

(19) 日本国特許庁(JP)

再公表特許(A1)

(11) 国際公開番号

W02009/072621

発行日 平成23年4月28日 (2011. 4. 28)

(43) 国際公開日 平成21年6月11日 (2009. 6. 11)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 207/00 (2006.01)	C07D 207/00 C S P	4C063
C07D 403/04 (2006.01)	C07D 403/04	4C069
A61K 31/40 (2006.01)	A61K 31/40	4C086
A61K 31/4196 (2006.01)	A61K 31/4196	4H011
A61P 33/10 (2006.01)	A61P 33/10	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 168 頁) 最終頁に続く

出願番号 特願2009-544750 (P2009-544750)	(71) 出願人 000003986 日産化学工業株式会社 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1
(21) 国際出願番号 PCT/JP2008/072182	
(22) 国際出願日 平成20年12月5日 (2008. 12. 5)	
(31) 優先権主張番号 特願2007-316833 (P2007-316833)	(74) 代理人 100068618 弁理士 粵 経夫
(32) 優先日 平成19年12月7日 (2007. 12. 7)	(74) 代理人 100104145 弁理士 官崎 嘉夫
(33) 優先権主張国 日本国 (JP)	(74) 代理人 100104385 弁理士 加藤 勉
	(74) 代理人 100156889 弁理士 小山 京子
	(72) 発明者 三田 猛志 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内

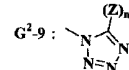
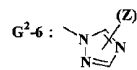
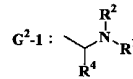
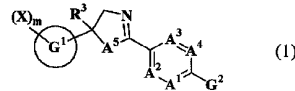
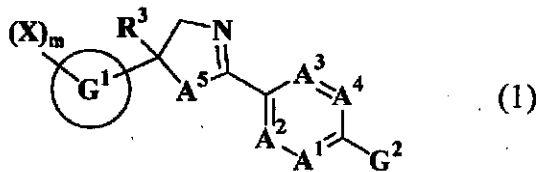
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】置換ジヒドロアゾール化合物及び有害生物防除剤

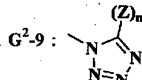
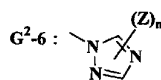
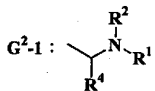
(57) 【要約】

【課題】新規な有害生物防除剤、特に殺虫剤又は殺ダニ剤を提供する。

【解決手段】一般式(1)：



[式中、A¹、A²、A³及びA⁴は各々独立してC-Y又はNを表し、A⁵は-CH₂-等を表し、G¹はベンゼン環等を表し、G²は、G²-1、G²-6、G²-9等で表される構造を表し、

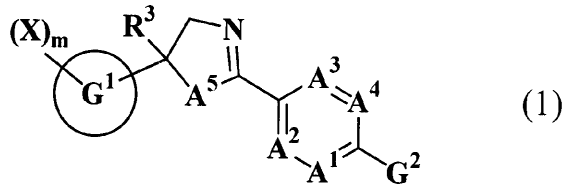


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式(1)：

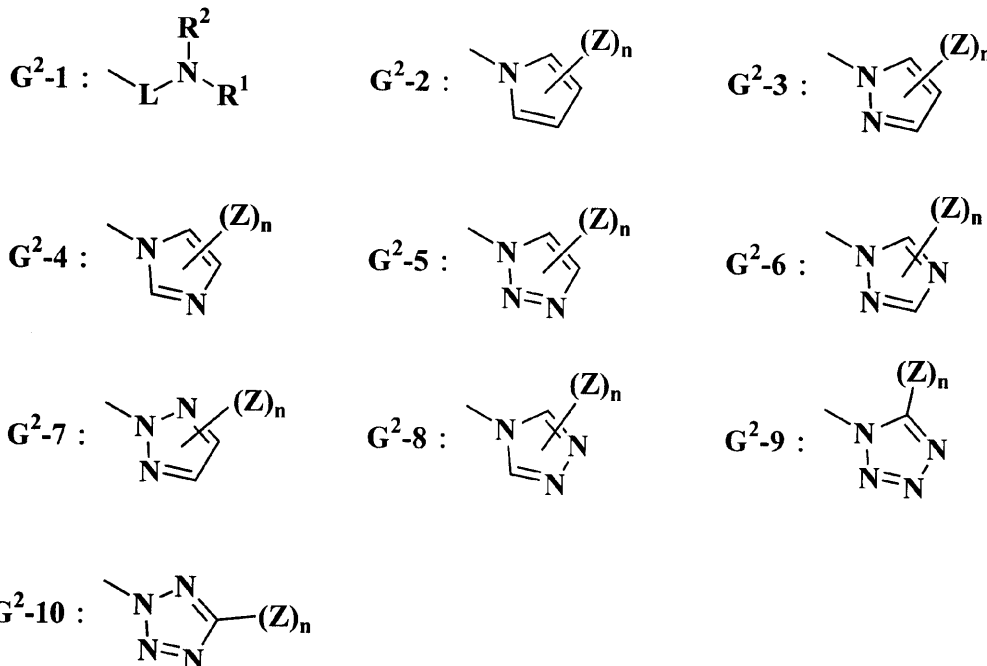
【化 1】



10

[式中、A¹、A²、A³及びA⁴は、各々独立してC-Y又はNを表し、A⁵は、-CH(R^{3a})-、O又はSを表し、G¹は、ベンゼン環、含窒素6員芳香族複素環、フラン環、チオフェン環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれるヘテロ原子を2個以上含む5員芳香族複素環を表し、G²は、G²-1~G²-10で表される構造を表し、

【化 2】



20

30

Lは、-C(R⁴)(R^{4a})-、-C(R⁴)(R^{4a})CH₂-、-CH₂C(R⁴)(R^{4a})-、-N(R^{4b})-、-C(R⁴)(R^{4a})N(R^{4b})-又は単結合を表し、

Xは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-SCN、-SF₅、C₁~C₆アルキル、R⁵によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、R⁵によって任意に置換された(C₃~C₈)シクロアルキル、E1~E19、C₂~C₆アルケニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルケニル、C₅~C₁₀シクロアルケニル、C₅~C₁₀ハロシクロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルキニル、-OH、-OR⁶、-OS(O)₂R⁶、-SH、-S(O)_tR⁶、-N(R⁸)R⁷、-N=C(R^{8a})R^{7a}、-C(O)R⁹、-C(R⁹)=NOH、-C(R⁹)=NOR¹⁰、M3、M13、M30、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)N(R¹²)R¹¹、-C(S)OR¹⁰、-C(S)SR¹⁰、-C(S)N(R¹²)R¹¹、M23~M26、M28、M29、-S(O)₂OR¹⁰、-S(O)₂N(R¹²)R¹¹、-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1~D38を表し、mが2以上の整数を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つのXが隣接する場合には、隣接する2つのXは-CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂O-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-、-CH₂SCH₂-、-CH₂CH₂N(R¹⁴)-、-CH₂N(R¹⁴)CH₂-、-CH₂CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂O-、-CH₂CH₂OCH₂-、-CH₂OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂S-、-CH₂CH=CH-、-OCH=CH-、-SCH=CH-、-N(R¹⁴)CH=CH-、-OCH=N-、-SCH=N-、-N(R¹⁴)CH=N-、-N(R¹⁴)N=CH

50

-, -CH=CHCH=CH-, -OCH₂CH=CH-, -N=CHCH=CH-, -N=CHCH=N- 又は -N=CHN=CH- を形成することにより、それぞれのXが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZ^aによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZ^aで置換されている場合、各々のZ^aは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-SCN、-SF₅、C₁~C₆アルキル、R⁵によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、R⁵によって任意に置換された(C₃~C₈)シクロアルキル、E1~E19、C₂~C₆アルケニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルケニル、C₂~C₆アルキニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルキニル、-OH、-OR⁶、-OS(O)₂R⁶、-SH、-S(O)_rR⁶、-N(R⁸)R⁷、-N(R⁸)C(O)R^{9a}、
10
-N=C(R^{8a})R^{7a}、-C(O)N(R¹²)R¹¹、-C(S)N(R¹²)R¹¹、-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1~D38を表し、Yが同時に2個以上存在するとき、各々のYは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つのYが隣接する場合には、隣接する2つのYは-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -SCH₂S-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂OCH₂-, -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂S-, -SCH₂CH₂S-, -OCH=N-, -SCH=N-, -CH=CHCH=CH-, -CH=CHCH=N-, -CH=CHN=CH-, -CH=NCH=CH- 又は -N=CHCH=CH- を形成することにより、それぞれのYが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZ^aによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZ^aで置換されている場合、各々のZ^aは互いに同一であ
20
っても又は互いに相異なってもよく、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₆アルキル、R⁵によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、-OH、-OR⁶、-OS(O)₂R⁶、-SH、-S(O)_rR⁶、-N(R⁸)R⁷、-C(O)R⁹、-C(R⁹)=NOH、-C(R⁹)=NOR¹⁰、M3、M13、M30、-C(O)OR¹⁰、-C(OSR¹⁰)、-C(O)N(R^{12a})R^{11a}、-C(S)OR¹⁰、-C(S)SR¹⁰、-C(S)N(R^{12a})R^{11a}、M23~M26、M28、M29、-S(O)₂OR¹⁰、-S(O)₂N(R¹²)R¹¹、
-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、フェニル又は(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニルを表し、nが2以上の整数を表すとき、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH=CH-CH=CH- を形成することにより縮合環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄アルコキシ基又はC₁~C₄アルキルチオ基によって任意に置換されていてもよく、

Z^aは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄ハロアルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄アルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄ハロアルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄アルキルスルフィニル(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄ハロアルキルスルフィニル(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄アルキルスルホニル(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄ハロアルキルスルホニル(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₃~C₆ハロシクロアルキル、-OH、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルスルホニルオキシ、C₁~C₆ハロアルキルスルホニルオキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~
40
C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、-NH₂、C₁~C₆アルキルアミノ、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノ、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル、-C(O)NH₂、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルアミノカルボニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニル、-C(S)NH₂、-S(O)₂NH₂、C₁~C₆アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノスルホニル又はフェニルを表し、p又はp1が2以上の整数を表すとき、各々のZ^aは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つのZ^aが隣接する場合には、隣接する2つのZ^aは-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂OCH₂-, -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -CH₂CH₂CH₂S-, -OCH₂CH₂S- 又は -CH=CH-CH=CH- を形成する

10

20

30

40

50

ことにより、それぞれのZ^aが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₄アルコキシ基又はC₁~C₄アルキルチオ基によって任意に置換されていてもよく、

R¹は、水素原子、-C(O)R^{1a}、-C(O)OR^{1b}、-C(O)SR^{1b}、-C(O)N(R^{1d})R^{1c}、-C(S)R^{1a}、-C(S)OR^{1b}、-C(S)SR^{1b}、-C(S)N(R^{1d})R^{1c}、-S(O)₂R^{1b}又は-S(O)₂N(R^{1d})R^{1c}を表し、

R^{1a}は、水素原子、C₁~C₁₂アルキル、R¹⁵によって任意に置換された(C₁~C₁₂)アルキル、C₃~C₁₂シクロアルキル、R¹⁵によって任意に置換された(C₃~C₁₂)シクロアルキル、E1~E21、C₂~C₁₂アルケニル、R¹⁵によって任意に置換された(C₂~C₁₂)アルケニル、C₅~C₁₂シクロアルケニル、C₅~C₁₂ハロシクロアルケニル、C₂~C₁₂アルキニル、R¹⁵によって任意に置換された(C₂~C₁₂)アルキニル、-C(O)R⁹、-C(O)R^{9a}、-C(R⁹)=NOH、-C(R⁹)=NOR¹⁰、-C(R⁹)=NN(R¹⁷)R¹⁶、-C(O)OR¹⁰、-C(O)N(R¹²)R¹¹、M4、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1~D38を表し、

R^{1b}は、C₁~C₁₂アルキル、R¹⁵によって任意に置換された(C₁~C₁₂)アルキル、C₃~C₁₂シクロアルキル、R¹⁵によって任意に置換された(C₃~C₁₂)シクロアルキル、E2~E6、E12~E19、C₂~C₁₂アルケニル、C₂~C₁₂ハロアルケニル、C₃~C₁₂アルキニル、C₃~C₁₂ハロアルキニル、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル、D1、D2、D4~D6、D8~D10、D12~D19、D21、D23、D25、D27又はD30~D38を表し、

R^{1c}は、水素原子、C₁~C₁₂アルキル、R¹⁵によって任意に置換された(C₁~C₁₂)アルキル、C₃~C₁₂シクロアルキル、R¹⁵によって任意に置換された(C₃~C₁₂)シクロアルキル、E2~E6、E12~E19、C₂~C₁₂アルケニル、C₂~C₁₂ハロアルケニル、C₃~C₁₂アルキニル、C₃~C₁₂ハロアルキニル、-C(O)R⁹、-C(O)R^{9a}、-C(R⁹)=NOR¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)N(R¹²)R¹¹、M7、M17、-C(S)R⁹、-C(S)OR¹⁰、-C(S)SR¹⁰、-C(S)N(R¹²)R¹¹、M9、M19、-OR¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、-S(O)₂N(R¹²)R¹¹、-N(R¹⁷)R¹⁶、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル、D1~D25又はD27~D38を表し、

R^{1d}は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、シアノ(C₁~C₆)アルキル、フェニル(C₁~C₄)アルキル、C₃~C₆アルケニル又はC₃~C₆アルキニルを表すか、或いは、R^{1d}はR^{1c}と一緒にC₂~C₆アルキレン鎖を形成することにより、R^{1c}及びR^{1d}が結合する窒素原子と共に3~7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つC₁~C₆アルキル基、-CHO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、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル基、C₁~C₆ハロアルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニル基、オキソ基又はチオキソ基によって任意に置換されていてもよく、

R²は、水素原子、シアノ、C₁~C₁₂アルキル、R^{15a}によって任意に置換された(C₁~C₁₂)アルキル、C₃~C₁₂シクロアルキル、C₃~C₁₂アルケニル、C₃~C₁₂ハロアルケニル、C₃~C₁₂アルキニル、C₃~C₁₂ハロアルキニル、-C(O)R⁹、-C(O)R^{9a}、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)N(R¹²)R¹¹、-C(O)C(O)OR¹⁰、-C(S)OR¹⁰、-C(S)SR¹⁰、-C(S)N(R¹²)R¹¹、C₁~C₁₂アルコキシ、C₁~C₁₂ハロアルコキシ、-SR¹⁰、-S(O)₂R¹⁰、-SN(R^{17a})R^{16a}、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD32を表すか、或いは、R²はR¹と一緒にC₄~C₆アルキレン鎖を形成することにより、R¹及びR²が結合する窒素原子と共に5~7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルキリデン基、-CHO基、C₁~C₆アルキルカルボニル基、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル基、C₁~C₆アルコキシカルボニル基、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル基、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル基、C₁~C₆ハロアルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁~C₆アルキル)アミノカルボニル基、フェニル基、D32基、D34基、オキソ基又はチオキソ基によって任意に置換されていてもよく、

R³は、ハロゲン原子、シアノ、C₁~C₆アルキル、R⁵によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、R⁵によって任意に置換された(C₃~C₈)シクロアルキル

10

20

30

40

50

、E1～E19、C₃～C₆アルケニル、R⁵によって任意に置換された(C₂～C₆)アルケニル、C₃～C₆アルキニル、R⁵によって任意に置換された(C₂～C₆)アルキニル、-OR⁶、-S(O)_rR⁶、-N(R¹²)R¹¹、-C(O)R⁹、-C(R⁹)=NOH、-C(R⁹)=NOR¹⁰、M3、M13、M30、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)N(R¹²)R¹¹、-C(S)OR¹⁰、-C(S)SR¹⁰、-C(S)N(R¹²)R¹¹、-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、-P(O)(OR¹⁸)₂、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1～D38を表し、

R^{3a}は、水素原子、C₁～C₆アルキル又はC₁～C₆ハロアルキルを表し、

R⁴は、水素原子、シアノ、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、-C(O)NH₂、-C(S)NH₂、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル、D1、D2、D9、D10又はD32を表し、

R^{4a}は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表すか、或いは、R^{4a}はR⁴と一緒にC₂～C₅アルキレン鎖を形成することにより、R⁴及びR^{4a}が結合する炭素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つC₁～C₄アルキル基、-CHO基、C₁～C₄アルキルカルボニル基、C₁～C₄アルコキシカルボニル基、C₁～C₄アルキルアミノカルボニル基、C₁～C₄ハロアルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁～C₄アルキル)アミノカルボニル基又はフェニル基によって任意に置換されていてもよく、

