プロキナジド (proquinazid)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロチオカルブ (prothiocarb)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、プロパモカルブ (propamocarb)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、フロファネート (furophanate)、プロベナゾール (probenazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ヘキサクロロブタジエン (hexachlorobutadiene)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ヘキシルチオホス (hexylthiofos)、ベトキサジン (bethoxazin)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシルM (benalaxyl-M)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ベンキノックス (benquinox)、ペンコナゾール (penconazole)、ベンザ

モルフ (benzamorf)、ペンシクロン (pencycuron)、ベンゾヒドロキサム酸 (benzohydroxamic acid)、ベントルロン (bentaluron)、ベンチアゾール (benthiazole)、ベンチアバリカルブ-イソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl)、ペンチオピラド (penthioapyrad)、ペンフルフェン (penflufen)、ボスカリド (boscalid)、ホスジフェン (phosdiphen)、ホセチル (fosetyl)、ホセチルアルミニウム (fosetyl-Al)、ポリオキシシン (polyoxins)、ポリオキシリン (polyoxorim)、ポリカーバメート (polycarbamate)、ホルペット (folpet)、ホルムアルデヒド (formaldehyde)、マシン油 (machine oil)、マネブ (maneb)、マンコゼブ (mancozeb)、マンジプロパミド (mandipropamid)、ミクロゾリン (myclozolin)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ミルディオマイシン (mildiomycin)、ミルネブ (milneb)、メカルビンジド (mecarbinzid)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、メタゾキシロン (metazoxolon)、メタム (metam)、メタムナトリウム塩 (metam-sodium)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシルM (metalaxyl-M)、メチラム (metiram)、メチルイソチオシアナート (methyl isothiocyanate)、メチルジノカップ (mepthyldinocap)、メトコナゾール (metconazole)、メトスルホバックス (metsulfovax)、メトフロキサム (methfuroxam)、メトミノストロビン (metominostrobin)、メトラフェノン (metrafenone)、メパニピリム (mepanipyrim)、メフェノキサム (mefenoxam)、メプチルジノカップ (meptyldinocap)、メプロニル (mepronil)、メベニル (mebenil)、ヨウ

化メチル (iodomethane)、ラベンザゾール (rabenzazole)、塩化ベンザルコニウム (benzalkonium chloride)、塩基性塩化銅 (basic copper chloride)、塩基性硫酸銅 (basic copper sulfate)、金属銀 (silver) 等の無機殺菌剤、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、水酸化第二銅 (cupric hydroxide)、水和硫黄剤 (wetttable sulfur)、石灰硫黄合剤 (calcium polysulfide)、炭酸水素カリウム (potassium hydrogen carbonate)、炭酸水素ナトリウム (sodium hydrogen carbonate)、無機硫黄 (sulfur)、無水硫酸銅

(copper sulfate anhydride)、ジメチルジチオカルバミド酸ニッケル(nickel dimethyldithiocarbamate)、8-ヒドロキシキノリン銅(oxine copper)のような銅系化合物、硫酸亜鉛(zinc sulfate)、硫酸銅五水塩(copper sulfate pentahydrate)等を例示することができる。

[0237] 同様に除草剤として例えば、1-ナフチルアセトアミド、2, 4-PA、2, 3, 6-TB A、2, 4, 5-T、2, 4, 5-TB、2, 4-D、2, 4-DB、2, 4-DEB、2, 4-DEP、3, 4-DA、3, 4-DB、3, 4-DP、4-CPA、4-CPB、4-CPP、MCP、MCPA、MCPAチオエチル、MCPB、アイオキシニル(ioxynil)、アクロニフェン(aclonifen)、アザフェニジン(azafenidin)、アシフルオルフェン(acifluorfen)、アジプロトリン(aziprotrotryne)、アジムスルフロン(azimsulfuron)、アシュラム(asulam)、アセトクロール(acetochlor)、アトラジン(atrazine)、アトラトン(atraton)、アニスロン(anisuron)、アニロホス(anilofos)、アビグリシン(aviglycine)、アブシジン酸(abscisic acid)、アミカルバゾン(amicarbazone)、アミドスルフロン(amidosulfuron)、アミトロール(amtrole)、アミノシクロピラクロール(aminocyclopyrachlor)、アミノピラリド(aminopyralid)、アミブジン(amibuzin)、アミプロホスメチル(amiprophos-methyl)、アメトリジオン(ametridione)、アメトリン(ametryn)、アラクロール(alachlor)、アリドクロール(allidochlor)、アロキシジム(alloxydim)、アロラック(alorac)、イソウロン(isouron)、イソカルバミド(isocarbamid)、イソキサクロルトール(isoxachlortole)、イソキサピリホップ(isoxapyrifop)、イソキサフルトール(isoxaflutole)、イソキサベン(isoxaben)、イソシル(isocil)、イソノルロン(isonoruron)、イソプロツロン(isoproturon)、イソプロパリン(isopropalin)、イソポリナート(isopolinate)、イソメチオジン(isomethiozin)、イナベンフィド(inabنفide)、イパジン(ipazine)、イプフェンカルバゾン(ipfencarbazone)、イプリミダム(iprymidam)、イマザキン(imazaquin)、イマザピック(imazapic)、イマザピル(imazapyr)、イマザメタピル(imazamethapyr)、イマザメタベンズ(imazamethabenz)、イマザメタベンズメチル(imazamethabe

nz-methyl)、イマザモックス (imazamox)、イマゼタピル (imazethapyr)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、インダジフラム (indaziflam)、インダノファン (indanofan)、インドール酪酸(indolebutyric acid)、ウニコナゾール-P(uniconazole-P)、エグリナジン (eglinazine)、エスプロカルブ (esprocarb)、エタメスルフロン (ethametsulfuron)、エタメトスルフロンメチル(ethametsulfuron-methyl)、エタルフルラリン (ethalfluralin)、エチオレート (ethiolate)、エチクロゼート-エチル(ethychlozate ethyl)、エチジムロン (ethidimuron)、エチノフェン (etinofen)、エテホン(ethephon)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、エトキシフェン (ethoxyfen)、エトニプロミド (etnipromid)、エトフメセート (ethofumesate)、エトベンザニド (etobenzanid)、エプロナズ (epronaz)、エルボン (erbon)、エンドタール (endothal)、オキサジアゾン (oxadiazon)、オキサジアルギル (oxadiargyl)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、オキサピラゾン (oxapyrazon)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、オリザリン (oryzalin)、オルソスルファミロン (orthosulfamuron)、オルベンカルブ (orbencarb)、カフェンストロール (cafenstrole)、カムベンジクロール (cambendichlor)、カルバスラム (carbasulam)、カルフェントラゾン (carfentrazone)、カルフェントラゾン-エチル(carfentrazone-ethyl)、カルブチレート (karbutilate)、カルベタミド (carbetamide)、カルボキサゾール (carboxazole)、キザロホップ (quizalofop)、キザロホップ-P (quizalofop-P)、キザロホップ-エチル(quizalofop-ethyl)、キシラクロール (xylachlor)、キノクラミン (quinoclamine)、キノナミド (quinonamid)、キンクロラック (quinclorac)、キンメラック (quinmerac)、クミルロン (cumyluron)、クリオジネート (clodinate)、グリホサート(glyphosate)、グルホシネート (glufosinate)、グルホシネート-P (glufosinate-P)、クレダジン (credazine)、クレトジム (clethodim)、クロキシホナック(cloxyfonac)、クロジナホップ (clodinafop)、クロジナホップ-プロパルギル(clodinafop-propargyl)、クロトルロン (chlo

rotoluron)、クロピラリド (clopyralid)、クロプロキシジム (cloproxydim)、クロプロップ (cloprop)、クロブロムロン (chlorbromuron)、クロホップ (clofop)、クロマゾン (clomazone)、クロメトキシニル (chlomethoxynil)、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen)、クロメプロップ (clomeprop)、クロラジホップ (chlorazifop)、クロラジン (chlorazine)、クロラスラム (cloransulam)、クロラノクリル (chloranocryl)、クロラムベン (chloramben)、クロランスラム-メチル (cloransulam-methyl)、クロリダゾン (chloridazon)、クロリムロン (chlorimuron)、クロリムロン-エチル (chlorimuron-ethyl)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、クロルタル (chlorthal)、クロルチアミド (chlorthiamid)、クロルトルロン (chlortoluron)、クロルニトロフェン (chlornitrofen)、クロルフェナック (chlorfenac)、クロルフェンプロップ (chlorfenprop)、クロルブファム (chlorbufam)、クロルフルラゾール (chlorflurazole)、クロルフルレノール (chlorflurenol)、クロルプロカルブ (chlorprocarb)、クロルプロファム (chlorpropam)、クロルメコート (chlormequat)、クロレッツロン (chloreturon)、クロロキシニル (chloroxynil)、クロロクスロン (chloroxuron)、クロロポン (chloropon)、サフルフェナシル (saflufenacil)、シアナジン (cyanazine)、シアナトリン (cyanatryn)、ジアレート (di-allate)、ジウロン (diuron)、ジエタムコート (diethamquat)、ジカンバ (dicamba)、シクルロン (cycluron)、シクロエート (cycloate)、シクロキシジム (cycloxydim)、ジクロスラム (diclosulam)、シクロスルフアムロン (cyclosulfamuron)、ジクロプロップ (dichlorprop)、ジクロプロップ-P (dichlorprop-P)、ジクロベニル (dichlobenil)、ジクロホップ (diclofop)、ジクロホップメチル (diclofop-methyl)、ジクロメート (dichlormate)、ジクロラルウレア (dichloralurea)、ジクワット (diquat)、シサニリド (cisanilide)、ジスル (disul)、シズロン (siduron)、ジチオピル (dithiopyr)、ジニトラミン (dinitramine)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、ジノサム (dinosam)、シノスルフロン (cinosulfuron)、ジノセブ (dinoseb)、ジノテルブ

(dinoterb)、ジノフェナート (dinofenate)、ジノプロップ (dinoprop)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、ジフェナミド (diphenamid)、ジフェノクスロン (difenoxuron)、ジフェノペンテン (difenopenten)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、シブトリン (cybutryne)、シプラジン (cypazine)、シプラゾール (cyprazole)、ジフルフェニカン (diflufenican)、ジフルフェンゾピル (diflufenzopyr)、ジプロペトリン (dipropetryn)、シプロミド (cypromid)、シペルコート (cyperquat)、ジベレリン (gibberellin)、シマジン (simazine)、ジメキサノ (dimexano)、ジメタクロール (dimethachlor)、ジメダゾン (dimidazon)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジメテナミド (dimethenamid)、シメトリン (simetryn)、シメトン (simeton)、ジメピペレート (dimepiperate)、ジメフロン (dimefuron)、シンメチリン (cinmethylin)、スエップ (swep)、スルグリカピン (sulglycapin)、スルコトリオン (sulcotrione)、スルファレート (sulfallate)、スルフエントラゾン (sulfentrazone)、スルホスルフロン (sulfosulfuron)、スルホメツロン (sulfometuron)、スルホメツロンメチル (sulfometuron-methyl)、セクブメトン (secbumeton)、セトキシジム (sethoxydim)、セブチラジン (sebuthylazine)、ターバシル (terbacil)、ダイムロン (daimuron)、ダゾメット (dazomet)、ダラポン (dalapon)、チアザフルロン (thiazafluron)、チアゾピル (thiazopyr)、チエンカルバゾン (thiencarbazone)、チエンカルバゾンメチル (thiencarbazone-methyl)、チオカルバジル (tiocarbazil)、チオクロリム (tioclorim)、チオベンカルブ (thioben carb)、チジアジミン (thidiazimin)、チジアズロン (thidiazuron)、チフェンスルフロン (thifensulfuron)、チフェンスルフロンメチル (thifensulfuron-methyl)、デスメディファム (desmedipham)、デスメトリン (desmetryn)、テトラフルロン (tetrafluron)、テニルクロール (thenylchlor)、テブタム (tebutam)、テブチウロン (tebuthiuron)、テルブメトン (terbumeton)、テプラロキシジム (tepraloxymid)、テフリールトリオン (tefuryltrione)、テムボトリオン (tembotrione)、デラクロール (delachlor)、