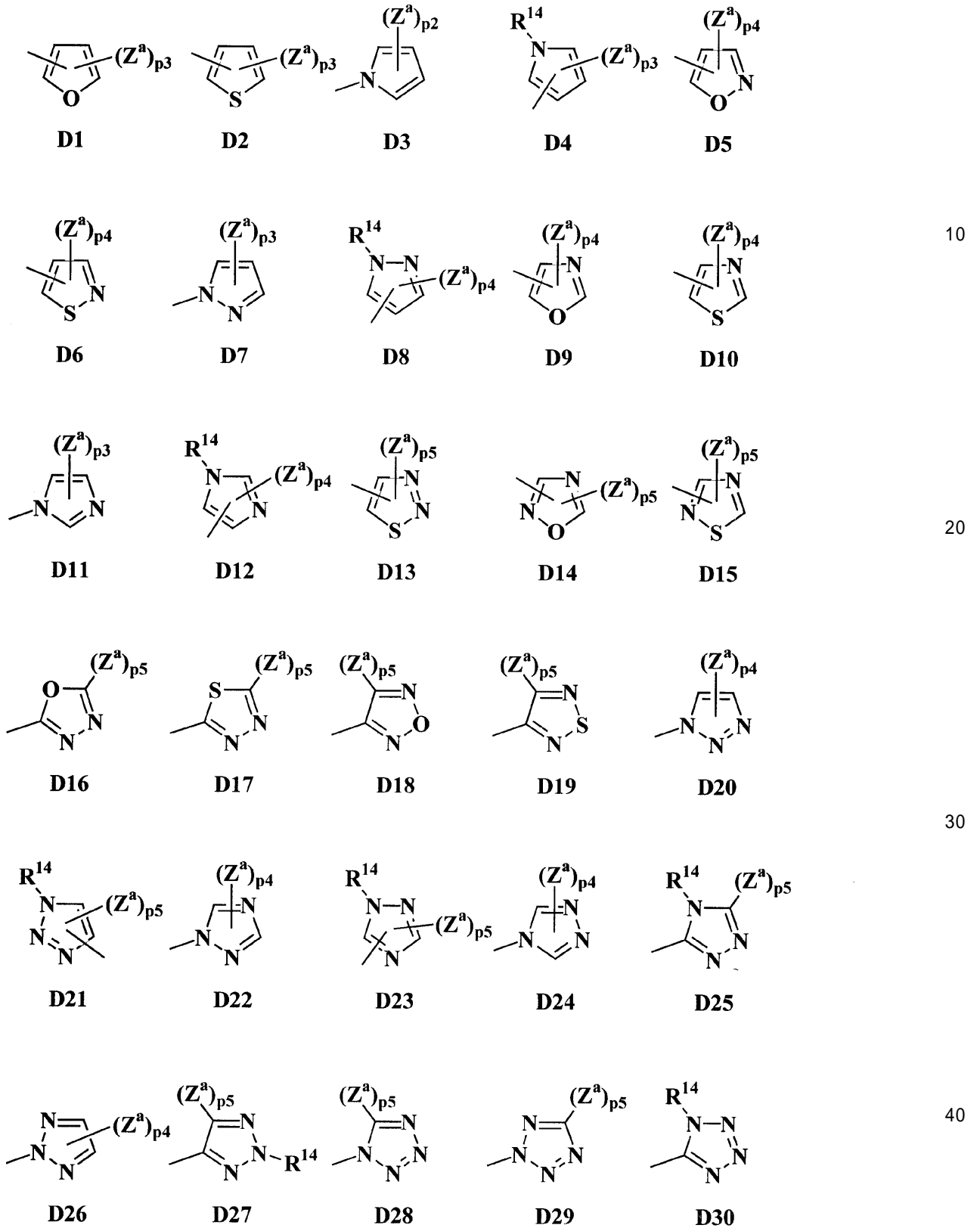
R^{4b}は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₃～C₆シクロアルキルカルボニル、C₃～C₆ハロシクロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル又はC₁～C₆ハロアルコキシカルボニルを表し、

D1～D38は、それぞれ下記の構造式で表される芳香族複素環を表し、

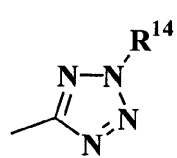
10

20

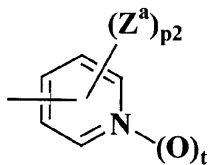
【化 3】



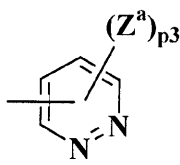
【化4】



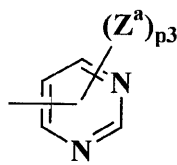
D31



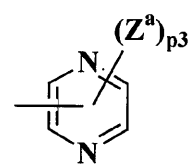
D32



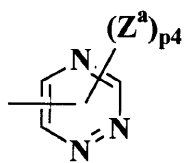
D33



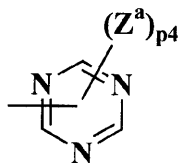
D34



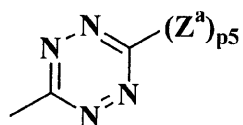
D35



D36



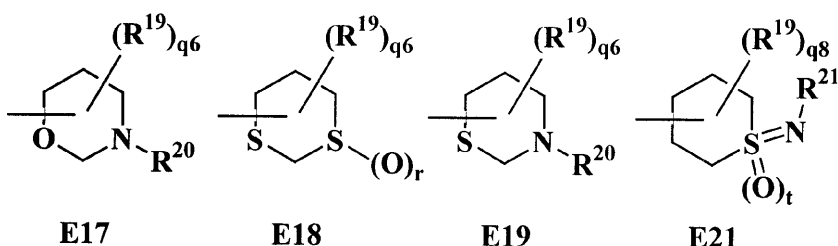
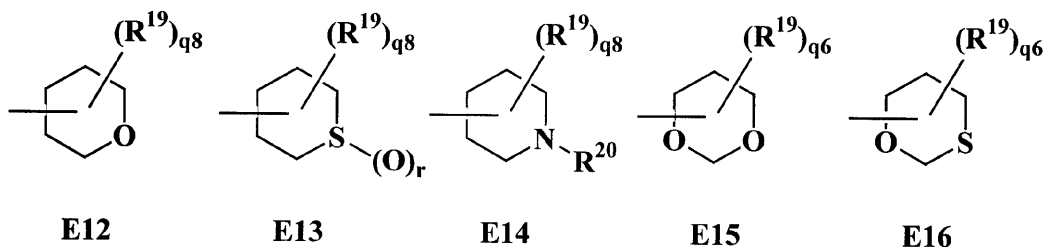
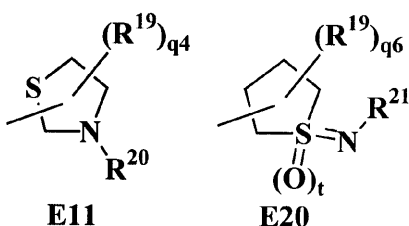
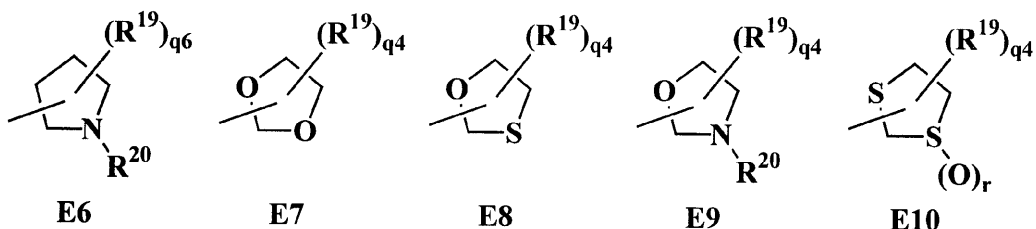
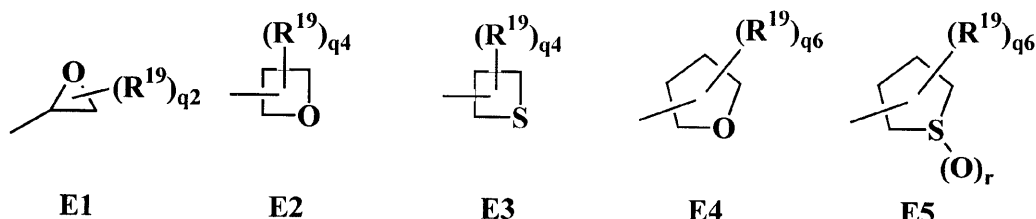
D37



D38

E1 ~ E21は、それぞれ下記の構造式で表される飽和複素環を表し、

【化5】



R⁵は、ハロゲン原子、シアノ、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、E1~E19、-OH、-OR⁶、-SH、-S(O)_rR⁶、-N(R⁸)R⁷、-N(R⁸)C(O)R^{9a}、-C(O)OR¹⁰、-C(O)N(R¹²)R¹¹、-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1~D38を表し、

R⁶は、C₁~C₆アルキル、R²²によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、R²²によって任意に置換された(C₃~C₈)シクロアルキル、E2~E6、E12~E15、E18、C₂~C₆アルケニル、R²²によって任意に置換された(C₂~C₆)アルケニル、C₅~C₁₀シクロアルケニル、C₅~C₁₀ハロシクロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、R²²によって任意に置換された(C₃~C₆)アルキニル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル、D1、D2、D4~D6、D8~D10、D12~D19、D21、D23、D25、D27又はD30~D38を表し、

R⁷は、水素原子、C₁~C₆アルキル、R²²によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアル

10

20

30

40

50

ケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{11}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{12})R^{11}$ 、 $-C(O)C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-OH$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})R^{11}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 又は $-P(S)(OR^{18})_2$ を表し、

R^8 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表すか、或いは、 R^8 は R^7 と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^7 及び R^8 が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、オキソ基又はチオキソ基によって任意に置換されていてもよく、

10

R^{7a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、フェノキシ又は $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェノキシを表し、

R^{8a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、フェニル又は $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニルを表すか、或いは、 R^{8a} は R^{7a} と一緒になって $C_4 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{7a} 及び R^{8a} が結合する炭素原子と共に5～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子1個を含んでいてもよく、

R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E4～E6、E12～E14、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル又は $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルを表し、

20

R^{9a} は、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル、ナフチル又はD1～D38を表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E2～E6、E12～E19、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル、D1、D2、D4～D6、D8～D10、D12～D19、D21、D23、D25、D27又はD30～D38を表し、

R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E2～E6、E12～E19、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル、D1～D25又はD27～D38を表し、

30

R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表すか、或いは、 R^{12} は R^{11} と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-CHO$ 基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基によって任意に置換されていてもよく、

40

R^{11a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 R^{22} によって置換されたシクロプロピル、E4、E5、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $-CH=NOR^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{11}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-N(R^{12b})R^{11b}$ 、D34又はD35を表し、

R^{12a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22a} によって置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオを表すか、或いは、 R^{12a} は R^{11a} と一緒になって $=C(R^{12c})R^{11c}$ を形成してもよく、

R^{11b} は、フェニル、D32又はD34を表し、

R^{12b} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル又は $C_3 \sim C_4$ アルキニルを表し、

R^{11c} は、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し、

50

R^{12c} は、 $-NH_2$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノを表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{13a} 及び R^{13b} は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^{14} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、フェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、

さらに、 R^{14} の隣接位に Z^a が存在する場合には、隣接する R^{14} と Z^a とは $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-CH=CH-$ 、 $-N=CH-CH=CH-$ 、 $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ 又は $-CH=CH-CH=N-$ を形成することにより、 R^{14} 及び Z^a のそれぞれが結合する原子と共に 6 員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基によって任意に置換されていてもよく、

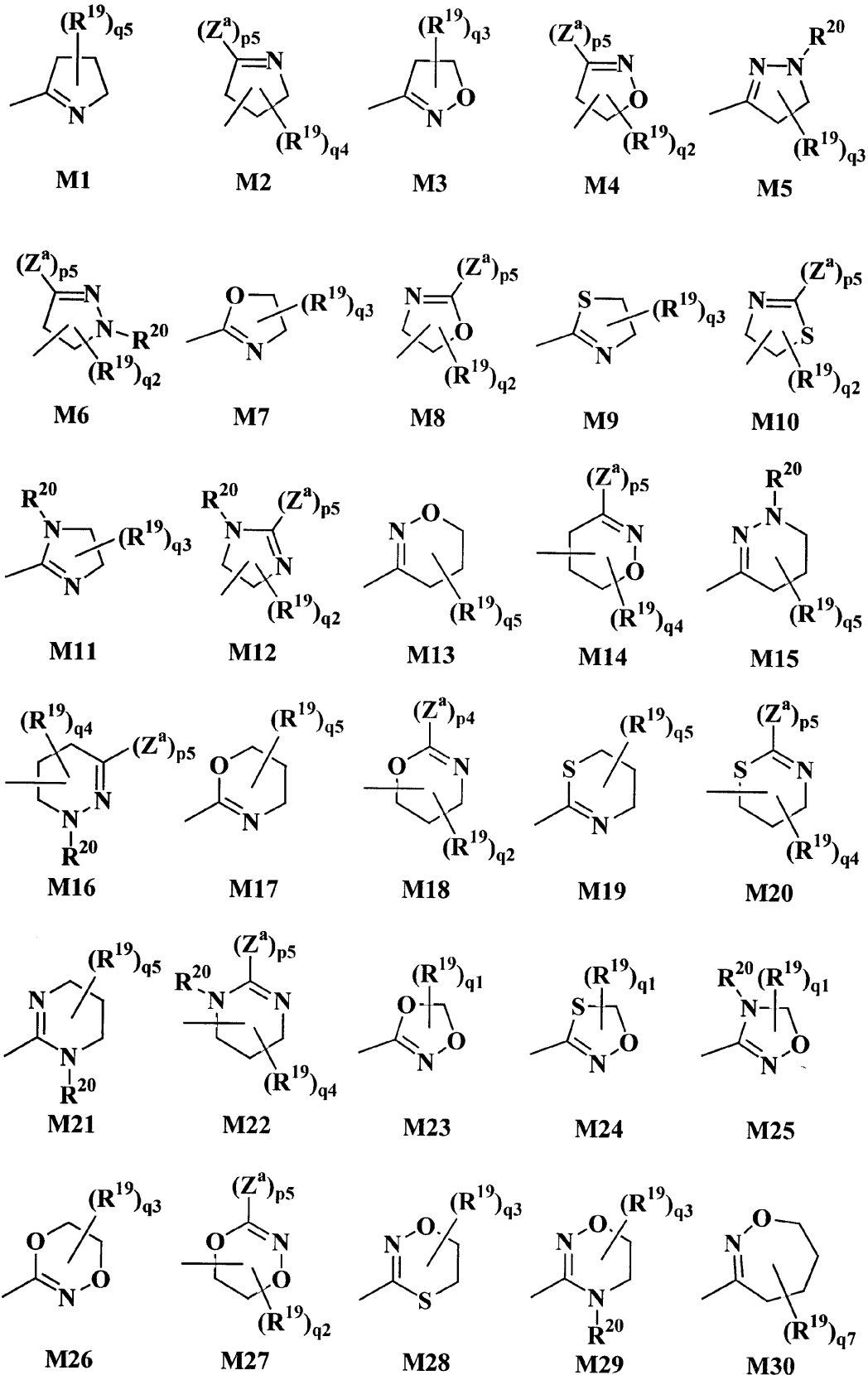
R^{15} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、ヒドロキシ ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $E1 \sim E21$ 、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、 $-OR^{23}$ 、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_t R^{25}$ 、 $-S(O)_t (R^{25})=NR^{21}$ 、 $-C(O)R^{26}$ 、 $-C(R^{26})=NOH$ 、 $-C(R^{26})=NOR^{27}$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OR^{27}$ 、 $-C(O)SR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 、 $-C(O)N(R^{29})OR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})N(R^{28a})R^{28}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{27}$ 、 $-C(S)OR^{27}$ 、 $-C(S)SR^{27}$ 、 $-C(S)N(R^{29})R^{28}$ 、 $-C(=NR^{28})OR^{27}$ 、 $-C(=NR^{28})SR^{27}$ 、 $-C(=NR^{29})N(R^{28a})R^{28}$ 、 $-C(=NOR^{27})N(R^{29})R^{28}$ 、 $-S(O)_2OH$ 、 $-S(O)_2OR^{27}$ 、 $-S(O)_2N(R^{29})R^{28}$ 、 $-Si(R^{13a})(R^{13b})R^{13}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、 $-P(\text{フェニル})_2$ 、 $-P(O)(\text{フェニル})_2$ 、 $M1 \sim M30$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、ナフチル又は $D1 \sim D38$ を表し、

$M1 \sim M30$ は、それぞれ下記の構造式で表される部分飽和複素環を表し、

10

20

【化6】



10

20

30

40

R^{15a} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、E4、E5、E12、E13、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $-OR^{23}$ 、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-S(O)_rR^{25}$ 、 $-C(O)R^{26}$ 、 $-C(R^{26})=NOH$ 、 $-C(R^{26})=NOR^{27}$ 、M3、 $-C(O)OR^{27}$ 、 $-C(O)SR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 、M7、M17、 $-C(S)OR^{27}$ 、 $-C(S)SR^{27}$ 、 $-C(S)N(R^{29})R^{28}$ 、M9、M19、 $-C(O)C(O)OR^{27}$ 、 $-S(O)_2N(R^{29})R^{28}$ 、 $-Si(R^{13a})(R^{13b})R^1$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル、D1~D

50

3、D7、D10、D11、D22又はD32～D35を表し、

R^{16} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E2～E6、E12～E19、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-C(O)R^{26}$ 、 $-C(O)OR^{27}$ 、 $-C(O)SR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 、 $-C(S)R^{26}$ 、 $-C(S)OR^{27}$ 、 $-C(S)SR^{27}$ 、 $-C(S)N(R^{29})R^{28}$ 、 $-S(O)_2R^{27}$ 、 $-S(O)_2N(R^{29})R^{28}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D1～D25又はD27～D38を表し、

R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルを表すか、或いは、 R^{17} は R^{16} と一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{16} 及び R^{17} が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ($C_1 \sim C_2$)アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-CHO$ 基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基によって任意に置換されていてもよく、

R^{16a} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)ON=C(CH_3)SCH_3$ 、 $-C(O)ON=C(SCH_3)C(O)N(CH_3)_2$ 、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{17a} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表すか、或いは、 R^{17a} は R^{16a} と一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{16a} 及び R^{17a} が結合する窒素原子と共に5～8員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を1個含んでいてもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

R^{18} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^{19} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、 $q_1 \sim q_8$ が2以上の整数を表すとき、各々の R^{19} は互いに同一であっても、または互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{19} が同一の炭素原子上に置換している場合、2つの R^{19} は一緒になってオキソ、チオキソ、イミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルイミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシイミノ又は $C_1 \sim C_4$ アルキリデンを形成してもよく、

R^{20} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $-OH$ 、ベンジルオキシ、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 、 $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-C(S)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-S(O)_2R^{32}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル又はD3を表し、

R^{21} は、水素原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ア

10

20

30

40

50

ルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、

R^{22} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E1~E19、 $-OR^{23}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-C(O)R^{26}$ 、 $-C(R^{26})=NOR^{27}$ 、 $-C(O)OR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル又はD1~D38を表し、

R^{22a} は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OR^{23}$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルチオを表し、