テルバシル (terbacil)、テルブカルブ (terbucarb)、テルブクロール (terbuchlor)、テルブチラジン (terbuthylazine)、テルブトリン (terbutryn)、トプラメゾン (topramezone)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、トリアジフラム (triaziflam)、トリアスルフロン (triasulfuron)、トリアレート (tri-allate)、トリエタジン (trietazine)、トリカンバ (tricamba)、トリクロピル (triclopyr)、トリジファン (tridiphane)、トリタック (tritac)、トリトスルフロン (tritosulfuron)、トリフルスルフロン (triflusulfuron)、トリフルスルフロンメチル (triflusulfuron-methyl)、トリフルラリン (trifluralin)、トリフロキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリプロピندان (tripropindan)、トリベニューロンメチル (tribenuron-methyl)、トリベヌロン (tribenuron)、トリホップ (trifop)、トリホプシメ (trifopsime)、トリメツロン (trimeturon)、ナプタラム (naptalam)、ナプロアニリド (naproanilide)、ナプロパミド (napropamide)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、ニトラリン (nitralin)、ニトロフェン (nitrofen)、ニトロフルオルフェン (nitrofluorfen)、ニピラクロフェン (nipyraclufen)、ネブロン (neburon)、ノルフルラゾン (norflurazon)、ノルロン (noruron)、バーバン (barban)、パクロブトラゾール (paclobutrazol)、パラコート (paraquat)、パラフルロン (parafluron)、ハロキシジン (haloxydine)、ハロキシホップ (haloxyfop)、ハロキシホップ-P (haloxyfop-P)、ハロキシホップメチル (haloxyfop-methyl)、ハロサフェン (halosafen)、ハロスルフロン (halosulfuron)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl)、ピクロラム (picloram)、ピコリナフェン (picolinafen)、ビスクロピロン (bicyclopyrone)、ビスピリバック (bispyribac)、ビスピリバックナトリウム (bispyribac-sodium)、ピダノン (pydanon)、ピノキサデン (pinoxaden)、ビフェノックス (bifenox)、ピペロホス (piperophos)、ヒメキサゾール (hymexazol)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピラスルホトール (pyrasulfotole)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ピラゾスルフロン (pyrazosulfuron)、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl)

l)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラナホス (bilanafos)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl)、ピリクロール (pyriclor)、ピリダホル (pyridafol)、ピリチオバック (pyrithiobac)、ピリチオバックナトリウム (pyrithiobac-sodium)、ピリデート (pyridate)、ピリフタリド (pyrif talid)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリベンゾキシム (pyribenzox im)、ピリミスルファン (pyrimisulfan)、ピリミスルフロン (primisulfur on)、ピリミノバックメチル (pyriminobac-methyl)、ピロキサスルホン (p yroxasulfone)、ピロクスラム (pyroxsulam)、フェナスラム (fenasulam)、フェニソファム (phenisopham)、フェヌロン (fenuron)、フェノキサスルホン (fenoxasulfone)、フェノキサプロップ (fenoxaprop)、フェノキサプロップ-P (fenoxaprop-P)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethy l)、フェノチオール (phenothiol)、フェノプロップ (fenoprop)、フェノベ ンズロン (phenobenzuron)、フェンチアプロップ (fenthia prop)、フェン テラコ

ール (fenteracol)、フェントラザミド (fentrazamide)、フェンメディフ アム (phenmedipham)、フェンメディファムエチル (phenmedipham-ethyl)、ブタクロール (butachlor)、ブタフェナシル (butafenacil)、ブタミホ ス (butamifos)、ブチウロン (buthiuron)、ブチダゾール (buthidazole)、ブチレート (butylate)、ブツロン (buturon)、ブテナクロール (butena chlor)、ブトキシジム (butoxydim)、ブトラリン (butralin)、フラザス ルフロン (flazasulfuron)、フラムプロップ (flamprop)、フリロオキシフ ェン (furyloxyfen)、プリナクロール (prynachlor)、プリミスルフロンメ チル (primisulfuron-methyl)、フルアジホップ (fluazifop)、フルアジホッ プ-P (fluazifop-P)、フルアジホップブチル (fluazifop-butyl)、フルアゾ レート (fluazolate)、フルロキシピル (fluroxypyr)、フルオチウロン (f luothiuron)、フルオメツロン (fluometuron)、フルオログリコフェン (fluo roglycofen)、フルロクロリドン (flurochloridone)、フルオロジフェン (fluorodifen)、フルオロニトロフェン (fluoronitrofen)、フルオロミジン

(fluoromidine)、フルカルバゾン (flucarbazon)、フルカルバゾンナトリウム (flucarbazon-sodium)、フルクロラリン (fluchloralin)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron)、フルチアセット (fluthiacet)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl)、フルピルスルフロン (flupyrsulfuron)、フルフェナセット (flufenacet)、フルフェニカン (flufenican)、フルフェンピル (flufenpyr)、フルプロパシル (flupropacil)、フルプロパナート (flupropanate)、フルポキサム (flupoxam)、フルミオキサジン (flumioxazin)、フルミクロラック (flumiclorac)、フルミクロラックペンチル (flumiclorac-pentyl)、フルミプロピン (flumipropyn)、フルメジン (flumezin)、フルオメツロン (fluometuron)、フルメトスラム (flumetsulam)、フルリドン (fluridone)、フルルタモン (flurtamone)、フルロキシピル (fluroxypyr)、プレチラクロール (pretilachlor)、プロキサナ (proxan)、プログリナジン (proglinazine)、プロシアジン (procyazine)、プロジアミン (prodiamine)、プロスルファリン (prosulfalin)、プロスルフロン (prosulfuron)、プロスルホカルブ (prosulfocarb)、プロパキザホップ (propaquizafop)、プロパクロール (propachlor)、プロパジン (propazine)、プロパニル (propanil)、プロピザミド (propyzamide)、プロピソクロール (propisochlor)、プロヒドロジャスモン (prohydrojasmon)、プロピリスルフロン (propyrisulfuron)、プロファム (propham)、プロフルアゾール (profluazol)、プロフルラリン (profluralin)、プロヘキサジオンカルシウム (prohexadione-calcium)、プロポキシカルバゾン (propoxycarbazon)、プロポキシカルバゾンナトリウム (propoxycarbazon-sodium)、プロホキシジム (profoxydim)、ブロマシル (bromacil)、ブロムピラゾン (brompyrazon)、プロメトリン (prometryn)、プロメトン (prometon)、ブロモキシニル (bromoxynil)、ブロモフェノキシム (bromofenoxim)、ブロモブチド (bromobutide)、ブロモボニル (bromobonil)、フロラスラム (florasulam)、ヘキサクロロアセトン (hexachloroacetone)、ヘキサジノン (hexazinone)、ペトキサミド (pethoxamid)、ベナゾリン (benazolin)、ペノクスラ

ム (penoxsulam)、ペブレート (pebulate)、ベフルブタミド (beflubutamid)、ベルノレート (vernolate)、ペルフルイドン (perfluidone)、ベンカルバゾン (bencarbazon)、ベンザドックス (benzadox)、ベンジプラム (benzipram)、ベンジルアミノプリン (benzylaminopurine)、ベンズチアズロン (benzthiazuron)、ベンズフェンジゾン (benzfendizone)、ベンスリド (bensulide)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、ベンゾイルプロップ (benzoylprop)、ベンゾビスクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ベンゾフルオール (benzofluor)、ベントゾン (bentazon)、ペンタノクロール (pentanochlor)、ベンチオカーブ (benthiocarb)、ペンディメタリン (pendimethalin)、ペントキサゾン (pentoxazon)、ベンフラリン (benfluralin)、ベンフレセート (benfuresate)、ホサミン (fosamine)、ホメサフェン (fomesafen)、ホラムスルフロン (foramsulfuron)、ホルクロルフエニユロン (forchlorfenuron)、マレイン酸ヒドラジド (maleic hydrazide)、メコプロップ (mecoprop)、メコプロップ-P (mecoprop-P)、メジノテルブ (medinoterb)、メソスルフロン (mesosulfuron)、メソスルフロンメチル (mesosulfuron-methyl)、メソトリオン (mesotrione)、メソプラジン (mesoprazine)、メソプロトリン (methoprotryne)、メタザクロール (metazachlor)、メタゾール (methazole)、メタゾスルフロン (metazosulfuron)、メタベンズチアズロン (methabenzthiazuron)、メタミトロン (metamiton)、メタミホップ (metamifop)、メタム (metam)、メタルプロパリン (methalpropalin)、メチウロン (methiuron)、メチオゾリン (methiozolin)、メチオベンカルブ (methiobencarb)、メチルダイムロン (methyldymron)、メトクスロン (metoxuron)、メトスラム (metosulam)、メトスルフロン (metsulfuron)、メトスルフロンメチル (metsulfuron-methyl)、メトフラゾン (metflurazon)、メトブロムロン (metobromuron)、メトベンズロン (metobenzuron)、メトメトン (methometon)、メトラクロール (metolachlor)、メトリブジン (metribuzin)、メピコートクロリド (mepiquat-chloride)、メフェナセツト (mefenacet)、メフルイジド (meflu

idide)、モナリド (monalide)、モニソウロン (monisouron)、モニュヌロン (monuron)、モノクロル酢酸 (monochloroacetic acid)、モノリニュロン (monolinuron)、モリネート (molinate)、モルフアムコート (morfamquat)、ヨードスルフロン (iodosulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム (iodosulfuron-methyl-sodium)、ヨードボニル (iodobonil)、ヨードメタン (iodomethane)、ラクトフェン (lactofen)、リヌロン (linuron)、リムスルフロン (rimsulfuron)、レナシル (lenacil)、ローデタニル (rhodethanil)、過酸化カルシウム (calcium peroxide)、臭化メチル (methyl bromide) 等を例示することができる。

[0238] また、生物農薬として例えば、核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus、NPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ボックスウイルス (Entomopoxi virus、EPV) 等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトパガム (Monacrosporium phymatophagum)、スタイナーネマ・カーポカプサエ (Steinernema carpocapsae)、スタイナーネマ・クシダエ (Steinernema kushidai)、パスツールシア・ペネトランス (Pasteuria penetrans) 等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウム・ラジオブクター (Agrobacterium radiobactor)、非病原性エルビニア・カロトボーラ (Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (Xanthomonas campestris) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

[0239] 更に、生物農薬として例えば、オンシツツヤコバチ (Encarsia formosa)、コレマンアブラバチ (Aphidius colemani)、ショクガタマバエ (Aphidolestes aphidimyza)、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea)、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica)、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis)、ククメリスカブリダニ (Amblyseius cucumeris)、ナミヒメハナカメムシ

(*Orius sauteri*) 等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (*Beauveria brongniartii*) 等の微生物農薬、(Z)-10-テトラデセニル=アセタート、(E, Z)-4, 10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z)-8-ドデセニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、14-メチル-1-オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

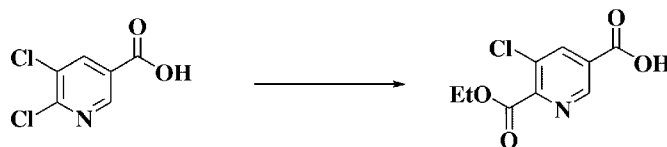
[0240] 以下に本発明の代表的な化合物、及び製造中間体の製造例によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

参考例

[0241] 中間体(2)の製造例

5-クロロ-6-エトキシカルボニルニコチン酸の製造方法

[化28]

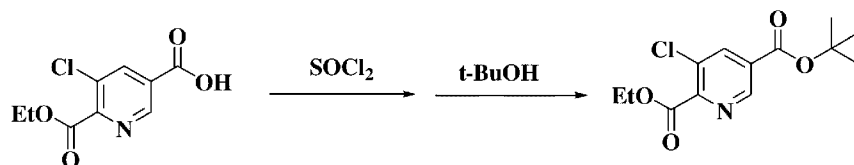


オートクレーブ中、5,6-ジクロロニコチン酸(10 g, 52 mmol)のエタノール(60 mL)溶液にDPPB (1,4-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタン) (2.2 g, 10 mol%)、トリエチルアミン(14 g, 2.5 eq.)、 $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ (911 mg, 2.5 mol%)を加え、反応系を一酸化炭素置換し(CO圧、4.0MPa)、135℃で4時間撹拌した。反応混合物に水、3 N塩酸を加えて水層を酸性にした後に、酢酸エチルで数回抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後に濃縮し、得られた固体をヘキサン-酢酸エチル=2:1 (v/v)の溶液で洗い、目的の5-クロロ-6-エトキシカルボニルニコチン酸(10.9 g, 76%)を得た。

物性： $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 9.02 (d, 1H)、8.44 (d, 1H)、4.42 (dd, 2H)、1.33 (t, 3H)

[0242] 5-クロロ-6-エトキシカルボニルニコチン酸 t-ブチルエステルの製造方法

[化29]

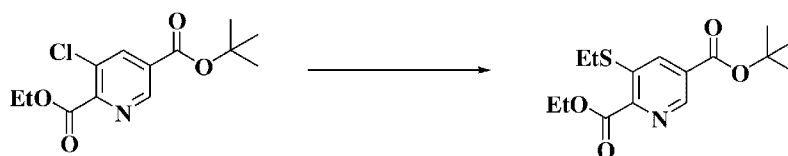


前工程で得られた5-クロロ-6-エトキシカルボニルニコチン酸 (10.9 g, 47.6 mmol) をトルエン (30 mL) に溶解し、DMF (N,N-ジメチルホルムアミド) (4 mL) を加えた。続いて、塩化チオニル (11 g, 2 eq.) を加え、90℃で3時間加熱撹拌した。反応溶液を室温に戻し、濃縮した。別の容器に t - ブタノール (35 mL, 10 当量)、THF (テトラヒドロフラン) (100 mL)、ジイソプロピルエチルアミン (50 mL, 7 eq.)、DMA P (N,N-ジメチル-4-アミノピリジン) (6 g, 1 当量) の混合溶液に氷冷下、上述した濃縮残渣をゆっくりと加えた。反応混合物を3時間加熱還流し、室温まで冷却後、水、酢酸エチルを加えて数回抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル = 5 : 1 (v/v)) に付し、目的の5-クロロ-6-エトキシカルボニルニコチン酸 t - ブチルエステル (8.43 g, 62%) を得た。

物性： ^1H -NMR (CDCl_3) : 9.05 (d, 1H)、8.30 (d, 1H)、4.50 (dd, 2H)、1.61 (s, 9H)、1.44 (t, 3H)

[0243] 5-エチルチオ-6-エトキシカルボニルニコチン酸 t-ブチルエステルの製造方法

[化30]



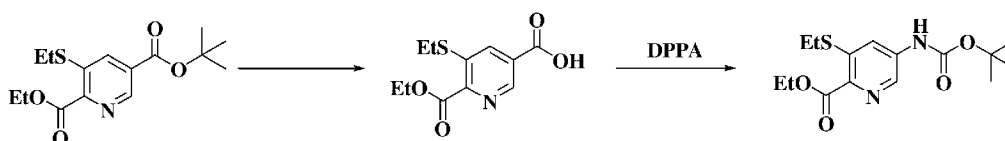
5-クロロ-6-エトキシカルボニルニコチン酸 t-ブチルエステル (8.43 g, 21.65 mmol) を DMF (100 mL) に溶解した。氷冷下、ナトリウムエタンチオレート (2.27 g, 1 当量) をゆっくりと加え、5分撹拌した後、水を加え、続

けて0.5 N塩酸を加えた。酢酸エチルで数回抽出した後、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン-AcOEt = 5 : 1 (v/v))に付し、目的の5-エチルチオ-6-エトキシカルボニルニコチン酸 t-ブチルエステル (6.17 g, 92%)を得た。

物性：¹H-NMR(CDCI₃): 8.91 (d、1H)、8.22 (d、1H)、4.49 (dd、2H)、2.99 (dd、2H)、1.61 (s、9H)、1.45 (t、3H)、1.40 (t、3H)

[0244] 3-エチルチオ-5-t-ブトキシカルボニルアミノピコリン酸 エチルエステルの製造方法

[化31]

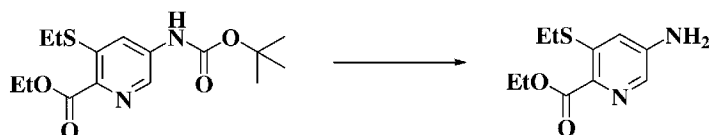


5-エチルチオ-6-エトキシカルボニルニコチン酸 t-ブチルエステル (6.17 g, 19.9 mmol)をトリフルオロ酢酸 (30 mL)に溶解し、30分間加熱還流した。反応溶液を濃縮し、トルエン及び酢酸エチルを加え、再度濃縮した。残渣にt-ブタノール(100 mL)、トリエチルアミン(6.5 g, 3 eq.)、ジフェニルリン酸アジド (DPPA) (11.74 g, 2 eq.)を加え、室温で1時間攪拌した後4時間還流した。反応溶液を濃縮し、カラムクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル=2 : 1(v/v)) に付し、目的の3-エチルチオ-5-t-ブトキシカルボニルアミノピコリン酸 エチルエステル (3.63 g, 56%)を得た。

物性：¹H-NMR(CDCI₃): 8.25 (d、1H)、8.09 (d、1H)、6.74 (s、1H)、4.46 (dd、2H)、2.97 (dd、2H)、1.53 (s、9H)、1.44 (t、3H)、1.41 (t、3H)

[0245] 5-アミノ-3-エチルチオピコリン酸 エチルエステルの製造方法

[化32]

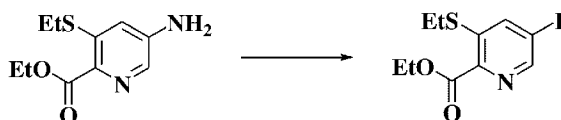


3-エチルチオ-5-*t*-ブトキシカルボニルアミノピコリン酸 エチルエステル (670 mg, 2.06 mmol) をトリフルオロ酢酸 (30 mL) に溶解し、30分間室温で撹拌した。反応溶液を濃縮し、水及び酢酸エチル、炭酸カリウムを加えた。酢酸エチルで数回抽出した後、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィー(ヘキサン-*AcOEt* = 1 : 3(v/v))に付し、目的の5-アミノ-3-エチルチオピコリン酸 エチルエステル (358 mg, 77%) を得た。

物性：¹H-NMR(CDCl₃) : 7.89 (d, 1H)、6.80 (s, 1H)、4.43 (dd, 2H)、4.08 (s, 2H)、2.88 (dd, 2H)、1.56 (s, 9H)、1.42 (t, 3H)、1.40 (t, 3H)

[0246] 3-エチルチオ-5-ヨードピコリン酸 エチルエステルの製造方法

[化33]



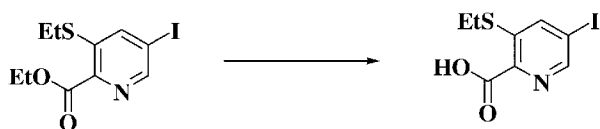
5-アミノ-3-エチルチオピコリン酸 エチルエステル (1 g, 4.44 mmol) をアセトニトリル (10 mL) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (500mg, 1当量) 及び *p*-トルエンスルホン酸 (2.6 g, 3 当量) を加え、5℃程度の水浴で冷却した。別の容器に調整したヨウ化カリウム (2.25 g, 3 当量) と亜硝酸ナトリウム (612 mg, 2 eq.) の水溶液 (10 mL) を前述した反応液にゆっくりと加えた。そのまま30分撹拌し、さらに室温で30分撹拌した。反応溶液にハイポ水を加え、酢酸エチルで数回抽出した後に有機層を乾燥、濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的の3-エチルチオ-5-ヨードピコリン

酸 エチルエステル (761 mg, 51%) を得た。

物性: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8.61 (s, 1H)、7.95 (s, 1H)、4.45 (dd, 2H)、2.91 (dd, 2H)、1.43 (t, 3H)、1.39 (t, 3H)

[0247] 3-エチルチオ-5-ヨードピコリン酸の製造方法

[化34]

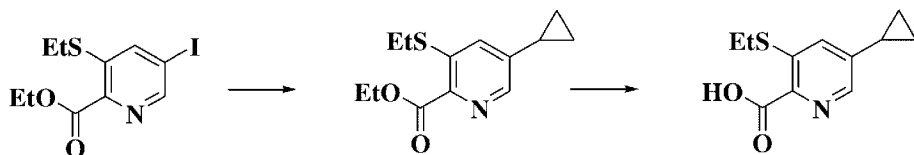


3-エチルチオ-5-ヨード-2-ピリジンカルボン酸 エチルエステル (761 mg, 2.26 mmol) をエタノール (5 mL) に溶解し、3M水酸化ナトリウム水溶液 (1.2 mL, 1.5 eq.) を加えた。室温で5分攪拌し、水及び3N塩酸を加えた。酢酸エチルで数回抽出した後有機層を乾燥、濃縮し、目的の3-エチルチオ-5-ヨードピコリン酸を定量的な収率で得た。

物性: $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 13.30 (br s, 1H)、8.60 (d, 1H)、8.16 (d, 1H)、3.00 (dd, 2H)、1.24 (t, 3H)

[0248] 3-エチルチオ-5-シクロプロピルピコリン酸の製造方法

[化35]



3-エチルチオ-5-ヨードピコリン酸 エチルエステル (2 g, 5.9 mmol)、シクロプロピルボロン酸 (1.0 g, 2当量)、リン酸カリウム (トリベーシック) (6.3 g, 5当量)、 PdCl_2 (dppf) アセトンコンプレックス (1.0 g, 0.2当量) をトルエン (40 mL) と水 (10 mL) の混合溶媒に溶解し、2時間加熱還流した。冷却後、1N HCl でクエンチし、酢酸エチルで抽出後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮し

て得られる残渣をカラムクロマトグラフィーで精製し、3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピコリン酸エチルエステルを得た (1.32 g, 89%)。

^1H -NMR; 8.19 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 4.46 (q, 2H), 2.92 (q, 2H), 1.97-1.90 (m, 1H), 1.46-1.37 (m, 6H), 1.13-1.10 (m, 2H), 0.82-0.78 (m, 2H)

[0249] 同様にメチルエステル体、イソプロピルエステル体、ノルマルブチルエステル体、アミド体、メチルアミド体を合成した。

[0250] メチルエステル体

^1H -NMR; 8.18 (d, 1H), 7.263 (s, 1H), 3.99 (s, 3H), 3.93 (2H, q), 1.97-1.92 (m, 1H), 1.39 (t, 3H), 1.17-1.12 (m, 2H), 0.84-0.80 (m, 2H)

[0251] イソプロピルエステル体

^1H -NMR; 8.20 (d, 2H), 2.27 (d, 2H), 5.33 (m, 1H), 2.97-2.89 (m, 2H), 1.96-1.91 (m, 1H), 1.45-1.37 (m, 9H), 1.14-1.10 (m, 2H), 0.92-0.82 (m, 2H)

[0252] ノルマルブチルエステル体

^1H -NMR; 8.19 (d, 2H), 7.27 (d, 1H), 4.40 (t, 2H), 2.92 (q, 2H), 1.94-1.91 (m, 1H), 1.82-1.77 (m, 2H), 1.46-1.39 (m, 5H), 1.15-1.10 (m, 2H), 0.98 (t, 3H), 0.83-0.78 (m, 2H)

[0253] アミド体

^1H -NMR; 8.00 (d, 1H), 7.77 (brs, 1H), 5.41 (brs, 1H), 2.90 (q, 2H), 1.944 (m, 1H), 1.41 (t, 3H), 1.13-1.11 (m, 2H), 0.81-0.80 (m, 2H)

[0254] メチルアミド体

^1H -NMR; 7.97 (d, 2H), 7.92 (brs, 1H), 7.23 (s, 2H), 3.00 (d, 3H), 2.88 (q, 2H), 1.96-1.89 (m, 1H), 1.39 (t, 3H), 1.12-1.08 (m, 2H), 0.81-0.77 (m, 2H)

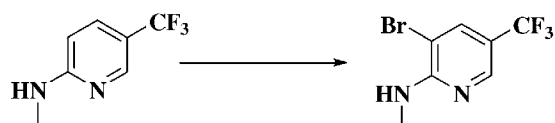
[0255] 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピコリン酸エチルエステル (1.12 g,

4.5 mmol) をエタノール (10 mL) に溶解し、15%NaOH水溶液 (2.4 g, 2eq) を添加した。室温で3時間攪拌後エタノールを留去し、水を加えて残渣を完全に溶解し、1N HClを滴下し、pH3~4に調製した。生じた固体をろ取し、酢酸エチルに溶解して無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して3-エチルチオ-5-シクロプロピルピコリン酸を得た (0.91g, 91%)。

$^1\text{H-NMR}$; 8.01 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 2.95 (q, 2H), 2.00-1.94 (m, 1H), 1.42 (t, 3H), 1.21-1.16 (m, 2H), 0.87-0.84 (m, 2H)

[0256] 中間体 (3) の製造例

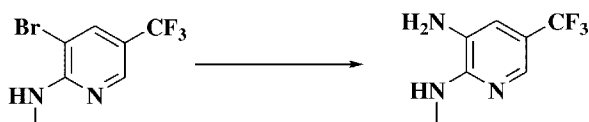
[化36]



N-メチルー (5-トリフルオロメチルーピリジン-2-イル) -アミン 3.48 g および DMF 20 mL の混合物に、N-ブロモスクシンイミド 4.27 g を加え、室温で1時間攪拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N-メチルー (3-ブロモ-5-トリフルオロメチルーピリジン-2-イル) -アミン 4.8 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 3.08 (3H, d), 5.40 (1H, br s), 7.78 (1H, d), 8.34 (1H, s).