R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_8$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、E2~E6、E12~E19、 $C_3 \sim C_8$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)アルキニル、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 、 $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-C(O)C(O)R^{32}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{32}$ 、 $-C(S)R^{31}$ 、 $-C(S)OR^{32}$ 、 $-C(S)SR^{32}$ 、 $-C(S)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-S(O)_2R^{32}$ 、 $-S(O)_2N(R^{34})R^{33}$ 、 $-Si(R^{13a})(R^{13b})R^{13}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D1、D2、D4~D6、D8~D10、D12~D19、D21、D23、D25、D27又はD30~D38を表し、

R^{24} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表すか、或いは、 R^{24} は R^{23} と一緒に $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{23} 及び R^{24} が結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-CHO$ 基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル基、オキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{25} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_8$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、E2~E6、E12~E19、 $C_3 \sim C_8$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)アルキニル、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 、 $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-C(O)C(O)R^{32}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{32}$ 、 $-C(S)R^{31}$ 、 $-C(S)OR^{32}$ 、 $-C(S)SR^{32}$ 、 $-C(S)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-SH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、フェニルチオ、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルチオ、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D9、D10、D12、D14~D17、D30又はD32~D35を表し、

R^{26} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{27} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、E2~E6、E12~E19、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_2 \sim C_6$)アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)アルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D1、D2、D4~D6、D8~D10、D12~D19、D21、D23、D25、D27又はD30~D38を表し、

R^{28} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、E1~E6

10

20

30

40

50

、E12～E19、C₂～C₆アルケニル、R³⁰によって任意に置換された(C₂～C₆)アルケニル、C₃～C₈アルキニル、R³⁰によって任意に置換された(C₃～C₆)アルキニル、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル、D1～D25又はD27～D38を表し、

R^{28a}は、水素原子又はC₁～C₄アルキルを表し、

R²⁹は、水素原子、C₁～C₆アルキル、R³⁰によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₆アルケニル、C₃～C₆ハロアルケニル、C₃～C₆アルキニル、C₃～C₆ハロアルキニル、フェニル又は(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニルを表すか、或いは、R²⁹はR²⁸と一緒になってC₂～C₅アルキレン鎖を形成することにより、R²⁸及びR²⁹が結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、C₁～C₄アルキル基、C₁～C₄アルコキシ基、-CHO基、C₁～C₄アルキルカルボニル基、C₁～C₄アルコキシカルボニル基、フェニル基、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル基又はオキシ基によって任意に置換されていてもよく、

10

R³⁰は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、E4、E5、E7、E8、E10、E12、E13、E15、E16、E18、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、-OH、-OR³²、-OC(O)R³¹、-OC(O)OR³²、-OC(O)N(R³⁴)R³³、-OC(S)N(R³⁴)R³³、-SH、-S(O)_rR³²、-SC(O)R³¹、-SC(O)OR³²、-SC(O)N(R³⁴)R³³、-SC(S)N(R³⁴)R³³、-N(R³⁴)R³³、-N(R³⁴)CHO、-N(R³⁴)C(O)R³¹、-N(R³⁴)C(O)OR³²、-N(R³⁴)C(O)N(R³⁴)R³³、-N(R³⁴)C(S)N(R³⁴)R³³、-N(R³⁴)S(O)₂R³²、-C(O)R³¹、-C(O)OH、-C(O)OR³²、-C(O)SR³²、-C(O)N(R³⁴)R³³、-C(O)C(O)OR³²、-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、-P(O)(OR¹⁸)₂、-P(S)(OR¹⁸)₂、-P(フェニル)₂、-P(O)(フェニル)₂、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1～D38を表し、

20

R³¹は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、R³⁵によって任意に置換された(C₁～C₄)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、E4、E5、E12、E13、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈ハロアルケニル、C₅～C₁₀シクロアルケニル、C₅～C₁₀ハロシクロアルケニル、C₂～C₈アルキニル、C₂～C₈ハロアルキニル、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1～D38を表し、

R³²は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、R³⁵によって任意に置換された(C₁～C₄)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、E4、E5、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈ハロアルケニル、C₃～C₈アルキニル又はフェニルを表し、

30

R³³は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、R³⁵によって任意に置換された(C₁～C₄)アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、E4、E5、E12、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈ハロアルケニル、C₃～C₈アルキニル、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル、D1～D25又はD27～D38を表し、

R³⁴は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₆アルケニル又はC₃～C₆アルキニルを表すか、或いは、R³⁴はR³³と一緒になってC₂～C₅アルキレン鎖を形成することにより、R³³及びR³⁴が結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、C₁～C₄アルキル基、C₁～C₄アルコキシ基、-CHO基、C₁～C₄アルキルカルボニル基、C₁～C₄アルコキシカルボニル基、フェニル基又は(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル基によって任意に置換されていてもよく、

40

R³⁵は、シアノ、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、E4、E5、E12、E13、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、フェノキシ、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェノキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルチオ、フェニルチオ、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニルチオ、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニルスルホニル、-N(R³⁷)R³⁶、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、ジ(C₁～C₆アルキル)アミノカルボニル、トリ(C₁～C₄アルキル)シリル、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル、ナフチル又はD1～D38を表し、

R³⁶は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキル

50

カルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、フェニルカルボニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルカルボニルを表し、

R^{37} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

m は、0～5の整数を表し、

n は、0～4の整数を表し、

p_1 は、1～5の整数を表し、

p_2 は、0～4の整数を表し、

p_3 は、0～3の整数を表し、

p_4 は、0～2の整数を表し、

p_5 は、0又は1の整数を表し、

q_1 は、0～2の整数を表し、

q_2 は、0～3の整数を表し、

q_3 は、0～4の整数を表し、

q_4 は、0～5の整数を表し、

q_5 は、0～6の整数を表し、

q_6 は、0～7の整数を表し、

q_7 は、0～8の整数を表し、

q_8 は、0～9の整数を表し、

r は、0～2の整数を表し、

t は、0又は1の整数を表す。]

10

20

で表される置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

【請求項2】

A^1 、 A^2 及び A^4 は、各々独立してC-Y又はNを表し、

A^3 は、C-H又はNを表し、

G^1 は、ベンゼン環を表し、

G^2 は、 G^2-1 、 G^2-3 、 G^2-5 、 G^2-6 、 G^2-8 又は G^2-9 で表される構造を表し、

L は、 $-C(R^4)(R^{4a})-$ 、 $-C(R^4)(R^{4a})CH_2-$ 、 $-N(R^{4b})-$ 又は $-C(R^4)(R^{4a})N(R^{4b})-$ を表し、

X は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_4$)ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)ハロアルキル、 $-OR^6$ 、 $-S(O)_rR^6$ 又は $-NH_2$ を表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の X は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

30

さらに、2つの X が隣接する場合には、隣接する2つの X は $-CF_2OCF_2-$ 、 $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2OCF_2O-$ 又は $-OCF_2CF_2O-$ を形成することにより、それぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、

Y は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 R^5 によって置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-OR^6$ 、 $-S(O)_rR^6$ 、 $-N(R^8)R^7$ 、 $-C(S)NH_2$ 、 $D1 \sim D3$ 、 $D7$ 、 $D11$ 又は $D22$ を表し、 Y が2個以上存在するとき、各々の Y は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの Y が隣接する場合には、隣接する2つの Y は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

40

Z は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR^6$ 、 $-S(O)_rR^6$ 、 $-NH_2$ 、 $-C(O)N(R^{12a})R^{11a}$ 又は $-C(S)N(R^{12a})R^{11a}$ を表し、

R^1 は、水素原子、 $-C(O)R^{1a}$ 、 $-C(O)OR^{1b}$ 、 $-C(O)SR^{1b}$ 、 $-C(O)N(R^{1d})R^{1c}$ 、 $-C(S)R^{1a}$ 又は $-C(S)N(R^{1d})R^{1c}$ を表し、

R^{1a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $E4$ 、 $E5$ 、 $E10$ 、 $E13$ 、 $E20$ 、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-CH=NOR^{10}$ 、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、 $D2$ 、 $D8$ 又は $D32$ を表し、

Z^a は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し、 p_1 及び p_2 が2以上の整数を表すとき、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異

50

なっているもよく、

R^{1b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し、

R^{1c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $-N(R^{17})R^{16}$ を表し、

R^{1d} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{1d} は R^{1c} と一緒に $C_4 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{1c} 及び R^{1d} が結合する窒素原子と共に5～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を1個含んでいてもよく、且つメチル基又はオキソ基によって任意に置換されていてもよく、

R^2 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{15a} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキルを表し、

R^{3a} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^4 は、水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(S)NH_2$ 、フェニル、D9又はD10を表し、

R^{4a} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表すか、或いは、 R^{4a} は R^4 と一緒にエチレン鎖を形成することにより、 R^4 及び R^{4a} が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成してもよく、

R^{4b} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^5 は、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルを表し、

R^6 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ($C_1 \sim C_4$)ハロアルキルを表し、

R^7 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

R^8 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{11a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 R^{22} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、E4、 $-CH=NOR^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-N(R^{12b})R^{11b}$ 、D34又はD35を表し、

R^{12a} は、水素原子、 R^{22a} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、シクロプロピルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{11b} は、フェニル又はD34を表し、

R^{12b} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{15} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-S(O)_t R^{25}$ 、 $-S(O)_t (R^{25})=NR^{21}$ 又は $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ を表し、

R^{15a} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、

R^{16} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{17} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{21} は、水素原子、シアノ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニルを表し、

R^{22} は、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルアミノカルボニル、D10又はD32を表し、

R^{22a} は、シアノ又は $-OR^{23}$ を表し、

R^{23} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シアノ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルを表し、

10

20

30

40

50

R^{24} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルを表し、

R^{25} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 又は $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ を表し、

R^{28} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル又はシクロプロピルメチルを表し、

R^{29} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{30} は、ハロゲン原子、シアノ又は $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ を表し、

R^{31} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、D7、D11又はD22を表し、

R^{32} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、

R^{34} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

mは、1～3の整数を表し、

nは、0又は1の整数を表し、

p1は、1～3の整数を表し、

p2は、0～2の整数を表し、

p3及びp4は、0又は1の整数を表し、

q4、q6及びq8は、0を表す請求項1に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。 20

【請求項3】

A^1 は、C-Y又はNを表し、

A^2 及び A^3 は、C-Hを表し、

A^4 は、C-H又はNを表し、

A^5 は、 $-CH_2-$ 又はSを表し、

Lは、 $-C(R^4)(R^{4a})-$ を表し、

Xは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオを表し、mが2又は3を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ又は $-C(S)NH_2$ を表し、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-C(O)NHR^{11a}$ 又は $-C(S)NHR^{11a}$ を表し、

R^3 は、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、

R^4 は、水素原子、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、エチニル、 $-C(S)NH_2$ 又はD10を表し、

R^{4a} は、水素原子を表すか、或いは、 R^{4a} は R^4 と一緒にエチレン鎖を形成することにより、 R^4 及び R^{4a} が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成してもよく、

R^{11a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 R^{22} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、シクロプロピル、E4又は $-CH=NOR^{10}$ を表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_2$ アルキルを表し、

R^{22} は、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルアミノカルボニル、D10又はD32を表す請求項2に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

【請求項4】

A^5 は、 $-CH_2-$ を表し、

G^2 は、 G^2-1 、 G^2-6 又は G^2-9 で表される構造を表し、

Lは、 $-CH(R^4)-$ を表し、

Xは、ハロゲン原子、シアノ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ又はC 50

$C_1 \sim C_2$ ハロアルキルチオを表し、 m が2又は3を表すとき、各々の X は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Y は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルチオ又は $-C(S)NH_2$ を表し、

Z は、ハロゲン原子、ニトロ、メチル又は $-NH_2$ を表し、

R^1 は、 $-C(O)R^{1a}$ 、 $-C(O)SR^{1b}$ 、 $-C(O)N(R^{1d})R^{1c}$ 又は $-C(S)R^{1a}$ を表し、

R^{1a} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、E4、E5、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、(Z^a) p_1 によって置換されたフェニル又はD32を表し、

Z^a は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し、 p_1 及び p_2 が2以上の整数を表すとき、各々の Z^a は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{1b} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、

R^{1c} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は $C_3 \sim C_4$ アルキニルを表し、

R^{1d} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^2 は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 R^{15a} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル又は $C_3 \sim C_4$ アルキニルを表し、

R^3 は、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルを表し、

R^4 は、水素原子、シアノ、メチル、エチニル又は $-C(S)NH_2$ を表し、

R^{15} は、ハロゲン原子、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-S(O)_rR^{25}$ 、 $-S(O)_t(R^{25})=NR^{21}$ 又は $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ を表し、

R^{15a} は、シアノ、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、

R^{21} は、水素原子又は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルカルボニルを表し、

R^{23} は、シアノ($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $-C(O)R^{31}$ 又は $C_1 \sim C_2$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{24} は、水素原子又は $C_1 \sim C_2$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{25} は、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル又はシアノメチルを表し、

R^{28} は、水素原子又は $C_1 \sim C_2$ アルキルを表し、

R^{29} は、水素原子又はメチルを表し、

R^{31} は、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル又はシクロプロピルを表す請求項3に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

【請求項5】

A^1 は、 $C-Y$ を表し、

A^4 は、 $C-H$ を表し、

G^2 は、 G^2-1 で表される構造を表し、

X は、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、 m が2又は3を表すとき、各々の X は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Y は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ又はメチルを表し、

R^1 は、 $-C(O)R^{1a}$ 又は $-C(O)NHR^{1c}$ を表し、

R^{1a} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、シクロプロピル、E4又はE5を表し、

R^{1c} は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、シクロプロピル又はプロパルギルを表し、

R^2 は、水素原子、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、シクロプロピルメチル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシメチル、シアノメチル、アリル又はプロパルギルを表し、

R^3 は、トリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルを表し、

R^4 は、水素原子、シアノ又はメチルを表し、

R^{15} は、シクロプロピル又は $-S(O)_rR^{25}$ を表し、

10

20

30

40

50

R²⁵は、C₁~C₂アルキル又はC₁~C₂ハロアルキルを表す請求項4に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

【請求項6】

A¹は、C-Yを表し、

A⁴は、C-Hを表し、

G²は、G²-6又はG²-9で表される構造を表し、

Xは、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、mが2又は3を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Yは、水素原子、シアノ又はニトロを表し、

R³は、トリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルを表し、

nは、0を表す請求項4に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

10

【請求項7】

請求項1ないし6のいずれか1項に記載の置換ジヒドロアゾール化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する有害生物防除剤。

【請求項8】

請求項1ないし6のいずれか1項に記載の置換ジヒドロアゾール化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する農薬。

【請求項9】

請求項1ないし6のいずれか1項に記載の置換ジヒドロアゾール化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する哺乳動物または鳥類の内部もしくは外部寄生虫防除剤。

20

【請求項10】

請求項1ないし6のいずれか1項に記載の置換ジヒドロアゾール化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する殺虫剤又は殺ダニ剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な置換ジヒドロアゾール化合物及びその塩、並びに該化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤に関するものである。本発明における有害生物防除剤とは、農園芸分野又は畜産・衛生分野（家畜や愛玩動物としての哺乳動物又は鳥類に対する内部もしくは外部寄生虫や家庭内及び業務現場における衛生害虫・不快害虫）等における有害な節足動物を対象とした害虫防除剤を意味する。また、本発明における農薬とは、農園芸分野における殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤及び殺菌剤等を意味する。

30

【背景技術】

【0002】

従来、ビス(置換アリール)置換ジヒドロアゾール化合物に関しては、4-[4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロール-2-イル]-2-メチル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)安息香酸アミド等の4-ジヒドロアゾール置換安息香酸アミド化合物(特許文献1参照。)、2-クロロ-N-シクロプロピルカルボニル-4-[5-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル]ベンジルアミン等のN-アシル-1-(4-ジヒドロイソキサゾール置換フェニル)アルキルアミン化合物(特許文献2参照。)及び5-(3,5-ジクロロフェニル)-3-[4-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)フェニル]-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソキサゾール等の3,5-ビス(置換アリール)置換ジヒドロイソキサゾール化合物(特許文献3参照。)が有害生物防除活性、特に殺虫・殺ダニ活性を示すことが知られている。しかしながら、本発明に係るN-アシル-1-(4-ジヒドロアゾール置換フェニル)アルキルアミン化合物及びビス(置換アリール)置換ジヒドロアゾール化合物に関しては何ら開示されていない。

40

50

また、4 - (4 - アミノフェニル) - 4 - トリフルオロメチル - 2 - 置換フェニル - 4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピロール誘導体、5 - (4 - アミノフェニル) - 5 - トリフルオロメチル - 2 - 置換フェニル - 4, 5 - ジヒドロオキサゾール誘導体及び5 - (4 - アミノフェニル) - 5 - トリフルオロメチル - 2 - 置換フェニル - 4, 5 - ジヒドロチアゾール誘導体が殺虫剤の製造中間体として用いられることが知られており(特許文献4参照。)、さらに、2, 5 - ビス(置換フェニル) - 5 - アルキル - 4, 5 - ジヒドロオキサゾール誘導体の合成の報告(例えば、非特許文献1 ~ 非特許文献4参照。)及び2, 5, 5 - トリス(置換フェニル) - 4, 5 - ジヒドロオキサゾール誘導体の合成の報告(例えば、非特許文献5等参照。)等も知られている。しかしながら、本発明に係るN - アシル - 1 - (4 - ジヒドロアゾール置換フェニル)アルキルアミン化合物及びビス(置換アリール)置換ジヒドロアゾール化合物に関しては何ら開示されてなく、また、それらの有害生物防除剤としての有用性は全く知られていない。