[0257] [化37]

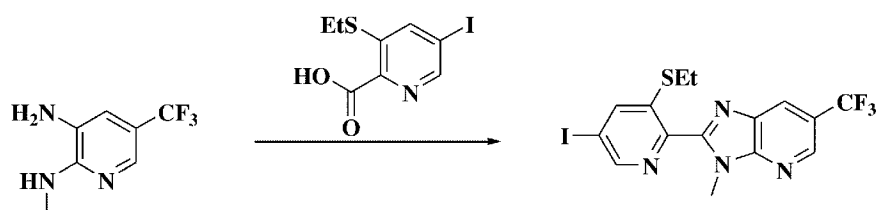


耐圧反応容器に、N-メチルー (3-ブロモ-5-トリフルオロメチルーピリジン-2-イル) -アミン 0.51 g、アセチルアセトン銅 (I) 0.11 g、アセチルアセトン 0.20 g、炭酸セシウム 1.30 g、NMP (N-メチルピロリドン) 2 mL および 28% アンモニア水 1 mL を加え、1

20℃で7時間および130℃で3時間攪拌した。室温まで放冷した後に飽和塩化アンモニウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、N²-メチル-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミン0.28gを得た。

[0258] 参考例 1

2-(3-エチルチオ-5-ヨードピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンの製造
[化38]



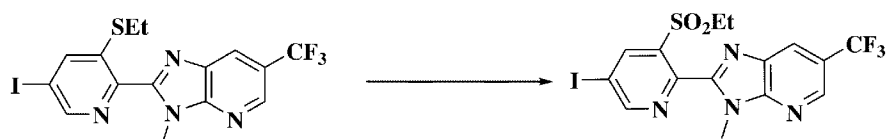
ピリジンカルボン酸 (856 mg, 2.8 mmol) と 3-アミノ-2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルピリジン (690mg) を THF (5 mL) に溶解し、トリエチルアミン (1 mL)、4-ジメチルアミノピリジン (683mg) 及び 1-メチル-2-クロロピリジニウムヨード (1.1 g) を順次加えた。反応溶液を室温で 30 分攪拌した後に、3 時間加熱還流した。室温まで冷却した後に水を加え、酢酸エチルで数回抽出した後に有機層を乾燥、濃縮した。得られた残渣を NMP (5 mL) に溶解し、p-トルエンスルホン酸 (1.5 g) を加え、150℃で 1 時間攪拌した。反応容器を室温まで冷却し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的のイミダゾピリジン (411 mg, 32%, mp: 89–90℃) を得た。

[0259] 同様な方法にて、2-(3-エチルチオ-5-ヨードピリジン-2-イル)-3-メチル-6-テトラフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンを合成した (mp: 110–112℃)。

[0260] 参考例 2

2-(3-エチルスルホニル-5-ヨードピリジン-2-イル)-3-メチ

ル - 6 - トリフルオロメチル-3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジンの製造
[化39]



前記反応で得られたイミダゾピリジン (361 mg, 0.776 mmol) を酢酸エチル (5 mL) に溶解し、メタクロロ過安息香酸 (455 mg) を加え、室温で2時間攪拌した。反応溶液にFAMS0 (メチル(メチルスルフィニル)メチルスルフィド) 数滴及びトリエチルアミン (1 mL) を加え、濃縮したのちにカラムクロマトグラフィーに付し、目的のスルホン体 (378 mg, 98%, mp : 174 – 175 °C) を得た。

[0261] 同様な方法にて、2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - ヨードピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - テトラフルオロエチル-3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジンを合成した (mp : 138 – 140 °C)。

[0262] 実施例 1

2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル-3 H - イミダゾ [4, 5 - C] ピリジン (化合物番号 1 - 15) の製造

[化40]

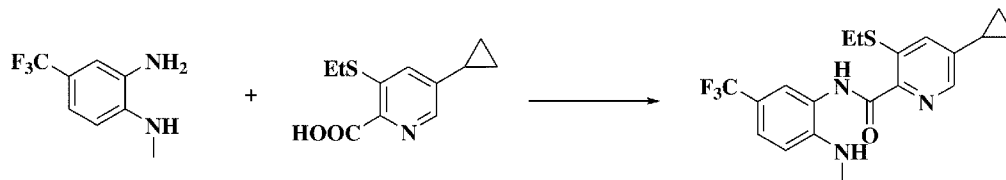


前記反応で得られたスルホン体 (110 mg, 0.22 mmol)、シクロプロピル環状トリオールボレートナトリウム (127 mg) をDMF (2 mL) に溶解し、水 (400 μL) を加えた。アルゴン下、ジクロロジフェニルホスフィノフェロセンパラジウム (18mg) を加え、100°Cで1時間加熱攪拌した。反応溶液を室温まで冷却後、濃縮し、カラムクロマトグラフィーに付し、目的のシクロプロパン体 (75 mg, 82%) を得た。

[0263] 参考例 3

N - (5 - トリフルオロメチル - 2 - アミノメチルフェニル) - 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピル - ピコリン酸アミドの製造

[化41]

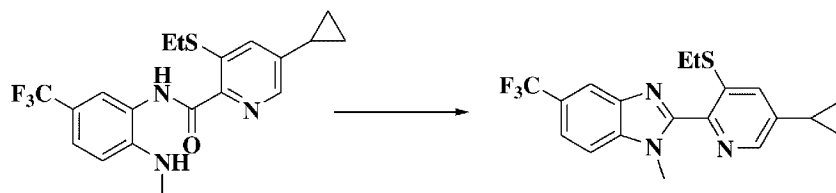


3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピコリン酸 (2 3 0 m g) をピリジン (2 m L) に溶かし、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール (1 3 m g , 0 . 1 当量) と E D C (1 - エチル - 3 - (3 - ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩) (4 0 0 m g , 2 . 0 当量) を加えた。室温で 1 0 分間撹拌した後、2 - メチルアミノ - 6 - トリフルオロメチルアニリン (2 0 0 m g , 1 . 0 当量) を加え、さらに 2 . 5 時間撹拌した。その後、塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、溶媒を減圧下留去し、N - (5 - トリフルオロメチル - 2 - アミノメチルフェニル) - 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピル - ピコリン酸アミド (4 7 0 m g , 定量的) を得た。

[0264] 製造例 1

2 - (3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 1 - メチル - 5 - トリフルオロメチル - 1 H - ベンゾイミダゾールの製法 (化合物番号 7 - 1 3)

[化42]



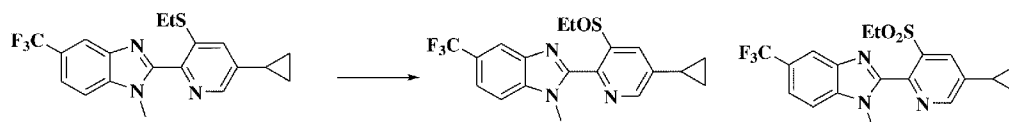
N - (5 - トリフルオロメチル - 2 - アミノメチルフェニル) - 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピル - ピコリン酸アミド (4 7 0 m g) をトルエ

ン（１．５ ｍＬ）に溶かし、酢酸（１．５ ｍＬ）を加えた。１００℃で１．５ 時間撹拌した。ＴＬＣで原料の消失を確認し、水を加えて酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加えて脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製し、２－（３－エチルチオ－５－シクロプロピルピリジン－２－イル）－１－メチル－５－トリフルオロメチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール（３９５ ｍｇ，８１％）を得た。

[0265] 製造例 2

２－（３－エチルスルフィニル－５－シクロプロピルピリジン－２－イル）－１－メチル－５－トリフルオロメチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール（化合物番号 7－14）、及び ２－（３－エチルスルホニル－５－シクロプロピルピリジン－２－イル）－１－メチル－５－トリフルオロメチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール（化合物番号 7－15）の製造

[化43]

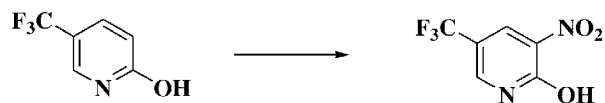


２－（３－エチルチオ－５－シクロプロピルピリジン－２－イル）－１－メチル－５－トリフルオロメチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール（１９０ ｍｇ）を酢酸エチル（２ ｍＬ）に溶かし、*m*-CPBA（メタクロロ過安息香酸）（１８５ ｍｇ，１．５ 当量）を加えた。室温で１ 時間撹拌した。ＴＬＣで原料の消失を確認し、チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加えて脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製し、２－（３－エチルスルフィニル－５－シクロプロピルピリジン－２－イル）－１－メチル－５－トリフルオロメチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール（５５ ｍｇ，３０％）、２－（３－エチルスルホニル－５－シクロプロピルピリジン－２－イル）－１－メチル－５－トリフルオロメチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール（８４ ｍｇ，４５％）を得た。

[0266] 参考例 4

5 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - ニトロ - 2 - オールの製造

[化44]



5 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - オール (500 mg) を硫酸 (6 mL) に溶かし、氷冷しながら硝酸を加えた。室温に昇温し、1.5 時間攪拌した後、70 °C に加熱して4 時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加え脱水、溶媒留去することで5 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - ニトロ - 2 - オール (426 mg、純度約50%) を得た。

[0267] 参考例 5

3 - アミノ - 5 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - オールの製造

[化45]

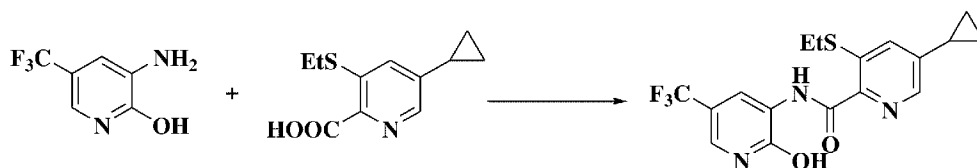


5 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - ニトロ - 2 - オール (420 mg) をエタノール (4 mL) に溶解し、水 (1 mL) に溶かした塩化アンモニウム (110 mg, 1.0 当量) を加えた。室温で攪拌しながら、鉄粉 (560 mg, 5.0 当量) を加え、加熱還流条件で1.5 時間攪拌した。原料の消失を確認し、セライト濾過により金属等を除去した。溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製した。3 - アミノ - 5 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - オール (102 mg, 19%) を得た。

[0268] 参考例 6

N - (5 - トリフルオロメチル - 2 - ヒドロキシピリジン - 3 - イル) - 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピル - ピコリン酸アミドの製法

[化46]