10

【特許文献1】日本国特許出願公開第2007/091708号明細書

【特許文献2】国際公開第2007/105814号パンフレット

【特許文献3】日本国特許出願公開第2007/016017号明細書

【特許文献4】国際公開第2004/018410号パンフレット

【非特許文献1】ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1987年、52巻、2523頁

【非特許文献2】ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1995年、60巻、5661頁

20

【非特許文献3】ポーリッシュ・ジャーナル・オブ・ケミストリー [Polish J. Chem.] 1985年、59巻、375頁

【非特許文献4】ジャーナル・オブ・ケミカル・リサーチ・シノプシス [J. Chem. Research, Synopses] 1988年、352頁

【非特許文献5】ポーリッシュ・ジャーナル・オブ・ケミストリー [Polish J. Chem.] 1982年、56巻、869頁

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0003】

農園芸病害虫、森林病害虫、或いは衛生病害虫等、各種病害虫の防除を目的とする有害生物防除剤の開発が進み、多種多様な薬剤が今日まで実用に供されてきた。

30

しかしながら、こうした薬剤の長年にわたる使用により、近年、病害虫が薬剤抵抗性を獲得し、従来用いられてきた既存の殺虫剤や殺菌剤による防除が困難となる場面が増えてきている。また、既存の有害生物防除剤の一部のものは毒性が高く、或いはあるものは環境中に長期間残留することにより、生態系を攪乱するという問題も顕在化しつつある。このような状況下、高度な有害生物防除活性を有するのみならず、低毒性且つ低残留性の新規な有害生物防除剤の開発が常に期待されている。

【課題を解決するための手段】

【0004】

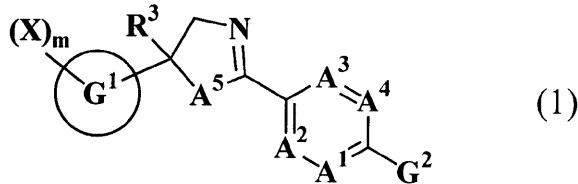
本発明者らは、上記の課題解決を目標に鋭意研究を重ねた結果、本発明に係る下記一般式(1)で表される新規なN - アシル - 1 - (4 - ジヒドロアゾール置換フェニル)アルキルアミン化合物及びビス(置換アリール)置換ジヒドロアゾール化合物が優れた有害生物防除活性、特に殺虫・殺ダニ活性を示し、且つ、ホ乳動物、魚類及び益虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物であることを見出し、本発明を完成した。

40

すなわち、本発明は下記〔1〕～〔10〕に関するものである。

〔1〕一般式(1)：

【化1】



[式中、A¹、A²、A³及びA⁴は、各々独立してC-Y又はNを表し、

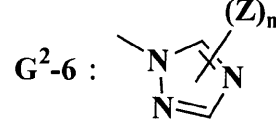
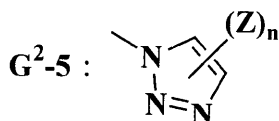
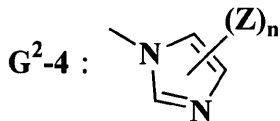
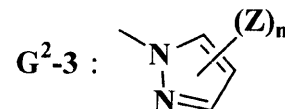
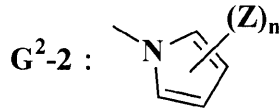
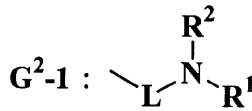
A⁵は、-CH(R^{3a})-、O又はSを表し、

G¹は、ベンゼン環、含窒素6員芳香族複素環、フラン環、チオフェン環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれるヘテロ原子を2個以上含む5員芳香族複素環を表し、

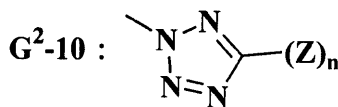
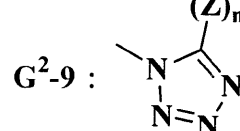
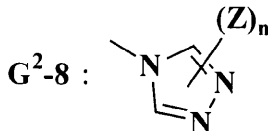
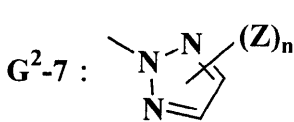
G²は、G²-1~G²-10で表される構造を表し、

10

【化2】



20



30

Lは、-C(R⁴)(R^{4a})-、-C(R⁴)(R^{4a})CH₂-、-CH₂C(R⁴)(R^{4a})-、-N(R^{4b})-、-C(R⁴)(R^{4a})N(R^{4b})-又は単結合を表し、

Xは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-SCN、-SF₅、C₁~C₆アルキル、R⁵によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、R⁵によって任意に置換された(C₃~C₈)シクロアルキル、E1~E19、C₂~C₆アルケニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルケニル、C₅~C₁₀シクロアルケニル、C₅~C₁₀ハロシクロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルキニル、-OH、-OR⁶、-OS(O)₂R⁶、-SH、-S(O)_rR⁶、-N(R⁸)R⁷、-N=C(R^{8a})R^{7a}、-C(O)R⁹、-C(R⁹)=NOH、-C(R⁹)=NOR¹⁰、M3

40

、M13、M30、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)N(R¹²)R¹¹、-C(S)OR¹⁰、-C(S)SR¹⁰、-C(S)N(R¹²)R¹¹、M23~M26、M28、M29、-S(O)₂OR¹⁰、-S(O)₂N(R¹²)R¹¹、-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1~D38を表し、mが2以上の整数を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのXが隣接する場合には、隣接する2つのXは-CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂O-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-、-CH₂SCH₂-、-CH₂CH₂N(R¹⁴)-、-CH₂N(R¹⁴)CH₂-、-CH₂CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂O-、-CH₂CH₂OCH₂-、-CH₂OCH₂O-、-OCH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂S-、-CH₂CH=CH-、-OCH=CH-、-SCH=CH-、-N(R¹⁴)CH=CH-、-OCH=N-、-SCH=N-、-N(R¹⁴)CH=N-、-N(R¹⁴)N=CH-、-CH=CHCH=CH-、-OCH₂CH=CH-、-N=CHCH=CH-、-N=CHCH=N-又は-N=CHN=CH-を形成することにより、それぞれのXが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、

50

このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z^a によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z^a で置換されている場合、各々の Z^a は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、 $-\text{SCN}$ 、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 R^5 によって任意に置換された($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$)アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 R^5 によって任意に置換された($\text{C}_3 \sim \text{C}_8$)シクロアルキル、 $\text{E1} \sim \text{E19}$ 、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、 R^5 によって任意に置換された($\text{C}_2 \sim \text{C}_6$)アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、 R^5 によって任意に置換された($\text{C}_2 \sim \text{C}_6$)アルキニル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^6$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_r\text{R}^6$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)\text{R}^7$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)\text{C}(\text{O})\text{R}^{9a}$ 、 $-\text{N}=\text{C}(\text{R}^{8a})\text{R}^{7a}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{11}$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{11}$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{13a})(\text{R}^{13b})\text{R}^{13}$ 、フェニル、(Z^a) $_{p_1}$ によって置換されたフェニル又はD1～D38を表し、Yが同時に2個以上存在するとき、各々のYは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つのYが隣接する場合には、隣接する2つのYは $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHN}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{NCH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、それぞれのYが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z^a によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z^a で置換されている場合、各々の Z^a は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 R^5 によって任意に置換された($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$)アルキル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}^6$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_2\text{R}^6$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_r\text{R}^6$ 、 $-\text{N}(\text{R}^8)\text{R}^7$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^9$ 、 $-\text{C}(\text{R}^9)=\text{NOH}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^9)=\text{NOR}^{10}$ 、M3、M13、M30、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{SR}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{11a}$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{SR}^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^{12a})\text{R}^{11a}$ 、M23～M26、M28、M29、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^{10}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{11}$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{13a})(\text{R}^{13b})\text{R}^{13}$ 、フェニル又は(Z^a) $_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、nが2以上の整数を表すとき、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ を形成することにより縮合環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルチオ基によって任意に置換されていてもよく、

Z^a は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルコキシ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルチオ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルチオ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルフィニル($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルスルフィニル($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルホニル($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルスルホニル($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ ハロシクロアルキル、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルチオ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルチオ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルスルホニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルスルホニル、 $-\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルアミノ、ジ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)アミノ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシカルボニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルアミノカルボニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルアミノカルボニル、ジ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)アミノカルボニル、 $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルアミノスルホニル、ジ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)アミノスルホニル又はフェニルを表し、p又はp1が2以上の整数を表すとき、各々の Z^a は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの Z^a が隣接する場合には、隣接する2つの Z^a は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 又は $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ を形成することにより、それぞれの Z^a が結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、シアノ基

、ニトロ基、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ基によって任意に置換されていてもよく、

R^1 は、水素原子、 $-C(O)R^{1a}$ 、 $-C(O)OR^{1b}$ 、 $-C(O)SR^{1b}$ 、 $-C(O)N(R^{1d})R^{1c}$ 、 $-C(S)R^{1a}$ 、 $-C(S)OR^{1b}$ 、 $-C(S)SR^{1b}$ 、 $-C(S)N(R^{1d})R^{1c}$ 、 $-S(O)_2R^{1b}$ 又は $-S(O)_2N(R^{1d})R^{1c}$ を表し、

R^{1a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_3 \sim C_{12}$)シクロアルキル、 $E1 \sim E21$ 、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 R^{15} によって任意に置換された($C_2 \sim C_{12}$)アルケニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{12}$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 R^{15} によって任意に置換された($C_2 \sim C_{12}$)アルキニル、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)R^{9a}$ 、 $-C(R^9)=NOH$ 、 $-C(R^9)=NOR^{10}$ 、 $-C(R^9)=NN(R^{17})R^{16}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{11}$ 、 $M4$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル又は $D1 \sim D38$ を表し、

R^{1b} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_3 \sim C_{12}$)シクロアルキル、 $E2 \sim E6$ 、 $E12 \sim E19$ 、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル、 $D1$ 、 $D2$ 、 $D4 \sim D6$ 、 $D8 \sim D10$ 、 $D12 \sim D19$ 、 $D21$ 、 $D23$ 、 $D25$ 、 $D27$ 又は $D30 \sim D38$ を表し、

R^{1c} は、水素原子、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_3 \sim C_{12}$)シクロアルキル、 $E2 \sim E6$ 、 $E12 \sim E19$ 、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)R^{9a}$ 、 $-C(R^9)=NOR^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{11}$ 、 $M7$ 、 $M17$ 、 $-C(S)R^9$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{12})R^{11}$ 、 $M9$ 、 $M19$ 、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})R^{11}$ 、 $-N(R^{17})R^{16}$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル、 $D1 \sim D25$ 又は $D27 \sim D38$ を表し、

R^{1d} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_6$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表すか、或いは、 R^{1d} は R^{1c} と一緒に $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{1c} 及び R^{1d} が結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $-CHO$ 基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルアミノカルボニル基、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル基、オキソ基又はチオキソ基によって任意に置換されていてもよく、

R^2 は、水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{15a} によって任意に置換された($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)R^{9a}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{11}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{12})R^{11}$ 、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルコキシ、 $-SR^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-SN(R^{17a})R^{16a}$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル又は $D32$ を表すか、或いは、 R^2 は R^1 と一緒に $C_4 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する窒素原子と共に $5 \sim 7$ 員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキリデン基、 $-CHO$ 基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルアミノカルボニル基、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル基、フェニル基、 $D32$ 基、 $D34$ 基、オキソ基又はチオキソ基によって任意に置換されていてもよく、

R^3 は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^5 によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^5 によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $E1 \sim E19$ 、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 R^5 によって任意に置換された($C_2 \sim C_6$)アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^5 によって任意に置換された($C_2 \sim C_6$)アルキニル、 $-OR^6$ 、 $-S(O)_rR^6$ 、 $-N(R^1$

10

20

30

40

50

²)R¹¹、-C(O)R⁹、-C(R⁹)=NOH、-C(R⁹)=NOR¹⁰、M3、M13、M30、-C(O)OR¹⁰、-C(O)SR¹⁰、-C(O)N(R¹²)R¹¹、-C(S)OR¹⁰、-C(S)SR¹⁰、-C(S)N(R¹²)R¹¹、-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、-P(O)(OR¹⁸)₂、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1～D38を表し、

R^{3a}は、水素原子、C₁～C₆アルキル又はC₁～C₆ハロアルキルを表し、

R⁴は、水素原子、シアノ、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、-C(O)NH₂、-C(S)NH₂、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル、D1、D2、D9、D10又はD32を表し、

R^{4a}は、水素原子又はC₁～C₆アルキルを表すか、或いは、R^{4a}はR⁴と一緒にC₂～C₅アルキレン鎖を形成することにより、R⁴及びR^{4a}が結合する炭素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つC₁～C₄アルキル基、-CHO基、C₁～C₄アルキルカルボニル基、C₁～C₄アルコキシカルボニル基、C₁～C₄アルキルアミノカルボニル基、C₁～C₄ハロアルキルアミノカルボニル基、ジ(C₁～C₄アルキル)アミノカルボニル基又はフェニル基によって任意に置換されていてもよく、

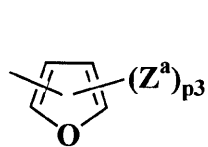
10

R^{4b}は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₃～C₆シクロアルキルカルボニル、C₃～C₆ハロシクロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル又はC₁～C₆ハロアルコキシカルボニルを表し、