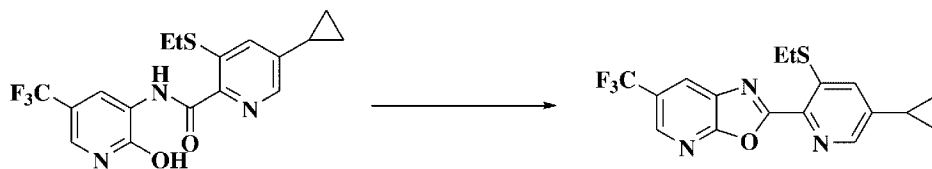


3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピコリン酸 (140 mg) をピリジン (2 mL) に溶かし、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール (8 mg, 0.1 当量) と EDC (215 mg, 2.0 当量) を加えた。室温で 10 分間撹拌した後、3 - アミノ - 5 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - オール (100 mg, 1.0 当量) を加え、さらに 2.5 時間撹拌した。原料の消失を確認し、塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、溶媒を減圧下留去し、N - (5 - トリフルオロメチル - 2 - ヒドロキシピリジン - 3 - イル) - 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピル - ピコリン酸アミド (132 mg, 62%) を得た。

[0269] 実施例 2

2 - (3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチル - オキサゾロ [5,4-b] ピリジン (化合物番号 3-13) の製造

[化47]



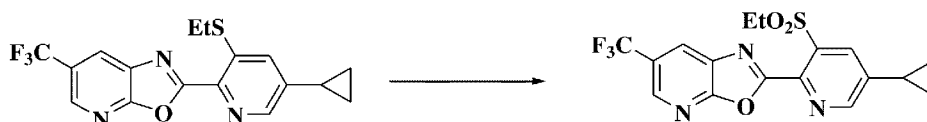
N - (5 - トリフルオロメチル - 2 - ヒドロキシピリジン - 3 - イル) - 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピル - ピコリン酸アミド (130 mg) をトルエン (1 mL) に溶かし、室温でトリフェニルホスフィン (270 mg, 3.0 当量)、アゾジカルボン酸ビス(2-メトキシエチル) (240 mg, 3.0 当量) を加え、50 °C に加熱しながら 3 時間撹拌した。TLC で原料が消失したことを確認し、水を加えて、酢酸エチルで抽出した。硫酸ナト

リウムを加え脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製した。目的物（64 mg, 52%）を得た。

[0270] 実施例 3

2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチル - オキサゾロ [5, 4 - b] ピリジンの製法（化合物番号 3 - 15）

[化48]



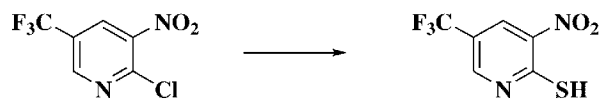
2 - (3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチル - オキサゾロ [5, 4 - b] ピリジン (130 mg, 1.0 当量) を酢酸エチル (1 mL) に溶かし、m-CPBA (106 mg, 2.5 当量) を加えた。室温で 3.5 時間攪拌した。TLC で原料の消失を確認し、チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加えて脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製した。2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチル - オキサゾロ [5, 4 - b] ピリジン (60 mg, 94%) を得た。

[0271] 公知の 2 - アミノ - 4 - (トリフルオロメチルチオ) フェノール、2 - アミノ - 4 - トリフルオロメチルフェノール、2 - アミノ - 4 - ペンタフルオロエチルフェノール、又は N3 - メチル - 6 - トリフルオロメチルピリジン - 3, 4 - ジアミンから上記実施例と同様の方法で、化合物番号 8 - 12、8 - 15、8 - 18、及び 2 - 15 を製造した。

[0272] 参考例 7

5 - トリフルオロメチル - 2 - メルカプト - 3 - ニトロピリジンの製造

[化49]



2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 3 - ニトロピリジン (500 mg) を DMF (4 mL) に溶かし、水酸化ナトリウム (150 mg、1.2 当量) を加えた。室温で3 時間攪拌し、TLC で原料の消失を確認後、水を加えて酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加えて脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製した。5 - トリフルオロメチル - 2 - メルカプト - 3 - ニトロピリジン (193 mg, 39%) を得た。

[0273] 参考例 8

3 - アミノ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - メルカプトピリジンの製造

[化50]

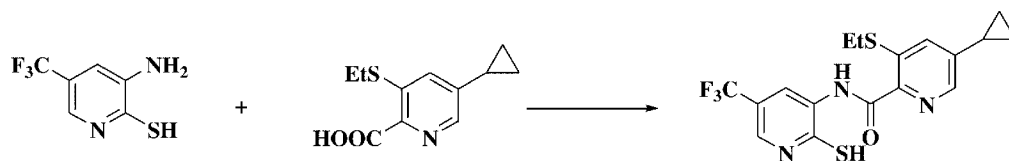


5 - トリフルオロメチル - 2 - メルカプト - 3 - ニトロピリジン (190 mg) をエタノール (2 mL) に溶かし、水 (0.5 mL) に溶かした塩化アンモニウム (45 mg、1 当量) を加えた。室温で攪拌しながら、鉄粉 (240 mg, 5.0 当量) を加え、還流下で5.5 時間攪拌した。TLC で原料の消失を確認し、セライト濾過により金属を除去した。シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製し、3 - アミノ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - メルカプトピリジン (70 mg, 46%) を得た。

[0274] 参考例 9

N - (5 - トリフルオロメチル - 2 - メルカプトピリジン - 3 - イル) - 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピル - ピコリン酸アミドの製法

[化51]

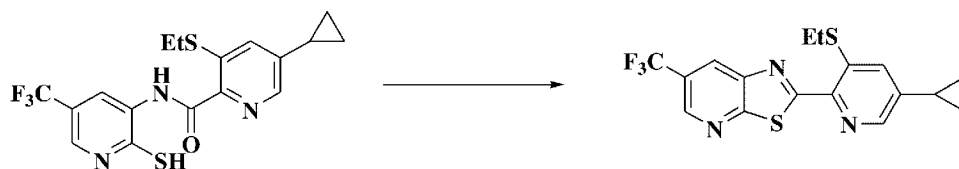


3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピコリン酸 (96 mg) をピリジン (1.5 mL) に溶かし、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール (5 mg、0.1 当量)、EDC (165 mg、2.4 当量) を加え、室温で20 分間撹拌した。ピリジン (2 mL) に溶かした3 - アミノ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - メルカプトピリジン (70 mg、1.0 当量) を滴下し、室温で4 時間撹拌した。TLCで原料の消失を確認し、水を加え酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加え脱水、溶媒を留去し、クルードのN - (5 - トリフルオロメチル - 2 - メルカプトピリジン - 3 - イル) - 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピル - ピコリン酸アミド (160 mg) を得た。

[0275] 実施例4

2 - (3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチル - チアゾロ [5,4 - b] ピリジンの製法 (化合物番号5 - 13)

[化52]



クルードのN - (5 - トリフルオロメチル - 2 - メルカプトピリジン - 3 - イル) - 3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピル - ピコリン酸アミド (160 mg) をNMP (1 mL) に溶かし、P - トルエンスルホン酸 (115 mg) を加え、150 °Cで2 時間撹拌した。TLCで原料の消失を確認し、水を加え酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加え脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製し、

2 - (3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチル - チアゾロ [5, 4 - b] ピリジン (64 mg, 47%) を得た。

[0276] 実施例 5

2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチル - チアゾロ [5, 4 - b] ピリジンの製造 (化合物番号 5 - 15)

[化53]

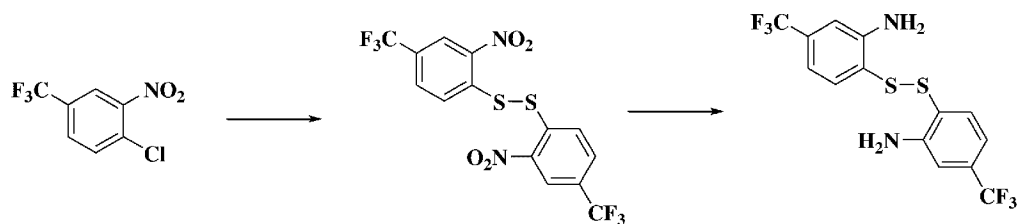


2 - (3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチル - チアゾロ [5, 4 - b] ピリジン (55 mg) を酢酸エチル (1 mL) に溶かし、m - CPBA (82 mg, 2.2 当量) を加えた。室温で 1.5 時間攪拌した。原料の消失を確認し、チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加えて脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製した。2 - (3 - エチルスルホニル - 5 - シクロプロピルピリジン - 2 - イル) - 5 - トリフルオロメチル - チアゾロ [5, 4 - b] ピリジン (15 mg, 28%) を得た。

[0277] 参考例 10

6, 6 - ジスルファンジイルビス (3 - トリフルオロメチルアニリン) の製法

[化54]

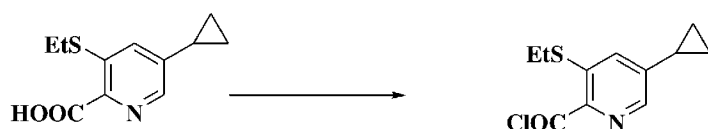


4 - トリフルオロメチル - 2 - ニトロクロロベンゼン (2.0 g) を DMF (15 mL) に溶かし、水酸化ナトリウム (1.0 g, 2.0 当量) を室温に加えた。5 時間攪拌し、TLCで原料の消失を確認し、水を加えて酢酸エチルで抽出した。粗生成物 (1.65 g, 純度<50%) を得た。得られた粗生成物をエタノール (15 mL) に溶かし、水 (5 mL) に溶かした塩化アンモニウム (200 mg) を加えた。室温で攪拌しながら、鉄粉 (2.1 g, 過剰量) を加え、加熱還流条件で2 時間攪拌した。その後セライト濾過により金属を除去した。シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製し、6, 6 - ジスルファンジイルビス (3 - トリフルオロメチルアニリン) (274 mg, 16%) を得た。

[0278] 参考例 1 1

3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピコリン酸クロリドの製法

[化55]

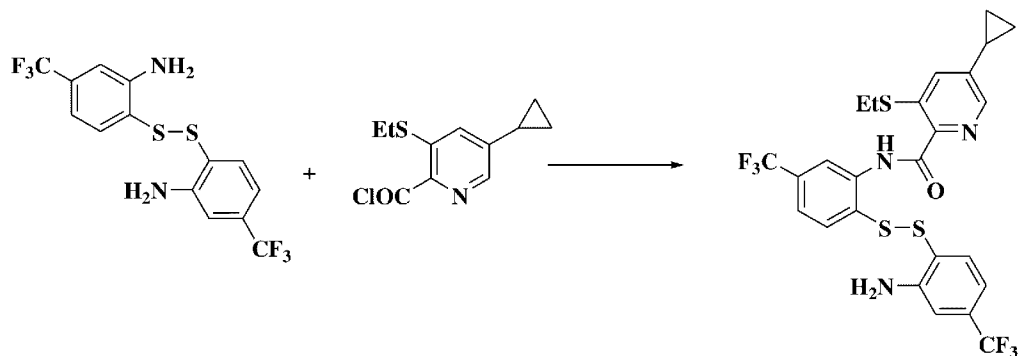


3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピコリン酸 (220 mg) を THF (1 mL) に溶かし、DMFを触媒量加えた。その溶液に塩化オキサリル (150 mg, 1.2 当量) を滴下し、室温で5 時間攪拌した。溶媒を留去して3 - エチルチオ - 5 - シクロプロピルピコリン酸クロリドを得た。

[0279] 参考例 1 2

N - (2 - ((2 - アミノ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) ジスルファンイル) - 5 - トリフルオロフェニル) - 5 - シクロプロピル - 3 - エチルチオピコリン酸アミドの製法

[化56]

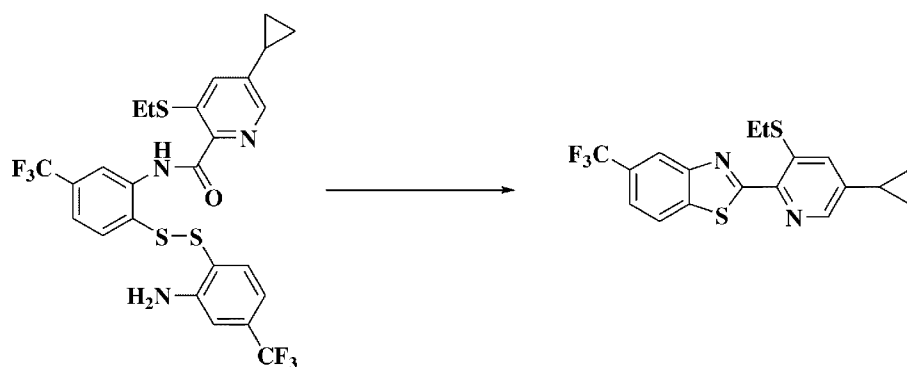


150 mgの6, 6-ジスルファンジイルビス(3-トリフルオロメチルアニリン)をTHF(1 mL)に溶かし、トリエチルアミン(158 mg, 4.0 当量)を加えた。さらに3-エチルチオ-5-シクロプロピルピコリン酸クロリドを少しずつ加え、室温で3時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加え脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製し、N-(2-((2-アミノ-4-トリフルオロメチルフェニル)ジスルファニル)-5-トリフルオロフェニル)-5-シクロプロピル-3-エチルチオピコリン酸アミド(134 mg, 58%)を得た。

[0280] 実施例6

2-(3-エチルチオ-5-シクロプロピルピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-ベンゾチアゾールの製造(化合物番号9-10)

[化57]



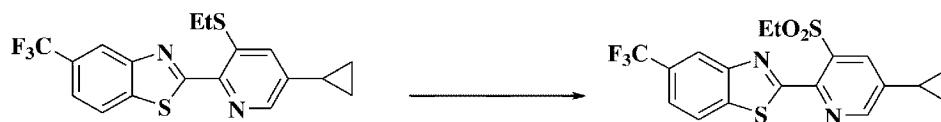
前工程で製造したピコリン酸アミド(130 mg)をNMP(2 mL)

に溶かし、アルゴン雰囲気下、ロンガリット（51 mg, 1.5当量）を加えた。さらにP-トルエンスルホン酸一水和物（63 mg, 1.5当量）を加え、150℃で1時間攪拌した。その後、水を加えて酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加え脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製し、2-(3-エチルチオ-5-シクロプロピルピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-ベンゾチアゾール（66 mg, 79%）を得た。

[0281] 実施例7

2-(3-エチルスルホニル-5-シクロプロピルピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-ベンゾチアゾールの製造（化合物番号9-12）

[化58]

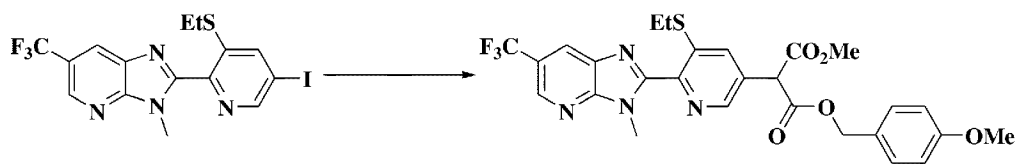


2-(3-エチルチオ-5-シクロプロピルピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-ベンゾチアゾール（50 mg）を酢酸エチル（1 mL）に溶かし、mCPBA（76 mg, 2.2当量）を加え、室温で2.5時間攪拌した。TLCで原料の消失を確認し、チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。硫酸ナトリウムを加えて脱水、シリカゲルを加えて溶媒留去し、カラムクロマトグラフィーにて精製し、2-(3-エチルスルホニル-5-シクロプロピルピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-ベンゾチアゾール（15 mg, 28%）を得た。

[0282] 参考例13

1-(4-メトキシベンジル)-3-メチル-2-(5-エチルチオ-6-(3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル)ピリジン-3-イル)マロネートの製法

[化59]

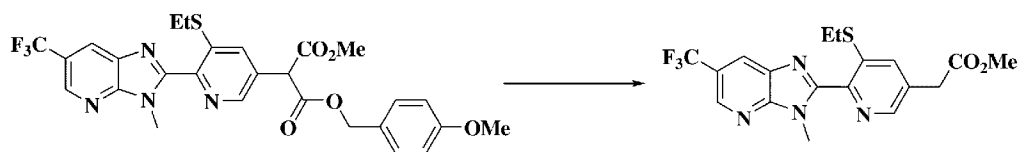


2 - (3 - エチルチオ - 5 - ヨードピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (1. 1 g, 2. 4 mmol)、ヨウ化銅 (I) (0. 09 g, 0. 2 当量)、ピコリン酸 (0. 12 g, 0. 4 当量)、マロン酸メチルパラメトキシベンジル (0. 68 g, 1. 2 当量)、炭酸セシウム (3. 1 g, 4 当量) を THF (48 mL) に溶解し、60℃で1時間撹拌した。反応終了後、飽和塩化アンモニウム水溶液を添加後、酢酸エチルで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られる残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、1 - (4 - メトキシベンジル) - 3 - メチル 2 - (5 - エチルチオ - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン - 3 - イル) マロン酸エステル (1. 4 g) を得た。

[0283] 参考例 14

メチル 2 - (5 - エチルチオ - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン - 3 - イル) アセテートの製法

[化60]



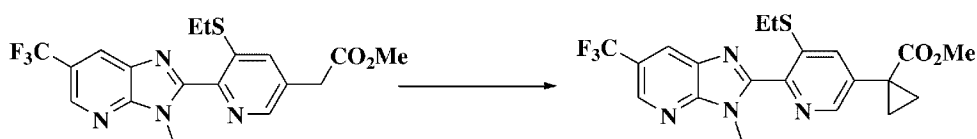
前工程で製造したマロン酸エステル (1. 4 g, 2. 4 mmol) をトリフルオロ酢酸 (10 mL) に溶解し、50℃で2時間撹拌した。濃縮後、カラムクロマトグラフィーに付し、メチル 2 - (5 - エチルチオ - 6 - (

3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン - 3 - イル) アセテート (818 mg, 82 %) を得た。

[0284] 参考例 15

メチル 1 - (5 - エチルチオ - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン) - 3 - イル) シクロプロパンカルボキシレート

[化61]

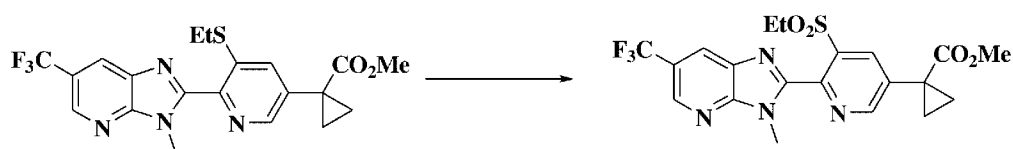


前工程で製造した酢酸エステル (818 mg, 2.0 mmol) を DMF (20 mL) に溶解し、1, 2 - ジブロモエタン (1.5 g, 4 当量) を添加した。その後、0℃まで冷却し、60% NaH (160 mg, 2 当量) を添加した。0℃で1時間、室温で3時間攪拌後、1規定HCl水溶液中に反応液を滴下した。酢酸エチルで抽出後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧濃縮して得られる残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、メチル 1 - (5 - エチルチオ - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン) - 3 - イル) シクロプロパンカルボキシレート (700 mg, 80%) を得た。

[0285] 実施例 8

メチル 1 - (5 - エチルスルホニル - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン) - 3 - イル) シクロプロパンカルボキシレート (化合物番号 11 - 2)

[化62]

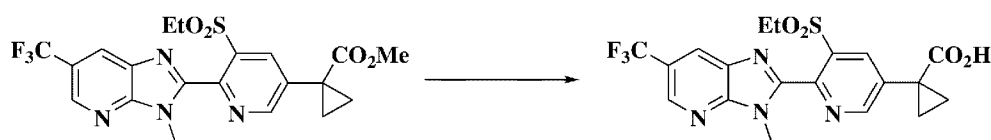


前工程で得られたシクロプロパンカルボン酸エステル（510 mg, 1.1 mmol）を酢酸エチル（10 mL）に溶解し、65% mCPBA（670 mg, 2当量）を添加した。3時間室温で攪拌後、FAMSO、トリエチルアミンを添加し、溶媒を濃縮して得られる残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、メチル 1 - （5 - エチルスルホニル - 6 - （3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル）ピリジン） - 3 - イル）シクロプロパンカルボキシレート（530 mg, 97%）を得た。

[0286] 実施例 9

1 - （5 - エチルスルホニル - 6 - （3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル）ピリジン） - 3 - イル）シクロプロパンカルボン酸の製法（化合物番号 11 - 1）

[化63]

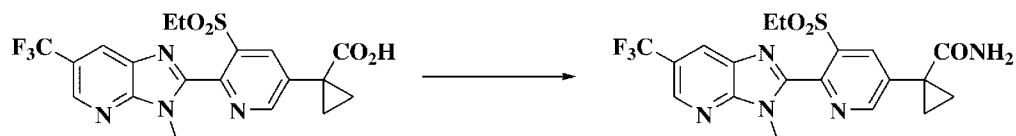


前工程で得られたシクロプロパンカルボン酸エステル（530 mg, 1.1 mmol）をメタノール（10 mL）に溶解し、15%水酸化ナトリウム水溶液（0.3 g, 1.1 当量）を添加した。40℃で2時間攪拌し、水を添加した。メタノールを留去後、1規定 HCl で pH 4 に調整した。酢酸エチルで抽出後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去して 1 - （5 - エチルスルホニル - 6 - （3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル）ピリジン） - 3 - イル）シクロプロパンカルボン酸（510 mg, 99%）を得た。

[0287] 実施例 10

1 - （5 - エチルスルホニル - 6 - （3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル）ピリジン） - 3 - イル）シクロプロパンカルボン酸アミドの製法（化合物番号 11 - 6）

[化64]



前工程で得られたシクロプロパンカルボン酸（530 mg, 1.1 mmol）をTHF（10 mL）に溶解し、塩化オキザリル（160 mg, 1.1 当量）を添加した。室温で1時間攪拌後溶液を濃縮し、酸クロライドを〈500 mg, 90%〉得た。当該酸クロライド（360 mg, 0.76 mmol）を28% アンモニア水（5 mL）に少量ずつ添加した。1時間室温で攪拌後、酢酸エチルで抽出後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られる残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、1 - （5 - エチルスルホニル - 6 - （3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル）ピリジン） - 3 - イル）シクロプロパンカルボン酸アミド（300 mg, 87%）を得た。

[0288] 実施例 11

1 - （5 - エチルスルホニル - 6 - （3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル）ピリジン） - 3 - イル）シクロプロパンカルボニトリルの製法（化合物番号 11 - 13）

[化65]



前工程で得られたシクロプロパンカルボン酸アミド（300 mg, 0.66 mmol）をDMF（2 mL）に溶解し、オキシ塩化リン（41 mg, 0.4 当量）を添加した。室温で1時間攪拌後、飽和重曹水を添加し、酢酸エチルで抽出後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られる残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、1 - （5 - エチルスルホニル - 6 - （3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン

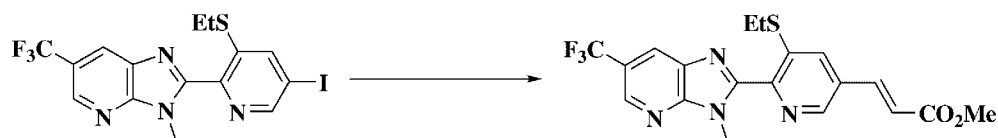
- 2 - イル) ピリジン) - 3 - イル) シクロプロパンカルボニトリル (150 mg, 52 %) を得た。

[0289] 公知の 2 - アミノ - 4 - (トリフルオロメチルチオ) フェノール、又は N 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチルピリジン - 3, 4 - ジアミンから上記実施例と同様の方法で、化合物番号 18 - 173、及び 2 - 13 を製造した。

[0290] 参考例 16

メチル 3 - (5 - エチルチオ - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン - 3 - イル) アクリレートの製法

[化66]