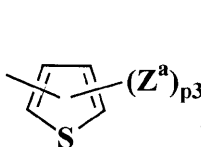
D1～D38は、それぞれ下記の構造式で表される芳香族複素環を表し、

20

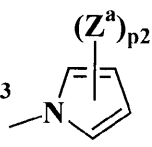
【化3】



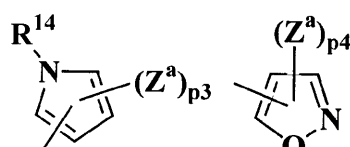
D1



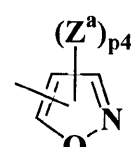
D2



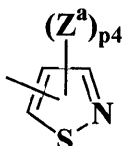
D3



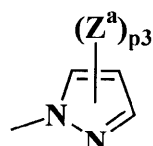
D4



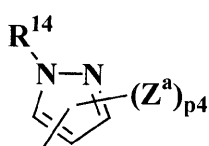
D5



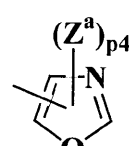
D6



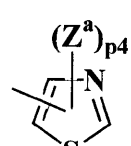
D7



D8

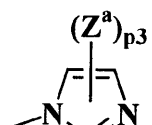


D9

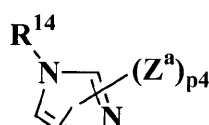


D10

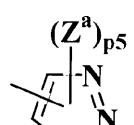
10



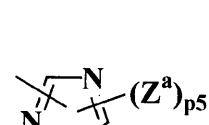
D11



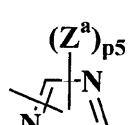
D12



D13

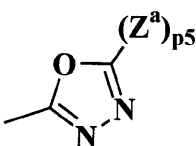


D14

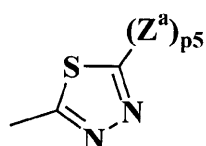


D15

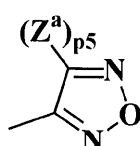
20



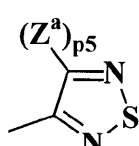
D16



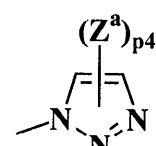
D17



D18

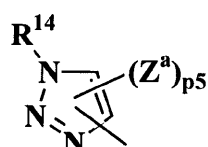


D19

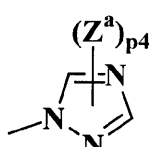


D20

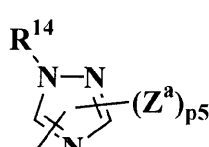
30



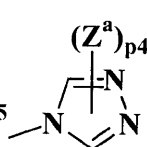
D21



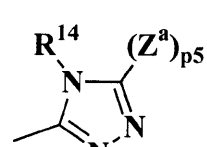
D22



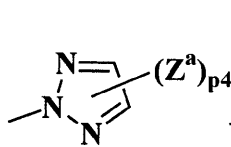
D23



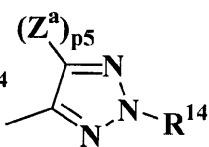
D24



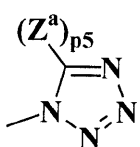
D25



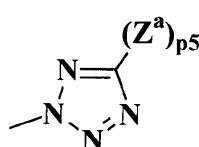
D26



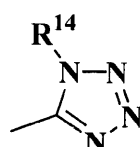
D27



D28



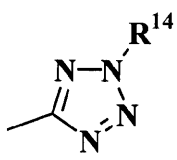
D29



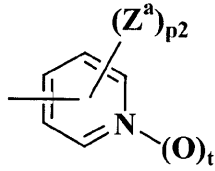
D30

40

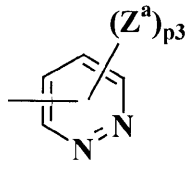
【化4】



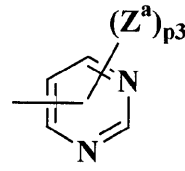
D31



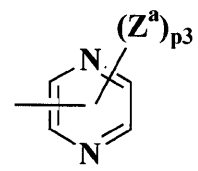
D32



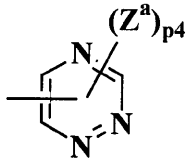
D33



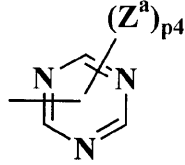
D34



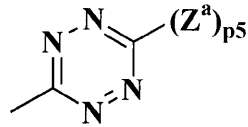
D35



D36



D37

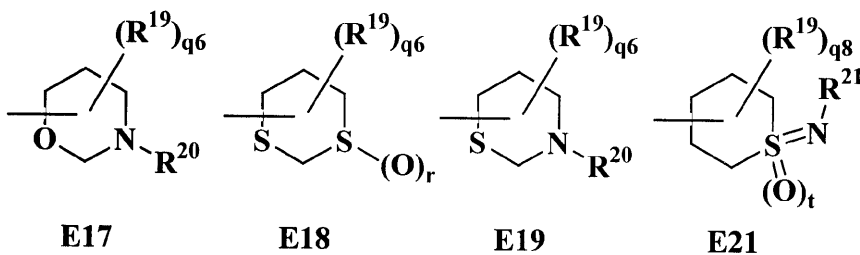
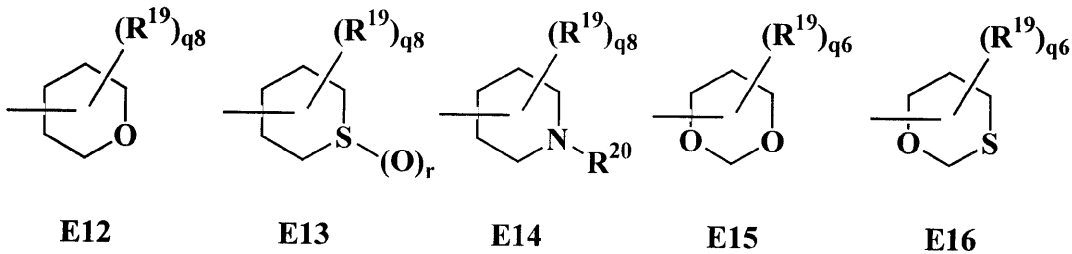
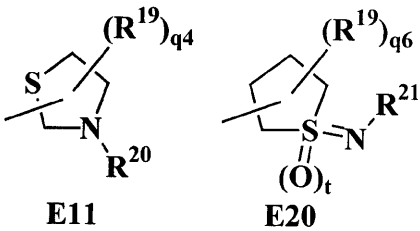
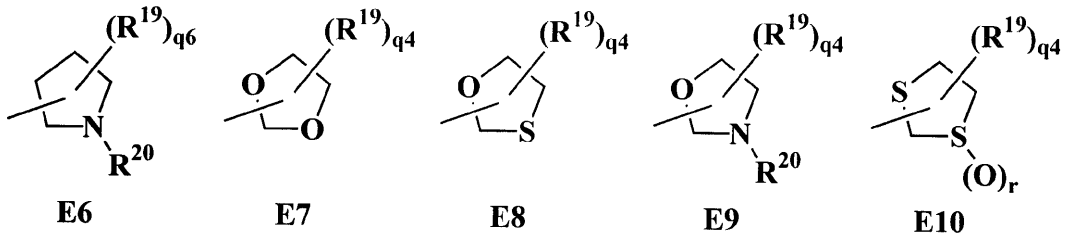
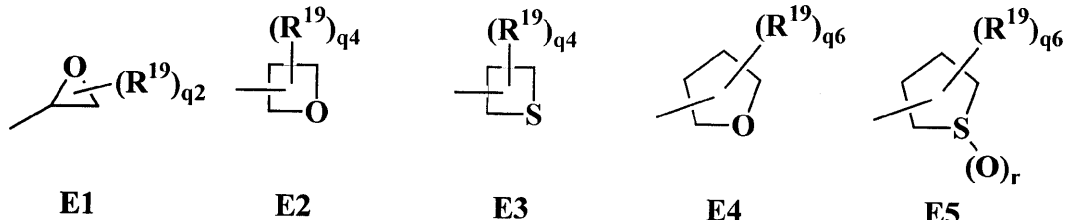


D38

10

E1 ~ E21は、それぞれ下記の構造式で表される飽和複素環を表し、

【化5】



R⁵は、ハロゲン原子、シアノ、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、E1~E19、-OH、-OR⁶、-SH、-S(O)_rR⁶、-N(R⁸)R⁷、-N(R⁸)C(O)R^{9a}、-C(O)OR¹⁰、-C(O)N(R¹²)R¹¹、-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル又はD1~D38を表し、

R⁶は、C₁~C₆アルキル、R²²によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、R²²によって任意に置換された(C₃~C₈)シクロアルキル、E2~E6、E12~E15、E18、C₂~C₆アルケニル、R²²によって任意に置換された(C₂~C₆)アルケニル、C₅~C₁₀シクロアルケニル、C₅~C₁₀ハロシクロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、R²²によって任意に置換された(C₃~C₆)アルキニル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、フェニル、(Z^a)_{p1}によって置換されたフェニル、D1、D2、D4~D6、D8~D10、D12~D19、D21、D23、D25、D27又はD30~D38を表し、

R⁷は、水素原子、C₁~C₆アルキル、R²²によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C

10

20

30

40

50

$C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)SR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{11}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{12})R^{11}$ 、 $-C(O)C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{10}$ 、 $-OH$ 、 $-S(O)_2R^{10}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})R^{11}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 又は $-P(S)(OR^{18})_2$ を表し、

R^8 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表すか、或いは、 R^8 は R^7 と一緒に $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^7 及び R^8 が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、オキソ基又はチオキソ基によって任意に置換されていてもよく、

10

R^{7a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、フェノキシ又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェノキシを表し、

R^{8a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表すか、或いは、 R^{8a} は R^{7a} と一緒に $C_4 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{7a} 及び R^{8a} が結合する炭素原子と共に5～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子1個を含んでいてもよく、

R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E4～E6、E12～E14、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル又は $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルを表し、

20

R^{9a} は、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、ナフチル又はD1～D38を表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E2～E6、E12～E19、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D1、D2、D4～D6、D8～D10、D12～D19、D21、D23、D25、D27又はD30～D38を表し、

R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E2～E6、E12～E19、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D1～D25又はD27～D38を表し、

30

R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表すか、或いは、 R^{12} は R^{11} と一緒に $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{11} 及び R^{12} が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-CHO$ 基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基によって任意に置換されていてもよく、

40

R^{11a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 R^{22} によって置換されたシクロプロピル、E4、E5、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $-CH=NOR^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{11}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-N(R^{12b})R^{11b}$ 、D34又はD35を表し、

R^{12a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{22a} によって置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオを表すか、或いは、 R^{12a} は R^{11a} と一緒に $=C(R^{12c})R^{11c}$ を形成してもよく、

R^{11b} は、フェニル、D32又はD34を表し、

R^{12b} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル又は $C_3 \sim C_4$ アルキニルを表し、

50

R^{1c} は、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し、

R^{2c} は、 $-NH_2$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノを表し、

R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{13a} 及び R^{13b} は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^{14} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、

さらに、 R^{14} の隣接位に Z^a が存在する場合には、隣接する R^{14} と Z^a とは $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-CH=CH-$ 、 $-N=CH-CH=CH-$ 、 $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ 又は $-CH=CH-CH=N-$ を形成することにより、 R^{14} 及び Z^a のそれぞれが結合する原子と共に6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基によって任意に置換されていてもよく、

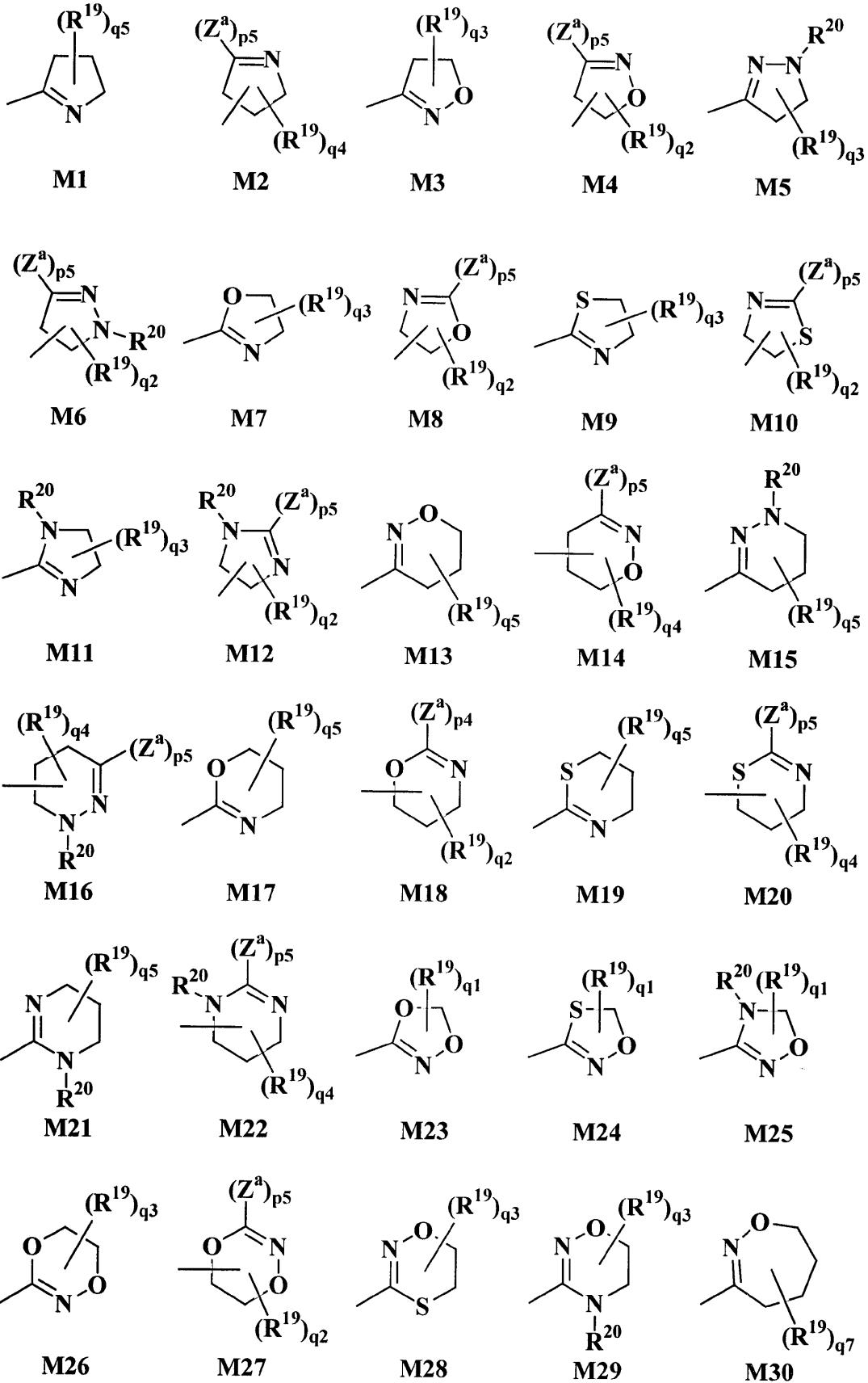
R^{15} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、ヒドロキシ($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、E1~E21、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、 $-OR^{23}$ 、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-SH$ 、 $-S(O)_rR^{25}$ 、 $-S(O)_t(R^{25})=NR^{21}$ 、 $-C(O)R^{26}$ 、 $-C(R^{26})=NOH$ 、 $-C(R^{26})=NOR^{27}$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OR^{27}$ 、 $-C(O)SR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 、 $-C(O)N(R^{29})OR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})N(R^{28a})R^{28}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{27}$ 、 $-C(S)OR^{27}$ 、 $-C(S)SR^{27}$ 、 $-C(S)N(R^{29})R^{28}$ 、 $-C(=NR^{28})OR^{27}$ 、 $-C(=NR^{28})SR^{27}$ 、 $-C(=NR^{29})N(R^{28a})R^{28}$ 、 $-C(=NOR^{27})N(R^{29})R^{28}$ 、 $-S(O)_2OH$ 、 $-S(O)_2OR^{27}$ 、 $-S(O)_2N(R^{29})R^{28}$ 、 $-Si(R^{13a})(R^{13b})R^{13}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、 $-P(\text{フェニル})_2$ 、 $-P(O)(\text{フェニル})_2$ 、M1~M30、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、ナフチル又はD1~D38を表し、

M1~M30は、それぞれ下記の構造式で表される部分飽和複素環を表し、

10

20

【化6】



10

20

30

40

R^{15a} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、E4、E5、E12、E13、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $-OR^{23}$ 、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-S(O)_rR^{25}$ 、 $-C(O)R^{26}$ 、 $-C(R^{26})=NOH$ 、 $-C(R^{26})=NOR^{27}$ 、M3、 $-C(O)OR^{27}$ 、 $-C(O)SR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 、M7、M17、 $-C(S)OR^{27}$ 、 $-C(S)SR^{27}$ 、 $-C(S)N(R^{29})R^{28}$ 、M9、M19、 $-C(O)C(O)OR^{27}$ 、 $-S(O)_2N(R^{29})R^{28}$ 、 $-Si(R^{13a})(R^{13b})R^1$

50

³、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D1~D3、D7、D10、D11、D22又はD32~D35を表し、

R^{16} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E2~E6、E12~E19、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $-C(O)R^{26}$ 、 $-C(O)OR^{27}$ 、 $-C(O)SR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 、 $-C(S)R^{26}$ 、 $-C(S)OR^{27}$ 、 $-C(S)SR^{27}$ 、 $-C(S)N(R^{29})R^{28}$ 、 $-S(O)_2R^{27}$ 、 $-S(O)_2N(R^{29})R^{28}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D1~D25又はD27~D38を表し、

R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルを表すか、或いは、 R^{17} は R^{16} と一緒に $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{16} 及び R^{17} が結合する窒素原子と共に3~7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ($C_1 \sim C_2$)アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-CHO$ 基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基によって任意に置換されていてもよく、

R^{16a} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)ON=C(CH_3)SCH_3$ 、 $-C(O)ON=C(SCH_3)C(O)N(CH_3)_2$ 、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{17a} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_{12}$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表すか、或いは、 R^{17a} は R^{16a} と一緒に $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{16a} 及び R^{17a} が結合する窒素原子と共に5~8員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を1個含んでいてもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

R^{18} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^{19} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表し、 $q1 \sim q8$ が2以上の整数を表すとき、各々の R^{19} は互いに同一であっても、または互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{19} が同一の炭素原子上に置換している場合、2つの R^{19} は一緒になってオキソ、チオキソ、イミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルイミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシイミノ又は $C_1 \sim C_4$ アルキリデンを形成してもよく、

R^{20} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $-OH$ 、ベンジルオキシ、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 、 $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-C(S)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-S(O)_2R^{32}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル又はD3を表し、

10

20

30

40

50

R^{21} は、水素原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、

R^{22} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E1~E19、 $-OR^{23}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-C(O)R^{26}$ 、 $-C(R^{26})=NOR^{27}$ 、 $-C(O)OR^{27}$ 、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル又はD1~D38を表し、

R^{22a} は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-OR^{23}$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルチオを表し、

R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_8$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、E2~E6、E12~E19、 $C_3 \sim C_8$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)アルキニル、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 、 $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-C(O)C(O)R^{32}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{32}$ 、 $-C(S)R^{31}$ 、 $-C(S)OR^{32}$ 、 $-C(S)SR^{32}$ 、 $-C(S)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-S(O)_2R^{32}$ 、 $-S(O)_2N(R^{34})R^{33}$ 、 $-Si(R^{13a})(R^{13b})R^{13}$ 、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル、D1、D2、D4~D6、D8~D10、D12~D19、D21、D23、D25、D27又はD30~D38を表し、

R^{24} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、シアノ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、フェニル又は $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニルを表すか、或いは、 R^{24} は R^{23} と一緒に $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{23} 及び R^{24} が結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-CHO$ 基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル基、オキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{25} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_8$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、E2~E6、E12~E19、 $C_3 \sim C_8$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)アルキニル、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 、 $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-C(O)C(O)R^{32}$ 、 $-C(O)C(O)OR^{32}$ 、 $-C(S)R^{31}$ 、 $-C(S)OR^{32}$ 、 $-C(S)SR^{32}$ 、 $-C(S)N(R^{34})R^{33}$ 、 $-SH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、フェニルチオ、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニルチオ、 $-P(O)(OR^{18})_2$ 、 $-P(S)(OR^{18})_2$ 、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル、D9、D10、D12、D14~D17、D30又はD32~D35を表し、

R^{26} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、フェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又は $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニルを表し、

R^{27} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、E2~E6、E12~E19、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_2 \sim C_6$)アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)アルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p1}$ によって置換されたフェニル、D1、D2、D4~D6、D8~D10、D12~D19、D21、D23、D25、D27又はD30~D38を表し、

R^{28} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、

10

20

30

40

50

$C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、E1～E6、E12～E19、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_2 \sim C_6$)アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された($C_3 \sim C_6$)アルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D1～D25又はD27～D38を表し、

R^{28a} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{29} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、フェニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルを表すか、或いは、 R^{29} は R^{28} と一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{28} 及び R^{29} が結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、-CHO基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル基又はオキソ基によって任意に置換されていてもよく、

10

R^{30} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、E4、E5、E7、E8、E10、E12、E13、E15、E16、E18、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、-OH、-OR³²、-OC(O)R³¹、-OC(O)OR³²、-OC(O)N(R³⁴)R³³、-OC(S)N(R³⁴)R³³、-SH、-S(O)_rR³²、-SC(O)R³¹、-SC(O)OR³²、-SC(O)N(R³⁴)R³³、-SC(S)N(R³⁴)R³³、-N(R³⁴)R³³、-N(R³⁴)CHO、-N(R³⁴)C(O)R³¹、-N(R³⁴)C(O)OR³²、-N(R³⁴)C(O)N(R³⁴)R³³、-N(R³⁴)C(S)N(R³⁴)R³³、-N(R³⁴)S(O)₂R³²、-C(O)R³¹、-C(O)OH、-C(O)OR³²、-C(O)SR³²、-C(O)N(R³⁴)R³³、-C(O)C(O)OR³²、-Si(R^{13a})(R^{13b})R¹³、-P(O)(OR¹⁸)₂、-P(S)(OR¹⁸)₂、-P(フェニル)₂、-P(O)(フェニル)₂、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル又はD1～D38を表し、

20

R^{31} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 R^{35} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、E4、E5、E12、E13、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_5 \sim C_{10}$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル又はD1～D38を表し、

R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 R^{35} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、E4、E5、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル又はフェニルを表し、

30

R^{33} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 R^{35} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、E4、E5、E12、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D1～D25又はD27～D38を表し、

R^{34} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表すか、或いは、 R^{34} は R^{33} と一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{33} 及び R^{34} が結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、-CHO基、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル基、フェニル基又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル基によって任意に置換されていてもよく、

40

R^{35} は、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、E4、E5、E12、E13、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、フェノキシ、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェノキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、フェニルチオ、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルスルホニル、-N(R³⁷)R³⁶、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル、トリ($C_1 \sim C_4$ アルキル)シリル、フェニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、ナフチル又はD1～D38を表し、