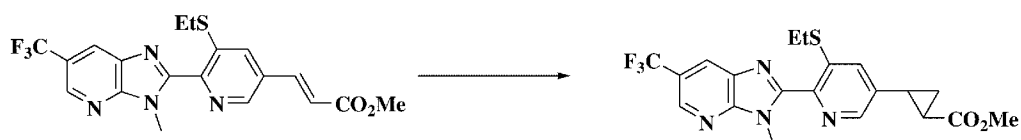
2 - (3 - エチルチオ - 5 - ヨードピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (1700 mg) に、アクリル酸メチル (630 mg)、酢酸パラジウム (11) (82 mg)、トリ(o - トリル)ホスフィン (220 mg)、N, N - ジイソプロピルエチルアミン (940 mg)、ジメチルホルムアミド (36 mL) を加え、アルゴン置換した後、90 °C で 3 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、水を注加し、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で有機層を洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、メチル 3 - (5 - エチルチオ - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン - 3 - イル) アクリレート (1100 mg) を得た。

物性：融点 159 - 161 °C

[0291] 参考例 17

メチル 2 - (5 - エチルチオ - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン) - 3 - イル) シクロプロパンカルボキシレート

[化67]



トリメチルスルホキソニウムヨード (26 mg)、DMSO (ジメチルスルホキシド) (0.6 mL) の混合溶液に、水素化ナトリウム (6 mg) を加え、室温下で30分間撹拌した。混合溶液に前工程で製造したエステル (50 mg)、THF (0.6 mL) の混合溶液を0℃で加え、20分間撹拌した後、室温で3時間撹拌した。氷水を注加し、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で有機層を洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、メチル 2 - (5 - エチルチオ - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン) - 3 - イル) シクロプロパンカルボキシレート (16 mg) を得た。

物性：融点 118 - 120℃

[0292] 実施例 12

メチル 2 - (5 - エチルスルホニル - 6 - (3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ピリジン) - 3 - イル) シクロプロパンカルボキシレートの製造 (化合物番号 11 - 82)

[化68]



前工程で得られたシクロプロパンカルボン酸メチルエステル (16 mg)

、酢酸エチル（0.4 ml）の混合溶液に0℃でm-CPBA（23 mg）を加え、室温で2時間攪拌した。反応混合物に飽和チオ硫酸水素ナトリウム溶液を注加し、酢酸エチルで抽出し、飽和重層水、飽和食塩水で有機層を洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、メチル 2 - （5 - エチルスルホニル - 6 - （3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル）ピリジン） - 3 - イル）シクロプロパンカルボキシレート（8.0 mg）を得た。

[0293] 以下に、製剤の実施例を示すが、これらに限定されるものではない。製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

[0294] 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	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合	10部
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

[0295] 製剤例 2 .

本発明化合物	3部
クレー粉末	82部
珪藻土粉末	15部
以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。	

[0296] 製剤例 3 .

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

[0297] 製剤例 4.

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

[0298] 次に本発明の試験例を示すが、これらに限定されるものではない。

[0299] 試験例 1.

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) に対する防除価試験

直径 8 cm、高さ 8 cm のプラスチックポットにハクサイを植えてモモアカアブラムシを繁殖させ、それぞれのポットの寄生虫数を調査した。本発明の一般式 (1) で表される縮合複素環化合物又はその塩類を水に分散させて 500 ppm の薬液に希釈し、該薬液をポット植えハクサイの茎葉に散布して風乾後、ポットを温室に保管し、薬剤散布後 6 日目にそれぞれのハクサイに寄生しているモモアカアブラムシの寄生虫数を調査し、下記の式より防除価を算出し、下記判定基準に従って判定した。

[0300] [数1]

$$\text{防除価} = 100 - \left\{ (T \times C_a) / (T_a \times C) \right\} \times 100$$

[0301] T_a : 処理区の散布前寄生虫数

T : 処理区の散布後寄生虫数

C_a : 無処理区の散布前寄生虫数

C : 無処理区の散布後寄生虫数

[0302] 判定基準

A . . . 防除価 100%

B . . . 防除価 99%~90%

C . . . 防除価 89%~80%

D . . . 防除価 79%~50%

[0303] その結果、本発明化合物の1-15、1-16、1-18、2-15、3-13、3-15、5-13、5-15、7-13、7-14、7-15、8-10、8-12、8-15、8-16、8-18、9-10、9-12、11-1、11-2、11-3、11-6、11-10、11-13、11-14、11-16、11-27、11-50、11-53、11-60、11-68、11-73、11-80、11-81、11-82、11-86、11-93、11-94、11-96、11-131、11-140、11-141、11-148、12-1、12-2、12-6、12-13、18-1、18-2、18-6、18-13、18-161、18-162、18-166、18-173、18-174、18-176、18-187、18-210、18-211、18-213、18-220、18-221、18-228、18-233、18-234、20-2、20-21、20-22、20-24、20-26、20-39、20-41、20-42、20-44、20-45、20-46及び20-53は、Aの活性を示した。

[0304] 試験例2. ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatella*) に対する殺虫試験

本発明の一般式(1)で表される縮合複素環化合物又はその塩類を水に分散させて500ppmの薬液に希釈し、該薬液にイネ実生(品種:日本晴)を30秒間浸漬し、風乾した後にガラス試験管に入れ、ヒメトビウンカ3令を各10頭ずつ接種した後に綿栓をし、接種8日後に生死虫数を調査し、補正死虫率を下記の式より算出し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。

[0305] [数2]

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{(\text{無処理区生存率} - \text{処理区生存率})}{(\text{無処理区生存率})} \times 100$$

[0306] その結果、本発明化合物の1-15、1-16、1-18、2-15、3-13、3-15、5-13、5-15、7-13、7-14、7-15、

8-10、8-12、8-15、8-16、8-18、9-10、9-12、11-1、11-2、11-3、11-6、11-10、11-13、11-14、11-16、11-27、11-50、11-53、11-60、11-68、11-73、11-80、11-81、11-82、11-86、11-93、11-94、11-96、11-131、11-140、11-141、11-148、12-1、12-2、12-6、12-13、18-1、18-2、18-6、18-13、18-161、18-162、18-166、18-173、18-174、18-176、18-187、18-210、18-211、18-213、18-220、18-221、18-228、18-233、18-234、20-2、20-21、20-22、20-24、20-26、20-39、20-41、20-42、20-44、20-45、20-46及び20-53は、Aの活性を示した。

[0307] 試験例3. コナガ(*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を本発明の一般式(1)で表される縮合複素環化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。

1区10頭3連制。

[0308] [数3]

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

[0309] その結果、本発明化合物の1-15、1-16、1-18、2-15、3-13、3-15、5-13、5-15、7-13、7-14、7-15、8-10、8-12、8-15、8-16、8-18、9-10、9-12、11-1、11-2、11-3、11-6、11-10、11-13、1

1-14、11-16、11-27、11-50、11-53、11-60、11-68、11-73、11-80、11-81、11-86、11-93、11-94、11-96、11-131、11-140、11-141、11-148、12-1、12-2、12-6、12-13、18-1、18-2、18-6、18-13、18-161、18-162、18-166、18-173、18-174、18-176、18-187、18-210、18-211、18-213、18-220、18-221、18-228、18-233、18-234、20-2、20-21、20-22、20-24、20-26、20-39、20-41、20-42、20-44、20-45、20-46及び20-53は、Aの活性を示した。

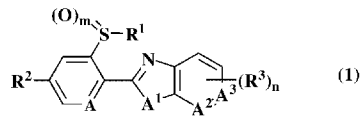
産業上の利用可能性

[0310] 本発明に係る化合物は、幅広い農園芸用害虫に対して優れた防除効果を有しており、有用である。

請求の範囲

[請求項1] 一般式 (1) :

[化1]



{式中、 R^1 は、

- (a1) (C_1-C_6) アルキル基；
- (a2) (C_3-C_6) シクロアルキル基；
- (a3) (C_2-C_6) アルケニル基；又は
- (a4) (C_2-C_6) アルキニル基；を示す。

R^2 は、

- (b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基；
- (b2) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基；
- (b3) ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基；
- (b4) (C_1-C_6) アルキルチオ基；又は
- (b5) 同一又は異なっても良く、
 - (a) ハロゲン原子、
 - (b) シアノ基、
 - (c) シアノ (C_1-C_6) アルキル基、
 - (d) ホルミル基、
 - (e) ヒドロキシ (C_1-C_6) アルキル基、
 - (f) ハロ (C_1-C_6) アルキル基、
 - (g) (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基、
 - (h) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基、
 - (i) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルコキシ (C_1-C_6) アルキル基、
 - (j) (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、

- (k) (C₁ - C₆) アルキルスルフィニル (C₁ - C₆) アルキル基、
- (l) (C₁ - C₆) アルキルスルホニル (C₁ - C₆) アルキル基、
- (m) (C₁ - C₆) アルキルカルボニル基、
- (n) カルボキシル基、
- (o) (C₁ - C₆) アルコキシカルボニル基、
- (p) ハロ (C₁ - C₆) アルコキシカルボニル基、
- (q) (C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルコキシカルボニル基、
- (r) (C₁ - C₆) アルキルカルボニルオキシ (C₁ - C₆) アルキル基、
- (s) (C₃ - C₆) シクロアルキルカルボニルオキシ (C₁ - C₆) アルキル基、
- (t) (C₁ - C₆) アルコキシカルボニルオキシ (C₁ - C₆) アルキル基、
- (u) R⁵ (R⁶) N 基 (式中、R⁵ 及び R⁶ は、同一又は異なっても良く水素原子、(C₁ - C₆) アルキル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルキル基、ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、(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、又はジ (C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル基 (ここで、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノのアルキル基は同一又は異なってもよい) を示す。) ;
- (v) R⁵ (R⁶) N (C₁ - C₆) アルキル基 (式中、R⁵ 及び R⁶ は、前記と同じ。)
- (w) R⁵ (R⁶) N カルボニル基 (式中、R⁵ 及び R⁶ は、前記と同じ。)
- (x) R⁵ (R⁶) N カルボニルオキシ (C₁ - C₆) アルキル基、(式中、R⁵ 及び R⁶ は、前記と同じ。) 及び
- (y) C (R⁵) = N O R⁶ 基 (式中、R⁵ 及び R⁶ は前記に同じ。) ; か

ら選択される 1 ～ 2 の置換基を環上に有する (C_3-C_6) シクロアルキル基；を示す。

R^3 は、

- (c1) ハロゲン原子；
- (c2) シアノ基；
- (c3) ニトロ基；
- (c4) (C_1-C_6) アルキル基；
- (c5) (C_1-C_6) アルコキシ基；
- (c6) (C_2-C_6) アルケニルオキシ基；
- (c7) (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；
- (c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；
- (c9) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基；
- (c10) ハロ (C_2-C_6) アルケニルオキシ基；
- (c11) ハロ (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；
- (c12) (C_1-C_6) アルキルチオ基；
- (c13) (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基；
- (c14) (C_1-C_6) アルキルスルホニル基；
- (c15) ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基；
- (c16) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基又は
- (c17) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基を示す。

A 、 A^2 及び A^3 は、 CH 、又は窒素原子を示し、

A^1 は、 O 、 S 、又は $N-R^4$ を示す（ここで R^4 は、

- (d1) (C_1-C_6) アルキル基；
- (d2) (C_3-C_6) シクロアルキル基；
- (d3) (C_2-C_6) アルケニル基；又は
- (d4) (C_2-C_6) アルキニル基；を示す)。

但し、 A^1 が $N-R^4$ の場合、 A^2 、 A^3 が同時に窒素原子である場合を除く。

mは0、1、又は2を示し、nは1、又は2を示す。}

で示される縮合複素環化合物又はその塩類。

[請求項2]

R¹が(a1) (C₁-C₆) アルキル基であり、

R²が(b1) (C₃-C₆) シクロアルキル基；

(b4) (C₁-C₆) アルキルチオ基；又は

(b5) 同一又は異なっても良く、

(b) シアノ基、

(c) シアノ (C₁-C₆) アルキル基、

(d) ホルミル基、

(e) ヒドロキシ (C₁-C₆) アルキル基、

(f) ハロ (C₁-C₆) アルキル基、

(g) (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基、

(h) ハロ (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基、

(i) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシ (C₁-C₆) アルキル基、

(j) (C₁-C₆) アルキルチオ (C₁-C₆) アルキル基、

(k) (C₁-C₆) アルキルスルフィニル (C₁-C₆) アルキル基、

(l) (C₁-C₆) アルキルスルホニル (C₁-C₆) アルキル基、

(m) (C₁-C₆) アルキルカルボニル基、

(n) カルボキシル基、

(o) (C₁-C₆) アルコキシカルボニル基、

(p) ハロ (C₁-C₆) アルコキシカルボニル基、

(q) (C₃-C₆) シクロアルキル (C₁-C₆) アルコキシカルボニル基、

(r) (C₁-C₆) アルキルカルボニルオキシ (C₁-C₆) アルキル基、

(s) (C₃-C₆) シクロアルキルカルボニルオキシ (C₁-C₆) アルキル基、

(t) (C₁ - C₆) アルコキシカルボニルオキシ (C₁ - C₆) アルキル基、

(u) R⁵ (R⁶) N基 (式中、R⁵及びR⁶は、同一又は異なっても良く

水素原子、(C₁ - C₆) アルキル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル基、(C₃ - C₆) シクロアルキル (C₁ - C₆) アルキル基、ハロ (C₁ - C₆) アルキル基、(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、又はジ (C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル基 (ここで、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノのアルキル基は同一又は異なってもよい) を示す。) ;

(v) R⁵ (R⁶) N (C₁ - C₆) アルキル基 (式中、R⁵及びR⁶は、前記と同じ。)

(w) R⁵ (R⁶) Nカルボニル基 (式中、R⁵及びR⁶は、前記と同じ。)

(x) R⁵ (R⁶) Nカルボニルオキシ (C₁ - C₆) アルキル基、(式中、R⁵及びR⁶は、前記と同じ。) 及び

(y) C (R⁵) = N O R⁶基 (式中、R⁵及びR⁶は前記に同じ。) ;
から選択される 1 ~ 2 の置換基を環上に有する (C₃ - C₆) シクロアルキル基であり、

R³が、

(c8) ハロ (C₁ - C₆) アルキル基 ;

(c9) ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ基 ;

(c12) (C₁ - C₆) アルキルチオ基 ;

(c15) ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ基 ;

A、A²及びA³が、CH、又は窒素原子であり、

A¹が、O、S、又はN - R⁴であり (ここでR⁴は(d1) (C₁ - C₆) アルキル基 ; を示す)、A¹がN - R⁴の場合、A²及びA³が同時に窒素原子である場合を除き、

mは0、1、又は2であり、

nは1である

請求項1に記載の縮合複素環化合物又はその塩類。

[請求項3]

R^1 が、(a1) (C_1-C_6) アルキル基であり、

R^2 が、(b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基；又は

(b5) 同一又は異なっても良く、

(b) シアノ基、

(n) カルボキシ基、

(o) (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、

(t) (C_1-C_6) アルコキシカルボニルオキシ (C_1-C_6) アルキル基、若しくは

(w) R^5 (R^6) Nカルボニル基 (式中、 R^5 及び R^6 は、前記と同じ。)

から選択される1～2の置換基を環上に有する (C_3-C_6) シクロアルキル基であり、

R^3 が、(c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基であり、

A 、 A^2 及び A^3 が、窒素原子であり、

A^1 が、 $N-R^4$ であり (ここで R^4 は (d1) (C_1-C_6) アルキル基を示し、 A^2 及び A^3 が同時に窒素原子である場合を除く)、

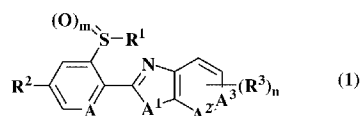
mが0、又は2であり、

nが1である

請求項1に記載の縮合複素環化合物又はその塩類。

[請求項4]

[化2]



{式中、 R^1 は、(a1) (C_1-C_6) アルキル基；(a2) (C_3-C_6) シクロアルキル基；

(a3) (C_2-C_6) アルケニル基；又は (a4) (C_2-C_6) アルキニル基；を示す。

R^2 は、(b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基；(b2) (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基；(b3) ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル (C_1-C_6) アルキル基；又は (b4) (C_1-C_6) アルキルチオ基；を示す。

R^3 は、(c1) ハロゲン原子；(c2) シアノ基；(c3) ニトロ基；(c4) (C_1-C_6) アルキル基；(c5) (C_1-C_6) アルコキシ基；(c6) (C_2-C_6) アルケニルオキシ基；(c7) (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；(c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；(c9) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基；(c10) ハロ (C_2-C_6) アルケニルオキシ基；(c11) ハロ (C_2-C_6) アルキニルオキシ基；(c12) (C_1-C_6) アルキルチオ基；(c13) (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基；(c14) (C_1-C_6) アルキルスルホニル基；(c15) ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基；(c16) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基；又は (c17) ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基を示す。

A 及び A^2 、 A^3 は、 CH 、又は窒素原子を示し、 A^1 は、 O 、 S 、又は $N-R^4$ を示す（ここで R^4 は、(d1) (C_1-C_6) アルキル基；(d2) (C_3-C_6) シクロアルキル基；(d3) (C_2-C_6) アルケニル基；又は (d4) (C_2-C_6) アルキニル基；を示す）。但し、 A^1 が $N-R^4$ の場合、 A^2 、 A^3 が同時に窒素原子である場合を除く。 m は0、1、又は2を示し、 n は1、又は2を示す。}

で示される縮合複素環化合物。

[請求項5]

R^1 が、(a1) (C_1-C_6) アルキル基；を示し、 R^2 が、(b1) (C_3-C_6) シクロアルキル基；又は (b4) (C_1-C_6) アルキルチオ基；を示し、 R^3 が、(c8) ハロ (C_1-C_6) アルキル基；(c9) ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基；(c12) (C_1-C_6) アルキルチオ基；又は (c15) ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基；を示す。

A 及び A²、A³が、CH、又は窒素原子を示し、A¹が、N-R⁴を示す（ここでR⁴は、(d1) (C₁-C₆) アルキル基；を示す）。m が0、又は2を示し、n は1を示す、請求項4に記載の縮合複素環化合物。

[請求項6] R¹が、(a1) (C₁-C₆) アルキル基；を示し、R²が、(b1) (C₃-C₆) シクロアルキル基；を示し、R³が、(c8) ハロ (C₁-C₆) アルキル基；を示す。

A 及び A²、A³が、CH、又は窒素原子を示し、A¹が、O、S、又はN-R⁴を示す（ここでR⁴は、(d1) (C₁-C₆) アルキル基；を示す）。m が0、又は2を示し、n は1を示す、請求項4に記載の縮合複素環化合物。

[請求項7] 請求項1～6のいずれか一項に記載の縮合複素環化合物又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

[請求項8] 請求項1～6のいずれか一項に記載の縮合複素環化合物又はその塩類の有効量で植物又は土壌を処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用方法。

[請求項9] 請求項1～6のいずれか一項に記載の縮合複素環化合物又はその塩類の有効量を有効成分として含有することを特徴とする外部寄生虫防除剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2016/052841

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D401/04(2006.01)i, A01N43/54(2006.01)i, A01N43/76(2006.01)i, A01N43/78(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, C07D413/04(2006.01)i, C07D417/04(2006.01)i, C07D471/04(2006.01)i, C07D498/04(2006.01)i,
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D401/04, A01N43/54, A01N43/76, A01N43/78, A01N43/90, A01P7/04, C07D413/04, C07D417/04, C07D471/04, C07D498/04, C07D513/04

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

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2016
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2016	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2016

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
E, X	WO 2016/026848 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG), 25 February 2016 (25.02.2016), entire text; compounds P7, P15, P16, P18, P20, P21 (Family: none)	1-9
Y	WO 2012/086848 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 28 June 2012 (28.06.2012), entire text & JP 2013-136519 A & JP 2015-232035 A & JP 2015-232036 A & US 8853238 B2 & US 2014/0364444 A1 & EP 2655337 A1 & CN 103261170 A & KR 10-2013-0140125 A	1-9

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

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

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

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
14 March 2016 (14.03.16)

Date of mailing of the international search report
22 March 2016 (22.03.16)

Name and mailing address of the ISA/
Japan Patent Office
3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku,
Tokyo 100-8915, Japan

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2016/052841

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2013/018928 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 07 February 2013 (07.02.2013), entire text & JP 2014-5263 A & US 2014/0194290 A1 & US 2015/0197532 A1 & US 2016/0009715 A1 & EP 2739624 A1 & CN 103717598 A & KR 10-2014-0068920 A	1-9
Y	WO 2014/119679 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 07 August 2014 (07.08.2014), entire text & US 2015/0366208 A1 & EP 2952098 A1 & KR 10-2015-0113097 A & CN 105142403 A	1-9
Y	WO 2014/142292 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 18 September 2014 (18.09.2014), entire text & US 2016/0021886 A & EP 2975039 A1 & CN 105051045 A & KR 10-2015-0132401 A	1-9
A	WO 2013/191188 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 27 December 2013 (27.12.2013), entire text & US 2015/0246911 A1 & EP 2865672 A1 & CN 104395300 A	1-9
E,A	WO 2016/020286 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG), 11 February 2016 (11.02.2016), entire text (Family: none)	1-9
E,A	WO 2016/023954 A2 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG), 18 February 2016 (18.02.2016), entire text (Family: none)	1-9
P,A	WO 2015/072463 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 21 May 2015 (21.05.2015), entire text (Family: none)	1-9

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2016/052841

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

C07D513/04(2006.01)i

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

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (I P C))

Int.Cl. C07D401/04(2006.01)i, A01N43/54(2006.01)i, A01N43/76(2006.01)i, A01N43/78(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, C07D413/04(2006.01)i, C07D417/04(2006.01)i, C07D471/04(2006.01)i, C07D498/04(2006.01)i, C07D513/04(2006.01)i

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 (I P C))

Int.Cl. C07D401/04, A01N43/54, A01N43/76, A01N43/78, A01N43/90, A01P7/04, C07D413/04, C07D417/04, C07D471/04, C07D498/04, C07D513/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1 9 2 2 - 1 9 9 6 年
日本国公開実用新案公報	1 9 7 1 - 2 0 1 6 年
日本国実用新案登録公報	1 9 9 6 - 2 0 1 6 年
日本国登録実用新案公報	1 9 9 4 - 2 0 1 6 年

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

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
E, X	WO 2016/026848 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2016.02.25, 全文、化合物 P7, P15, P16, P18, P20, P21 (ファミリーなし)	1-9
Y	WO 2012/086848 A1 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) 2012.06.28, 全文 & JP 2013-136519 A & JP 2015-232035 A & JP 2015-232036 A & US 8853238 B2 & US 2014/0364444 A1 & EP 2655337 A1 & CN 103261170 A & KR 10-2013-0140125 A	1-9

☑ C 欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「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

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と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

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

1 4 . 0 3 . 2 0 1 6

国際調査報告の発送日

2 2 . 0 3 . 2 0 1 6

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (I S A / J P)

郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5

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)

小川 由美

4 P

3 4 4 4

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 9 2

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 請求項の番号
Y	WO 2013/018928 A1 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) 2013.02.07, 全文 & JP 2014-5263 A & US 2014/0194290 A1 & US 2015/0197532 A1 & US 2016/0009715 A1 & EP 2739624 A1 & CN 103717598 A & KR 10-2014-0068920 A	1-9
Y	WO 2014/119679 A1 (住友化学株式会社) 2014.08.07, 全文 & US 2015/0366208 A1 & EP 2952098 A1 & KR 10-2015-0113097 A & CN 105142403 A	1-9
Y	WO 2014/142292 A1 (日本農薬株式会社) 2014.09.18, 全文 & US 2016/0021886 A & EP 2975039 A1 & CN 105051045 A & KR 10-2015-0132401 A	1-9
A	WO 2013/191188 A1 (住友化学株式会社) 2013.12.27, 全文 & US 2015/0246911 A1 & EP 2865672 A1 & CN 104395300 A	1-9
E, A	WO 2016/020286 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2016.02.11, 全文 (ファミリーなし)	1-9
E, A	WO 2016/023954 A2 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 2016.02.18, 全文 (ファミリーなし)	1-9
P, A	WO 2015/072463 A1 (日本農薬株式会社) 2015.05.21, 全文 (ファミリーなし)	1-9