50

R^{36} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、フェニルカルボニル又は $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニルカルボニルを表し、

R^{37} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

mは、0～5の整数を表し、

nは、0～4の整数を表し、

p1は、1～5の整数を表し、

p2は、0～4の整数を表し、

p3は、0～3の整数を表し、

p4は、0～2の整数を表し、

p5は、0又は1の整数を表し、

q1は、0～2の整数を表し、

q2は、0～3の整数を表し、

q3は、0～4の整数を表し、

q4は、0～5の整数を表し、

q5は、0～6の整数を表し、

q6は、0～7の整数を表し、

q7は、0～8の整数を表し、

q8は、0～9の整数を表し、

rは、0～2の整数を表し、

tは、0又は1の整数を表す。]

で表される置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

【0005】

[2] A^1 、 A^2 及び A^4 は、各々独立してC-Y又はNを表し、

A^3 は、C-H又はNを表し、

G^1 は、ベンゼン環を表し、

G^2 は、 G^2-1 、 G^2-3 、 G^2-5 、 G^2-6 、 G^2-8 又は G^2-9 で表される構造を表し、

Lは、 $-C(R^4)(R^{4a})-$ 、 $-C(R^4)(R^{4a})CH_2-$ 、 $-N(R^{4b})-$ 又は $-C(R^4)(R^{4a})N(R^{4b})-$ を表し、

Xは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_4$)ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)ハロアルキル、 $-OR^6$ 、 $-S(O)_rR^6$ 又は $-NH_2$ を表し、mが2以上の整数を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つのXが隣接する場合には、隣接する2つのXは $-CF_2OCF_2-$ 、 $-OCF_2O-$ 、 $-CF_2OCF_2O-$ 又は $-OCF_2CF_2O-$ を形成することにより、それぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 R^5 によって置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-OR^6$ 、 $-S(O)_rR^6$ 、 $-N(R^8)R^7$ 、 $-C(S)NH_2$ 、D1～D3、D7、D11又はD22を表し、Yが2個以上存在するとき、各々のYは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つのYが隣接する場合には、隣接する2つのYは $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、それぞれのYが結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR^6$ 、 $-S(O)_rR^6$ 、 $-NH_2$ 、 $-C(O)N(R^{12a})R^{11a}$ 又は $-C(S)N(R^{12a})R^{11a}$ を表し、

R^1 は、水素原子、 $-C(O)R^{1a}$ 、 $-C(O)OR^{1b}$ 、 $-C(O)SR^{1b}$ 、 $-C(O)N(R^{1d})R^{1c}$ 、 $-C(S)R^{1a}$ 又は $-C(S)N(R^{1d})R^{1c}$ を表し、

R^{1a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、E4、E5、E10、E13、E20、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-CH=NOR^{10}$ 、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D2、D8又はD32を表し、

Z^a は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し

、 p_1 及び p_2 が2以上の整数を表すとき、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{1b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し、

R^{1c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $-N(R^{17})R^{16}$ を表し、

R^{1d} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{1d} は R^{1c} と一緒に $C_4 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{1c} 及び R^{1d} が結合する窒素原子と共に5～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を1個含んでいてもよく、且つメチル基又はオキソ基によって任意に置換されていてもよく、

R^2 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{15a} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、

R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキルを表し、

R^{3a} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^4 は、水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(S)NH_2$ 、フェニル、D9又はD10を表し、

R^{4a} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表すか、或いは、 R^{4a} は R^4 と一緒にエチレン鎖を形成することにより、 R^4 及び R^{4a} が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成してもよく、

R^{4b} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^5 は、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルを表し、

R^6 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ($C_1 \sim C_4$)ハロアルキルを表し、

R^7 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

R^8 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{11a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 R^{22} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、E4、 $-CH=NOR^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-N(R^{12b})R^{11b}$ 、D34又はD35を表し、

R^{12a} は、水素原子、 R^{22a} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、シクロプロピルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{11b} は、フェニル又はD34を表し、

R^{12b} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{14} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{15} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-S(O)_rR^{25}$ 、 $-S(O)_t(R^{25})=NR^{21}$ 又は $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ を表し、

R^{15a} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、

R^{16} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{17} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{21} は、水素原子、シアノ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニルを表し、

R^{22} は、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルアミノカルボニル、D10又はD32を表し、

R^{22a} は、シアノ又は $-OR^{23}$ を表し、

R^{23} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、シアノ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$

10

20

30

40

50

又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルを表し、

R^{24} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルを表し、

R^{25} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 又は $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ を表し、

R^{28} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル又はシクロプロピルメチルを表し、

R^{29} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{30} は、ハロゲン原子、シアノ又は $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ を表し、

R^{31} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、D7、D11又はD22を表し、

R^{32} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{33} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、

R^{34} は、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

mは、1～3の整数を表し、

nは、0又は1の整数を表し、

p1は、1～3の整数を表し、

p2は、0～2の整数を表し、

p3及びp4は、0又は1の整数を表し、

q4、q6及びq8は、0を表す上記〔1〕に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩

【0006】

〔3〕 A^1 は、C-Y又はNを表し、

A^2 及び A^3 は、C-Hを表し、

A^4 は、C-H又はNを表し、

A^5 は、 $-CH_2-$ 又はSを表し、

Lは、 $-C(R^4)(R^{4a})-$ を表し、

Xは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオを表し、mが2又は3を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ又は $-C(S)NH_2$ を表し、

Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-C(O)NHR^{11a}$ 又は $-C(S)NHR^{11a}$ を表し、

R^3 は、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、

R^4 は、水素原子、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、エチニル、 $-C(S)NH_2$ 又はD10を表し、

R^{4a} は、水素原子を表すか、或いは、 R^{4a} は R^4 と一緒にエチレン鎖を形成することにより、 R^4 及び R^{4a} が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成してもよく、

R^{11a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 R^{22} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、シクロプロピル、E4又は $-CH=NOR^{10}$ を表し、

R^{10} は、 $C_1 \sim C_2$ アルキルを表し、

R^{22} は、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルアミノカルボニル、D10又はD32を表す上記〔2〕に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

【0007】

〔4〕 A^5 は、 $-CH_2-$ を表し、

G^2 は、 G^2-1 、 G^2-6 又は G^2-9 で表される構造を表し、

10

20

30

40

50

Lは、 $-\text{CH}(\text{R}^4)-$ を表し、

Xは、ハロゲン原子、シアノ、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルコキシ又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルチオを表し、mが2又は3を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_3$ アルキニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルチオ又は $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ を表し、

Zは、ハロゲン原子、ニトロ、メチル又は $-\text{NH}_2$ を表し、

R^1 は、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{1\text{a}}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{SR}^{1\text{b}}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{1\text{d}})\text{R}^{1\text{c}}$ 又は $-\text{C}(\text{S})\text{R}^{1\text{a}}$ を表し、

$\text{R}^{1\text{a}}$ は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ シクロアルキル、E4、E5、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_4$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_4$ ハロアルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_4$ アルキニル、(Z^{a}) $_{\text{p}1}$ によって置換されたフェニル又はD32を表し、

Z^{a} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルチオを表し、 $\text{p}1$ 及び $\text{p}2$ が2以上の整数を表すとき、各々の Z^{a} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

$\text{R}^{1\text{b}}$ は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルを表し、

$\text{R}^{1\text{c}}$ は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ シクロアルキル又は $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ アルキニルを表し、

$\text{R}^{1\text{d}}$ は、水素原子又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルを表し、

R^2 は、水素原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{R}^{15\text{a}}$ によって置換された($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$)アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ アルケニル又は $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ アルキニルを表し、

R^3 は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルを表し、

R^4 は、水素原子、シアノ、メチル、エチニル又は $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ を表し、

R^{15} は、ハロゲン原子、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルコキシ、 $-\text{N}(\text{R}^{24})\text{R}^{23}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_r\text{R}^{25}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_t(\text{R}^{25})=\text{NR}^{21}$ 又は $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{29})\text{R}^{28}$ を表し、

$\text{R}^{15\text{a}}$ は、シアノ、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルコキシ、 $-\text{N}(\text{R}^{24})\text{R}^{23}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルコキシカルボニル、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{29})\text{R}^{28}$ 又は $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ を表し、

R^{21} は、水素原子又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルカルボニルを表し、

R^{23} は、シアノ($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$)アルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{31}$ 又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{24} は、水素原子又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルコキシカルボニルを表し、

R^{25} は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキル又はシアノメチルを表し、

R^{28} は、水素原子又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルを表し、

R^{29} は、水素原子又はメチルを表し、

R^{31} は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキル又はシクロプロピルを表す上記〔3〕に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

【0008】

〔5〕 A^1 は、 $\text{C}-\text{Y}$ を表し、

A^4 は、 $\text{C}-\text{H}$ を表し、

G^2 は、 G^2-1 で表される構造を表し、

Xは、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、mが2又は3を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Yは、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ又はメチルを表し、

R^1 は、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{1\text{a}}$ 又は $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{1\text{c}}$ を表し、

$\text{R}^{1\text{a}}$ は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル、 R^{15} によって任意に置換された($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$)アルキル、シクロプロピル、E4又はE5を表し、

$\text{R}^{1\text{c}}$ は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ ハロアルキル、シクロプロピル又はプロパルギルを表し、

R^2 は、水素原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキル、シクロプロピルメチル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルコキシメチル、シアノメチル、アリル又はプロパルギルを表し、

R^3 は、トリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルを表し、

10

20

30

40

50

R⁴は、水素原子、シアノ又はメチルを表し、
 R¹⁵は、シクロプロピル又は-S(O)_rR²⁵を表し、
 R²⁵は、C₁~C₂アルキル又はC₁~C₂ハロアルキルを表す上記〔4〕に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

【0009】

〔6〕A¹は、C-Yを表し、
 A⁴は、C-Hを表し、
 G²は、G²-6又はG²-9で表される構造を表し、
 Xは、ハロゲン原子又はトリフルオロメチルを表し、mが2又は3を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、
 Yは、水素原子、シアノ又はニトロを表し、
 R³は、トリフルオロメチル又はクロロジフルオロメチルを表し、
 nは、0を表す上記〔4〕に記載の置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩。

10

〔7〕上記〔1〕ないし〔6〕のいずれか1つに記載の置換ジヒドロアゾール化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する有害生物防除剤。

〔8〕上記〔1〕ないし〔6〕のいずれか1つに記載の置換ジヒドロアゾール化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する農薬。

〔9〕上記〔1〕ないし〔6〕のいずれか1つに記載の置換ジヒドロアゾール化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する哺乳動物または鳥類の内部もしくは外部寄生虫防除剤。

20

〔10〕上記〔1〕ないし〔6〕のいずれか1つに記載の置換ジヒドロアゾール化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有する殺虫剤又は殺ダニ剤。

【発明の効果】

【0010】

本発明の化合物は多くの農業害虫、ハダニ類、哺乳動物または鳥類の内部もしくは外部寄生虫に対して優れた殺虫・殺ダニ活性を有し、既存の殺虫剤に対して抵抗性を獲得した害虫に対しても十分な防除効果を発揮する。さらに、ホ乳類、魚類及び益虫に対してほとんど悪影響を及ぼさず、低残留性で環境に対する負荷も軽い。

従って、本発明は有用な新規有害生物防除剤を提供することができる。

30

【発明を実施するための最良の形態】

【0011】

本発明に包含される化合物には、置換基の種類によってはE-体及びZ-体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明はこれらE-体、Z-体又はE-体及びZ-体を任意の割合で含む混合物を包含するものである。また、本発明に包含される化合物は、1個又は2個以上の不斉炭素原子の存在に起因する光学活性体が存在するが、本発明は全ての光学活性体又はラセミ体を包含する。

【0012】

本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って酸付加塩にすることができるものは、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸等のハロゲン化水素酸の塩、硝酸、硫酸、燐酸、塩素酸、過塩素酸等の無機酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸の塩、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、酒石酸、蔞酸、マレイン酸、リンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸等のカルボン酸の塩又はグルタミン酸、アスパラギン酸等のアミノ酸の塩とすることができる。

40

或いは、本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って金属塩にすることができるものは、例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムといったアルカリ金属の塩、カルシウム、バリウム、マグネシウムといったアルカリ土類金属の塩又はアルミニウムの塩とすることができる。

50

【 0 0 1 3 】

次に、本明細書において示した各置換基の具体例を以下に示す。ここで、n-はノルマルを、i-はイソを、s-はセカンダリーを、tert-はターシャリーを各々意味し、Phはフェニルを意味する。

【 0 0 1 4 】

本発明の化合物におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。

【 0 0 1 5 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状の又は枝分かれした炭化水素基を表し、例えばメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、s-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、2,2-ジメチルプロピル基、n-ヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

【 0 0 1 6 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状の又は枝分かれした炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、ブromोजフルオロメチル基、2-フルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブromoエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリクロロエチル基、2-ブromo-2,2-ジフルオロエチル基、1,1,2,2-テトラフルオロエチル基、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、3,3,3-トリフルオロプロピル基、3-ブromo-3,3-ジフルオロプロピル基、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル基、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2,2,3,3,4,4-ヘプタフルオロブチル基、ノナフルオロブチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20

30

【 0 0 1 7 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルキルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよい。例えばシクロプロピル基、1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、2,2-ジメチルシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【 0 0 1 8 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、さらに、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。例えば2,2-ジフルオロシクロプロピル基、2,2-ジクロロシクロプロピル基、2,2-ジブromoシクロプロピル基、2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル基、2,2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル基、2,2-ジブromo-1-メチルシクロプロピル基、2,2,3,3-テトラフルオロシクロブチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

40

【 0 0 1 9 】

50

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状で又は枝分かれして、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルエテニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、1-メチル-1-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、3-メチル-2-ブテニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0020】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状で又は枝分かれして、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。例えば2-フルオロビニル基、2-クロロビニル基、1,2-ジクロロビニル基、2,2-ジクロロビニル基、2-フルオロ-2-プロペニル基、2-クロロ-2-プロペニル基、3-クロロ-2-プロペニル基、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル基、2,3-ジクロロ-2-プロペニル基、3,3-ジクロロ-2-プロペニル基、2,3,3-トリフルオロ-2-プロペニル基、2,3,3-トリクロロ-2-プロペニル基、1-(トリフルオロメチル)エテニル基、4,4-ジフルオロ-3-ブテニル基、3,4,4-トリフルオロ-3-ブテニル基、3-クロロ-4,4,4-トリフルオロ-2-ブテニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

【0021】

本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルケニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の、且つ1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていることもよく、さらに、二重結合はendo-又はexo-のどちらの形式であってもよい。例えば1-シクロペンテニル基、2-シクロペンテニル基、1-シクロヘキセニル基、2-シクロヘキセニル基、ビシクロ[2.2.1]-5-ヘプテン-2-イル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20

【0022】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の、且つ1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていることもよく、さらに、二重結合はendo-又はexo-のどちらの形式であってもよい。また、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。例えば2-フルオロ-1-シクロペンテニル基、2-クロロ-1-シクロペンテニル基、3-クロロ-2-シクロペンテニル基、2-フルオロ-1-シクロヘキセニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

30

【0023】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキリデンの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状で又は枝分かれして、二重結合によって結合した炭化水素基を表し、例えばメチリデン基、エチリデン基、プロピリデン基、1-メチルエチリデン基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

40

【0024】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状で又は枝分かれして、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ペンチニル基、3-ヘキシニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

50

【 0 0 2 5 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状で又は枝分かれして、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なっても良い。例えば2-クロロエチニル基、2-ブロモエチニル基、2-ヨードエチニル基、3-クロロ-2-プロピニル基、3-ブロモ-2-プロピニル基、3-ヨード-2-プロピニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【 0 0 2 6 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-O-基を表し、例えばメトキシ基、エトキシ基、*n*-プロピルオキシ基、*i*-プロピルオキシ基、*n*-ブチルオキシ基、*i*-ブチルオキシ基、*s*-ブチルオキシ基、*tert*-ブチルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

【 0 0 2 7 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-O-基を表し、例えばジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、プロモジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、1,1,2,2,-テトラフルオロエトキシ基、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエトキシ基、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20

【 0 0 2 8 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル-O-基を表し、例えば2-プロペニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、2-メチル-2-プロペニルオキシ基、3-メチル-2-ブテニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【 0 0 2 9 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S-基を表し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、*n*-プロピルチオ基、*i*-プロピルチオ基、*n*-ブチルチオ基、*i*-ブチルチオ基、*s*-ブチルチオ基、*tert*-ブチルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

30

【 0 0 3 0 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S-基を表し、例えばジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、プロモジフルオロメチルチオ基、2,2,2-トリフルオロエチルチオ基、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ基、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエチルチオ基、ペンタフルオロエチルチオ基、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピルチオ基、ヘプタフルオロプロピルチオ基、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチルチオ基、ノナフルオロブチルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

40

【 0 0 3 1 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S(O)-基を表し、例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、*n*-プロピルスルフィニル基、*i*-プロピルスルフィニル基、*n*-ブチルスルフィニル基、*i*-ブチルスルフィニル基、*s*-ブチルスルフィニル基、*tert*-ブチルスルフィニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【 0 0 3 2 】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S(O)-基を表し、例えばジフルオロメチルスルフィニ

50

ル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、クロロジフルオロメチルスルフィニル基、プロモジフルオロメチルスルフィニル基、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル基、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチルスルフィニル基、ノナフルオロブチルスルフィニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0033】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S(O)₂-基を表し、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、*n*-プロピルスルホニル基、*i*-プロピルスルホニル基、*n*-ブチルスルホニル基、*i*-ブチルスルホニル基、*s*-ブチルスルホニル基、*tert*-ブチルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

【0034】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S(O)₂-基を表し、例えばジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、クロロジフルオロメチルスルホニル基、プロモジフルオロメチルスルホニル基、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル基、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルホニル基、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエチルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0035】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、*n*-プロピルアミノ基、*i*-プロピルアミノ基、*n*-ブチルアミノ基、*i*-ブチルアミノ基、*tert*-ブチルアミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20

【0036】

本明細書におけるジ($C_a \sim C_b$ アルキル)アミノの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばジメチルアミノ基、エチル(メチル)アミノ基、ジエチルアミノ基、ジ(*n*-プロピル)アミノ基、ジ(*n*-ブチル)アミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

30

【0037】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルイミノの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-N=基を表し、例えばメチルイミノ基、エチルイミノ基、*n*-プロピルイミノ基、*i*-プロピルイミノ基、*n*-ブチルイミノ基、*i*-ブチルイミノ基、*s*-ブチルイミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0038】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシイミノの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルコキシ-N=基を表し、例えばメトキシイミノ基、エトキシイミノ基、*n*-プロピルオキシイミノ基、*i*-プロピルオキシイミノ基、*n*-ブチルオキシイミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

40

【0039】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-C(O)-基を表し、例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、パレリル基、イソパレリル基、2-メチルブタノイル基、ピバロイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0040】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-C(O)-基を表し、例えばフルオロアセチル基、クロロアセチル基、ジフルオロアセチル基、ジクロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、クロロジフルオロアセチル基、プロモジフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、ペンタ

50

フルオロプロピオニル基、ヘプタフルオロブタノイル基、3-クロロ-2,2-ジメチルプロパノイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0041】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-O-C(O)-基を表し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、*n*-プロピルオキシカルボニル基、*i*-プロピルオキシカルボニル基、*n*-ブトキシカルボニル基、*i*-ブトキシカルボニル基、*tert*-ブトキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0042】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-O-C(O)-基を表し、例えばクロロメトキシカルボニル基、2-クロロエトキシカルボニル基、2,2-ジフルオロエトキシカルボニル基、2,2,2-トリフルオロエトキシカルボニル基、2,2,2-トリクロロエトキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

【0043】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えばメチルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、*n*-プロピルカルバモイル基、*i*-プロピルカルバモイル基、*n*-ブチルカルバモイル基、*i*-ブチルカルバモイル基、*s*-ブチルカルバモイル基、*tert*-ブチルカルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20

【0044】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数 $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えば2-フルオロエチルカルバモイル基、2-クロロエチルカルバモイル基、2,2-ジフルオロエチルカルバモイル基、2,2,2-トリフルオロエチルカルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0045】

本明細書におけるジ($C_a \sim C_b$ アルキル)アミノカルボニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えば*N,N*-ジメチルカルバモイル基、*N*-エチル-*N*-メチルカルバモイル基、*N,N*-ジエチルカルバモイル基、*N,N*-ジ(*n*-プロピル)カルバモイル基、*N,N*-ジ(*n*-ブチル)カルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

30

【0046】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノスルホニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたスルファモイル基を表し、例えばメチルスルファモイル基、エチルスルファモイル基、*n*-プロピルスルファモイル基、*i*-プロピルスルファモイル基、*n*-ブチルスルファモイル基、*i*-ブチルスルファモイル基、*s*-ブチルスルファモイル基、*tert*-ブチルスルファモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

40

【0047】

本明細書におけるジ($C_a \sim C_b$ アルキル)アミノスルホニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたスルファモイル基を表し、例えば*N,N*-ジメチルスルファモイル基、*N*-エチル-*N*-メチルスルファモイル基、*N,N*-ジエチルスルファモイル基、*N,N*-ジ(*n*-プロピル)スルファモイル基、*N,N*-ジ(*n*-ブチル)スルファモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0048】

本明細書におけるトリ($C_a \sim C_b$ アルキル)シリルの表記は、それぞれ同一でも又は互いに

50

相異なっているけれどもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたシリル基を表し、例えばトリメチルシリル基、トリエチルシリル基、トリ(n -プロピル)シリル基、エチルジメチルシリル基、 n -プロピルジメチルシリル基、 n -ブチルジメチルシリル基、 i -ブチルジメチルシリル基、 $tert$ -ブチルジメチルシリル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0049】

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキルスルホニル-O-基を表し、例えばメチルスルホニルオキシ基、エチルスルホニルオキシ基、 n -プロピルスルホニルオキシ基、 i -プロピルスルホニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

【0050】

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキルスルホニル-O-基を表し、例えばジフルオロメチルスルホニルオキシ基、トリフルオロメチルスルホニルオキシ基、クロロジフルオロメチルスルホニルオキシ基、プロモジフルオロメチルスルホニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0051】

本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルキル($C_d \sim C_e$)アルキル、ヒドロキシ($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオ($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニル($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル($C_d \sim C_e$)アルキル、シアノ($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル($C_d \sim C_e$)アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニル($C_d \sim C_e$)アルキル、フェニル($C_d \sim C_e$)アルキル又は(Z^a) $_{p_1}$ によって置換されたフェニル($C_d \sim C_e$)アルキル等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ シクロアルキル基、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ基、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオ基、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニル基、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル基、 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニル基、水酸基、シアノ基、フェニル基又は(Z^a) $_{p_1}$ によって置換されたフェニル基によって、炭素原子に結合した水素原子が置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20

30

【0052】

本明細書における R^5 によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキル、 R^{15a} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキル又は R^{35} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキル等の表記は、任意の R^5 、 R^{15} 、 R^{15a} 、 R^{22} 、 R^{30} 又は R^{35} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの($C_a \sim C_b$)アルキル基上の置換基 R^5 、 R^{15} 、 R^{15a} 、 R^{22} 、 R^{30} 又は R^{35} が2個以上存在するとき、それぞれの R^5 、 R^{15} 、 R^{15a} 、 R^{22} 、 R^{30} 又は R^{35} は互いに同一でも、または互いに相異なっているけれどもよい。

40

【0053】

本明細書におけるヒドロキシ($C_d \sim C_e$)ハロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ($C_d \sim C_e$)ハロアルキル又は $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ($C_d \sim C_e$)ハロアルキルの表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルコキシ基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ基又は水酸基によって炭素原子に結合した水素原子又はハロゲン原子が置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0054】

本明細書におけるヒドロキシ($C_d \sim C_e$)シクロアルキル又は $C_a \sim C_b$ アルコキシ($C_d \sim C_e$)シ

50

クロアルキル等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルコキシ基又は水酸基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるシクロアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0055】

本明細書における R^5 によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)シクロアルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)シクロアルキル、 R^{22} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)シクロアルキル又は R^{30} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)シクロアルキル等の表記は、任意の R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるシクロアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、 R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} による置換は、環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、さらに、それぞれの($C_a \sim C_b$)シクロアルキル基上の置換基 R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} が2個以上存在するとき、それぞれの R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。

10

【0056】

本明細書における R^5 によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルケニル、 R^{15} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルケニル、 R^{22} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルケニル又は R^{30} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルケニルの表記は、任意の R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの($C_a \sim C_b$)アルケニル基上の置換基 R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} が2個以上存在するとき、それぞれの R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。

20

【0057】

本明細書における R^5 によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキニル、 R^{15} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキニル、 R^{22} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキニル又は R^{30} によって任意に置換された($C_a \sim C_b$)アルキニルの表記は、任意の R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキニル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの($C_a \sim C_b$)アルキニル基上の置換基 R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} が2個以上存在するとき、それぞれの R^5 、 R^{15} 、 R^{22} 又は R^{30} は互いに同一でも、または互いに相異なってもよい。

30

【0058】

本明細書における

[R^{1d} は R^{1c} と一緒にあって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{1c} 及び R^{1d} が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つオキシ基又はチオキシ基によって任意に置換されていてもよく、]

[R^2 は R^1 と一緒にあって $C_4 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^1 及び R^2 が結合する窒素原子と共に5～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つオキシ基又はチオキシ基によって任意に置換されていてもよく、]

40

[R^8 は R^7 と一緒にあって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^7 及び R^8 が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つオキシ基又はチオキシ基によって任意に置換されていてもよく、]

[R^{24} は R^{23} と一緒にあって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{23} 及び R^{24} が結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つオキシ基又はチオキシ基によ

50

て任意に置換されていてもよく、]、
及び

[R²⁹はR²⁸と一緒にあってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、R²⁸及びR²⁹が結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、且つオキソ基によって任意に置換されていてもよく、]

等の表記の具体例としては、例えばアジリジン、アゼチジン、アゼチジン-2-オン、ピロリジン、ピロリジン-2-オン、オキサゾリジン、オキサゾリジン-2-オン、オキサゾリジン-2-チオン、チアゾリジン、チアゾリジン-2-オン、チアゾリジン-2-チオン、イミダゾリジン、イミダゾリジン-2-オン、イミダゾリジン-2-チオン、ピペリジン、ピペリジン-2-オン、ピペリジン-2-チオン、2H-3,4,5,6-テトラヒドロ-1,3-オキサジン-2-オン、2H-3,4,5,6-テトラヒドロ-1,3-オキサジン-2-チオン、モルホリン、2H-3,4,5,6-テトラヒドロ-1,3-チアジン-2-オン、2H-3,4,5,6-テトラヒドロ-1,3-チアジン-2-チオン、チオモルホリン、チオモルホリン-1-オキシド、チオモルホリン-1,1-ジオキシド、ペルヒドロピリミジン-2-オン、ピペラジン、ホモピペリジン、ホモピペリジン-2-オン、ヘプタメチレンイミン等が挙げられ、各々の指定の原子数の範囲で選択される。

10

【0059】

本明細書における

[R^{4a}はR⁴と一緒にあってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、R⁴及びR^{4a}が結合する炭素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、]

20

の表記の具体例としては、例えばシクロプロパン環、シクロブタン環、シクロペンタン環、テトラヒドロフラン環、テトラヒドロチオフェン環、ピロリジン環、シクロヘキサン環、テトラヒドロピラン環、テトラヒドロチオピラン環、ピペリジン環、シクロヘプタン環、オキセパン環、チエパン環、アゼパン環等が挙げられ、各々の指定の原子数の範囲で選択される。

【0060】

本明細書における

[R^{8a}はR^{7a}と一緒にあってC₄~C₆アルキレン鎖を形成することにより、R^{7a}及びR^{8a}が結合する炭素原子と共に5~7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子1個を含んでいてもよく、]

30

の表記の具体例としては、例えばシクロペンチリデン、テトラヒドロフラン-3-イリデン、テトラヒドロチオフェン-3-イリデン、シクロヘキシリデン、テトラヒドロピラン-3-イリデン、テトラヒドロピラン-4-イリデン、テトラヒドロチオピラン-3-イリデン、テトラヒドロチオピラン-4-イリデン等が挙げられ、各々の指定の原子数の範囲で選択される。

【0061】

本明細書における

[R¹²はR¹¹と一緒にあってC₂~C₆アルキレン鎖を形成することにより、R¹¹及びR¹²が結合する窒素原子と共に3~7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、]

40

[R¹⁷はR¹⁶と一緒にあってC₂~C₆アルキレン鎖を形成することにより、R¹⁶及びR¹⁷が結合する窒素原子と共に3~7員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、]

[R^{17a}はR^{16a}と一緒にあってC₄~C₇アルキレン鎖を形成することにより、R^{16a}及びR^{17a}が結合する窒素原子と共に5~8員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を1個含んでいてもよく、]

及び

[R³⁴はR³³と一緒にあってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、R³³及びR³⁴が結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよく、]

50

等の表記の具体例としては、例えばアジリジン、アゼチジン、ピロリジン、オキサゾリジン、チアゾリジン、イミダゾリジン、ピペリジン、モルホリン、チオモルホリン、チオモルホリン-1-オキシド、チオモルホリン-1,1-ジオキシド、ピペラジン、ホモピペリジン、ヘプタメチレンイミン等が挙げられ、各々の指定の原子数の範囲で選択される。

【 0 0 6 2 】

本発明に包含される化合物において、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 で表される原子の組合せとして、例えば下記の各群が挙げられる。

すなわち、A-I : A^1 がC-Y、 A^2 、 A^3 及び A^4 がC-H。

A-II : A^1 がC-Y、 A^2 及び A^3 がC-H、 A^4 がN。

A-III : A^1 がN、 A^2 、 A^3 及び A^4 がC-H。

A-IV : A^1 がC-Y、 A^2 及び A^4 がC-H、 A^3 がN。

A-V : A^1 がC-Y、 A^2 がN、 A^3 及び A^4 がC-H。

A-VI : A^1 がC-Y、 A^2 及び A^3 がN、 A^4 がC-H。

A-VII : A^1 がC-Y、 A^2 及び A^4 がN、 A^3 がC-H。

A-VIII : A^1 がC-Y、 A^2 がC-H、 A^3 及び A^4 がN。

A-IX : A^1 及び A^4 がN、 A^2 及び A^3 がC-H。

A-X : A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 がC-Y又はN。

これらのうち、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び A^4 で表される原子の組合せとしてはA-I、A-II、A-III、A-IV及びA-Vがより好ましく、さらに、A-I、A-II及びA-IIIが特に好ましい。

10

20

【 0 0 6 3 】

本発明に包含される化合物において、 A^5 で表される原子として、例えば $-\text{CH}(\text{R}^{3a})-$ [このとき、 R^{3a} は水素原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルを表す。]、O及びSが挙げられ、これらの内、 $-\text{CH}(\text{R}^{3a})-$ [このとき、 R^{3a} は水素原子又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルを表す。]及びSが好ましく、さらに、 $-\text{CH}_2-$ が特に好ましい。

【 0 0 6 4 】

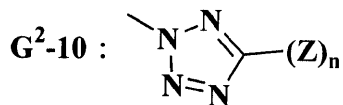
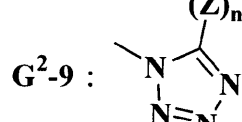
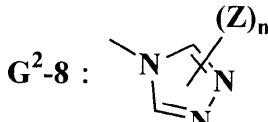
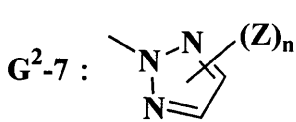
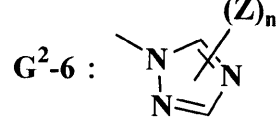
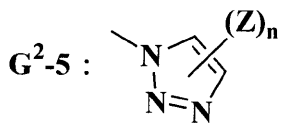
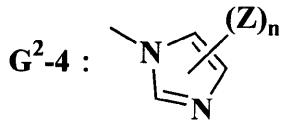
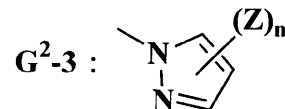
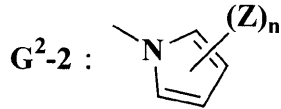
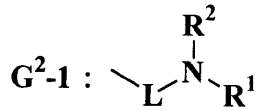
本発明に包含される化合物において、 G^1 で表される置換基としては、例えばベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環、ピラジン環、ピリダジン環等の芳香族6員環及びフラン環、チオフエン環、イソキサゾール環、イソチアゾール環、ピラゾール環、オキサゾール環、チアゾール環、イミダゾール環等の芳香族5員環が挙げられ、これらの内、フェニル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-チエニル基、3-チエニル基、3-ピラゾリル基、4-ピラゾリル基、2-チアゾリル基、4-チアゾリル基及び5-チアゾリル基が好ましく、さらに、フェニル基が特に好ましい。

30

【 0 0 6 5 】

本発明に包含される化合物において、 G^2 で表される置換基として、例えば下記に示す $G^2-1 \sim G^2-10$ で表される構造が挙げられ、これらの内、 G^2-1 、 G^2-3 、 G^2-5 、 G^2-6 、 G^2-8 及び G^2-9 が好ましく、さらに、 G^2-1 、 G^2-6 及び G^2-9 が特に好ましい。

【化7】



10

20

【0066】

本発明に包含される化合物において、Lで表される構造の好ましい範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

すなわち、L-I: $-\text{CH}(R^4)-$ [ここで、 R^4 は水素原子、シアノ又はメチルを表す。]

L-II: $-\text{CH}(R^4)-$ [ここで、 R^4 は水素原子、シアノ、メチル、エチニル又は $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ を表す。]

L-III: $-\text{C}(R^4)(R^{4a})-$ [ここで、 R^4 は水素原子、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、エチニル、 $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ 又はD10を表し、 R^{4a} は水素原子を表し、 p_4 は0を表す。]

L-IV: $-\text{C}(R^4)(R^{4a})-$ [ここで、 R^4 と R^{4a} とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^4 及び R^{4a} が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成することを表す。]

30

L-V: $-\text{C}(R^4)(R^{4a})-$ [ここで、 R^4 は水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ 、フェニル、D9又はD10を表し、 R^{4a} は水素原子を表し、 p_4 は0を表す。]

L-VI: $-\text{C}(R^4)(R^{4a})-$ [ここで、 R^4 はシアノ又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 R^{4a} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表すか、或いは、 R^4 と R^{4a} とは一緒になってエチレン鎖を形成することにより、 R^4 及び R^{4a} が結合する炭素原子と共にシクロプロピル環を形成してもよい。]

L-VII: $-\text{C}(R^4)(R^{4a})\text{CH}_2-$ [ここで、 R^4 は水素原子、メチル、シアノ又は $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ を表し、 R^{4a} は水素原子を表す。]

L-VIII: $-\text{N}(R^{4b})-$ 及び $-\text{C}(R^4)(R^{4a})\text{N}(R^{4b})-$ [ここで、 R^4 は水素原子又はメチルを表し、 R^{4a} は水素原子を表し、 R^{4b} は水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表す。]

40

これらのうち、Lで表される構造としてはL-I、L-II、L-III及びL-IVがより好ましく、さらに、L-I及びL-IIが特に好ましい。

【0067】

本発明に包含される化合物において、Xで表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。このとき、下記のそれぞれの場合においてmが2以上の整数を表すとき、各々のXは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい。

すなわち、X-I: ハロゲン原子及びトリフルオロメチル [ここで、mは1~3の整数を表す。]

50

X-II : ハロゲン原子、シアノ、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルコキシ及び $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルチオ [ここで、 m は1～3の整数を表す。]。

X-III : ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルチオ及び $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルチオ [ここで、 m は1～3の整数を表す。]。

X-IV : ハロゲン原子、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)ハロアルキル、 $-\text{OR}^6$ 及び $-\text{S}(\text{O})_r\text{R}^6$ [ここで、 R^6 は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルコキシ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)ハロアルキルを表し、 r は0～2の整数を表し、 m は1を表す。]。

X-V : ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-\text{SF}_5$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)ハロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)ハロアルキル、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{OR}^6$ 及び $-\text{S}(\text{O})_r\text{R}^6$ [ここで、 R^6 は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルコキシ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)ハロアルキルを表し、 r は0～2の整数を表し、 m は2又は3の整数を表す。]。

X-VI : m が2を表し、2つのXが隣接して $-\text{CF}_2\text{OCF}_2-$ 、 $-\text{OCF}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CF}_2\text{OCF}_2\text{O}-$ 又は $-\text{OCF}_2\text{CF}_2\text{O}-$ を形成することにより、それぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成する。

本発明に包含される化合物において、Xで表される置換基の数を表す m としては0～5の整数が挙げられ、これらのうち m は1、2及び3が好ましい。

【0068】

本発明に包含される化合物において、Yで表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。このとき、Yで表される置換基が同時に2個以上存在するとき、各々のYは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい。

すなわち、Y-I : 水素原子、ハロゲン原子、ニトロ及びメチル。

Y-II : 水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_3$ アルキニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルチオ及び $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ 。

Y-III : 水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_4$ アルキニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルチオ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルチオ及び $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ 。

Y-IV : 水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、 R^5 によって置換された($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$)アルキル [ここで、 R^5 は $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルチオ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルフィニル又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルホニルを表す。]、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル及び $-\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ 。

Y-V : $-\text{OR}^6$ 、 $-\text{S}(\text{O})_r\text{R}^6$ [ここで、 R^6 は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキルを表し、 r は0～2の整数を表す。]及び $-\text{N}(\text{R}^8)\text{R}^7$ [ここで、 R^7 は水素原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CHO}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルカルボニル又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシカルボニルを表し、 R^8 は水素原子又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルを表す。]。

Y-VI : D1～D3、D7、D11及びD22 [ここで、 p_2 、 p_3 及び p_4 は0を表す。]。

Y-VII : 隣接する2つのYが $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、それぞれのYが結合する炭素原子と共に6員環を形成する。

【0069】

本発明に包含される化合物において、Zで表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。このとき、下記のそれぞれの場合において n が2以上の整数を表すとき、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい。

すなわち、Z-I : ハロゲン原子、ニトロ、メチル及び $-\text{NH}_2$ 。

Z-II : ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{11a}$ 及び $-\text{C}(\text{S})\text{NHR}^{11a}$ [ここで、 R^{11a} は水素原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル、 R^{22} によって置換された($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$)アルキル、シクロプロピル、E4又は $-\text{CH}=\text{NOR}^{10}$ を表し、 R^{10} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルを表し、 R^{22} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルアミノカルボニル、D10又はD32を表し、 p_2 、 p_4 、 q_6 及び t は0を表す。]。

10

20

30

40

50

Z-III: ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR^6$ 、 $-S(O)_rR^6$ [ここで、 R^6 は $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、 r は0～2の整数を表す。]及び $-NH_2$ 。

Z-IV: $-C(O)N(R^{12a})R^{11a}$ 及び $-C(S)N(R^{12a})R^{11a}$ [ここで、 R^{11a} は水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 R^{22} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、E4、 $-CH=NOR^{10}$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-N(R^{12b})R^{11b}$ 、D34又はD35を表し、 R^{10} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 R^{11b} はフェニル又はD34を表し、 R^{12b} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 R^{12a} は水素原子、 R^{22a} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、シクロプロピルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表し、 R^{22} は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルアミノカルボニル、D10又はD32を表し、 R^{22a} はシアノ又は $-OR^{23}$ を表し、 R^{23} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-C(O)R^{31}$ 又は $-C(O)OR^{32}$ を表し、 R^{31} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し、 R^{32} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 p_2 、 p_4 、 q_6 及び t は0を表し、 p_3 は0又は1の整数を表す。]

10

本発明に包含される化合物において、Zで表される置換基の数を表す n としては0～4の整数が挙げられ、これらのうち n は0及び1が好ましい。

【0070】

本発明に包含される化合物において、 R^1 で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

すなわち、 R^1-I : $-C(O)R^{1a}$ [ここで、 R^{1a} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル、シクロプロピル、E4又はE5を表し、 R^{15} はシクロプロピル又は $-S(O)_rR^{25}$ を表し、 R^{25} は $C_1 \sim C_2$ アルキル又は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルを表し、 q_6 は0を表し、 r は0～2の整数を表す。]

20

R^1-II : $-C(O)NHR^{1c}$ [ここで、 R^{1c} は $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、シクロプロピル又はプロパルギルを表す。]

R^1-III : $-C(O)R^{1a}$ 及び $-C(S)R^{1a}$ [ここで、 R^{1a} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、E4、E5、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル又はD32を表し、 R^{15} はハロゲン原子、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-S(O)_rR^{25}$ 、 $-S(O)_t(R^{25})=NR^{21}$ 又は $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ を表し、 R^{21} は水素原子又は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルカルボニルを表し、 R^{23} はシアノ($C_1 \sim C_2$)アルキルを表し、 R^{24} は水素原子又は $C_1 \sim C_2$ アルコキシカルボニルを表し、 R^{25} は $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル又はシアノメチルを表し、 R^{28} は水素原子又は $C_1 \sim C_2$ アルキルを表し、 R^{29} は水素原子又はメチルを表し、 Z^a はハロゲン原子、シアノ、ニトロ又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し、 p_1 及び p_2 が2以上の整数を表すとき、各々の Z^a は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 p_1 は1～3の整数を表し、 p_2 は0～2の整数を表し、 q_6 は0を表し、 r は0～2の整数を表し、 t は0又は1の整数を表す。]

30

R^1-IV : $-C(O)SR^{1b}$ [ここで、 R^{1b} は $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表す。]

R^1-V : $-C(O)N(R^{1d})R^{1c}$ [ここで、 R^{1c} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は $C_3 \sim C_4$ アルキニルを表し、 R^{1d} は水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表す。]

40

R^1-VI : 水素原子、 $-C(O)R^{1a}$ 及び $-C(S)R^{1a}$ [ここで、 R^{1a} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、E4、E5、E10、E13、E20、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-CH=NOR^{10}$ 、 $(Z^a)_{p_1}$ によって置換されたフェニル、D2、D8又はD32を表し、 R^{10} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 R^{14} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 R^{15} はハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $-N(R^{24})R^{23}$ 、 $-S(O)_rR^{25}$ 、 $-S(O)_t(R^{25})=NR^{21}$ 又は $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ を表し、 R^{21} は水素原子、シアノ又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニルを表し、 R^{23} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、シアノ($C_1 \sim C_4$)アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニ

50

ルを表し、 R^{24} は水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルを表し、 R^{25} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ アルキニル、 $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 又は $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ を表し、 R^{28} は水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル又はシクロプロピルメチルを表し、 R^{29} は水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 R^{30} はハロゲン原子、シアノ又は $-C(O)N(R^{34})R^{33}$ を表し、 R^{31} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、D7、D11又はD22を表し、 R^{32} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 R^{33} は $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、 R^{34} は水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 Z^a はハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオを表し、 p_1 及び p_2 が2以上の整数を表すとき、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 p_1 は1～3の整数を表し、 p_2 は0～2の整数を表し、 p_3 及び p_4 は0又は1の整数を表し、 q_4 、 q_6 及び q_8 は0を表し、 r は0～2の整数を表し、 t は0又は1を表す。]

10

R^1 -VII：水素原子、 $-C(O)OR^{1b}$ 及び $-C(O)SR^{1b}$ [ここで、 R^{1b} は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表す。]

R^1 -VIII：水素原子、 $-C(O)N(R^{1d})R^{1c}$ 及び $-C(S)N(R^{1d})R^{1c}$ [ここで、 R^{1c} は $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{15} によって任意に置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $-N(R^{17})R^{16}$ を表し、 R^{15} はシアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ を表し、 R^{16} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、 R^{17} は水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、 R^{28} は $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、 R^{29} は水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、 R^{1d} は水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{1d} は R^{1c} と一緒に $C_4 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、 R^{1c} 及び R^{1d} が結合する窒素原子と共に5～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を1個含んでいてもよく、且つメチル基又はオキソ基によって任意に置換されていてもよいことを表す。]

20

【0071】

本発明に包含される化合物において、 R^2 で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

すなわち、 R^2 -I：水素原子。

30

R^2 -II： $C_1 \sim C_2$ アルキル、シクロプロピルメチル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシメチル、シアノメチル、アリル及びプロパルギル。

R^2 -III： $C_1 \sim C_4$ アルキル、 R^{15a} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル [ここで、 R^{15a} はシアノ、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、 R^{28} は水素原子又は $C_1 \sim C_2$ アルキルを表し、 R^{29} は水素原子又はメチルを表す。]、 $C_3 \sim C_4$ アルケニル及び $C_3 \sim C_4$ アルキニル。

R^2 -IV： R^{15a} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル [ここで、 R^{15a} は $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ又は $-N(R^{24})R^{23}$ を表し、 R^{23} は $-C(O)R^{31}$ 又は $C_1 \sim C_2$ アルコキシカルボニルを表し、 R^{24} は水素原子を表し、 R^{31} は $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル又はシクロプロピルを表す。]

40

R^2 -V： $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル($C_1 \sim C_2$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ。

R^2 -VI： R^{15a} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル [ここで、 R^{15a} は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ又は $-N(R^{24})R^{23}$ を表し、 R^{23} は $-C(O)R^{31}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルを表し、 R^{24} は水素原子を表し、 R^{31} は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し、 R^{32} は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表す。]

R^2 -VII： R^{15a} によって置換された($C_1 \sim C_2$)アルキル [ここで、 R^{15a} はシアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $-C(O)N(R^{29})R^{28}$ 又は $-C(S)NH_2$ を表し、 R^{28} は水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルを表し、 R^{29} は水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表す。]

50

【 0 0 7 2 】

本発明に包含される化合物において、 R^3 で表される置換基の好ましい範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

すなわち、 R^3 -I：トリフルオロメチル及びクロロジフルオロメチル。

R^3 -II：ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、プロモジフルオロメチル、1,1,2,2-テトラフルオロエチル及びペンタフルオロエチル。

R^3 -III：任意のハロゲン原子2個以上によって任意に置換された $C_1 \sim C_2$ アルキル。

R^3 -IV： $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル。

R^3 -V： $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル。

R^3 -VI： $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル。

これらのうち、 R^3 で表される置換基の好ましい範囲としては R^3 -I及び R^3 -IIがより好ましく、さらに、 R^3 -Iが特に好ましい。

10

【 0 0 7 3 】

これらの本発明に包含される化合物における各置換基の範囲を示す各群は、それぞれ任意に組み合わせることができそれぞれ本発明の化合物の範囲を表す。

【 0 0 7 4 】

G^2 が G^2 -1で表される構造を表すとき、X、Y、 R^1 及び R^2 についての範囲の組み合わせの例としては、例えば以下の第1表に示す組み合わせが挙げられる。但し、第1表の組み合わせは例示のためのものであって、本発明はこれらだけに限定されるものではない。

20

【表1】

第1表				第1表 (続き)			
X	Y	R^1	R^2	X	Y	R^1	R^2
X-I	Y-I	R^1 -I	R^2 -I	X-I	Y-VII	R^1 -II	R^2 -I
X-I	Y-I	R^1 -I	R^2 -II	X-II	Y-I	R^1 -I	R^2 -I
X-I	Y-I	R^1 -I	R^2 -III	X-II	Y-I	R^1 -I	R^2 -II
X-I	Y-I	R^1 -I	R^2 -IV	X-II	Y-I	R^1 -I	R^2 -III
X-I	Y-I	R^1 -I	R^2 -V	X-II	Y-I	R^1 -I	R^2 -IV
X-I	Y-I	R^1 -I	R^2 -VI	X-II	Y-I	R^1 -II	R^2 -I
X-I	Y-I	R^1 -I	R^2 -VII	X-II	Y-I	R^1 -II	R^2 -II
X-I	Y-I	R^1 -II	R^2 -I	X-II	Y-I	R^1 -II	R^2 -III
X-I	Y-I	R^1 -II	R^2 -II	X-II	Y-I	R^1 -II	R^2 -IV
X-I	Y-I	R^1 -II	R^2 -III	X-II	Y-I	R^1 -III	R^2 -I
X-I	Y-I	R^1 -II	R^2 -IV	X-II	Y-I	R^1 -III	R^2 -II
X-I	Y-I	R^1 -II	R^2 -V	X-II	Y-I	R^1 -IV	R^2 -I
X-I	Y-I	R^1 -II	R^2 -VI	X-II	Y-I	R^1 -IV	R^2 -II
X-I	Y-I	R^1 -II	R^2 -VII	X-II	Y-I	R^1 -V	R^2 -I
X-I	Y-I	R^1 -III	R^2 -I	X-II	Y-I	R^1 -V	R^2 -II
X-I	Y-I	R^1 -III	R^2 -II	X-II	Y-I	R^1 -VI	R^2 -I
X-I	Y-I	R^1 -III	R^2 -III	X-II	Y-I	R^1 -VII	R^2 -I
X-I	Y-I	R^1 -III	R^2 -IV	X-II	Y-I	R^1 -VIII	R^2 -I

30

40

【表 2】

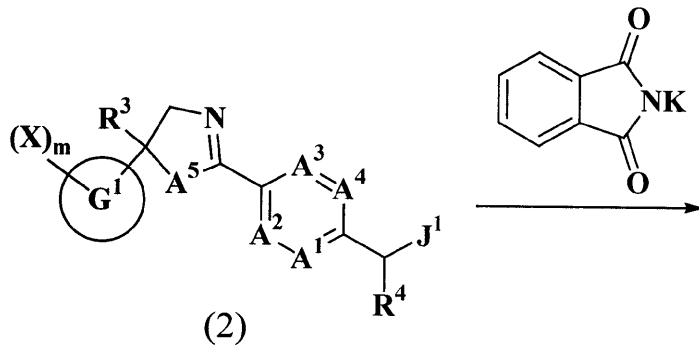
X-I	Y-I	R ¹ -IV	R ² -I	X-II	Y-II	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-I	R ¹ -IV	R ² -II	X-II	Y-II	R ¹ -I	R ² -II	
X-I	Y-I	R ¹ -IV	R ² -III	X-II	Y-II	R ¹ -I	R ² -III	
X-I	Y-I	R ¹ -IV	R ² -IV	X-II	Y-II	R ¹ -I	R ² -IV	
X-I	Y-I	R ¹ -V	R ² -I	X-II	Y-II	R ¹ -II	R ² -I	
X-I	Y-I	R ¹ -V	R ² -II	X-II	Y-II	R ¹ -II	R ² -II	
X-I	Y-I	R ¹ -V	R ² -III	X-II	Y-II	R ¹ -II	R ² -III	
X-I	Y-I	R ¹ -V	R ² -IV	X-II	Y-II	R ¹ -II	R ² -IV	
X-I	Y-I	R ¹ -VI	R ² -I	X-II	Y-II	R ¹ -III	R ² -I	10
X-I	Y-I	R ¹ -VI	R ² -II	X-II	Y-II	R ¹ -III	R ² -II	
X-I	Y-I	R ¹ -VII	R ² -I	X-II	Y-II	R ¹ -IV	R ² -I	
X-I	Y-I	R ¹ -VII	R ² -II	X-II	Y-II	R ¹ -IV	R ² -II	
X-I	Y-I	R ¹ -VIII	R ² -I	X-II	Y-II	R ¹ -V	R ² -I	
X-I	Y-I	R ¹ -VIII	R ² -II	X-II	Y-II	R ¹ -V	R ² -II	
X-I	Y-II	R ¹ -I	R ² -I	X-II	Y-II	R ¹ -VI	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -I	R ² -II	X-II	Y-II	R ¹ -VII	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -I	R ² -III	X-II	Y-II	R ¹ -VIII	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -I	R ² -IV	X-II	Y-III	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -II	R ² -I	X-II	Y-III	R ¹ -I	R ² -II	20
X-I	Y-II	R ¹ -II	R ² -II	X-II	Y-III	R ¹ -II	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -II	R ² -III	X-II	Y-IV	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -II	R ² -IV	X-II	Y-V	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -III	R ² -I	X-II	Y-VI	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -III	R ² -II	X-II	Y-VII	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -IV	R ² -I	X-III	Y-I	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -IV	R ² -II	X-III	Y-I	R ¹ -I	R ² -II	
X-I	Y-II	R ¹ -V	R ² -I	X-III	Y-I	R ¹ -II	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -V	R ² -II	X-III	Y-I	R ¹ -II	R ² -II	
X-I	Y-II	R ¹ -VI	R ² -I	X-III	Y-I	R ¹ -III	R ² -I	30
X-I	Y-II	R ¹ -VII	R ² -I	X-III	Y-I	R ¹ -IV	R ² -I	
X-I	Y-II	R ¹ -VIII	R ² -I	X-III	Y-I	R ¹ -V	R ² -I	
X-I	Y-III	R ¹ -I	R ² -I	X-III	Y-II	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-III	R ¹ -I	R ² -II	X-III	Y-II	R ¹ -I	R ² -II	
X-I	Y-III	R ¹ -II	R ² -I	X-III	Y-II	R ¹ -II	R ² -I	
X-I	Y-III	R ¹ -II	R ² -II	X-III	Y-III	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-III	R ¹ -III	R ² -I	X-III	Y-III	R ¹ -I	R ² -II	
X-I	Y-III	R ¹ -IV	R ² -I	X-IV	Y-I	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-III	R ¹ -V	R ² -I	X-IV	Y-I	R ¹ -II	R ² -I	
X-I	Y-IV	R ¹ -I	R ² -I	X-IV	Y-II	R ¹ -I	R ² -I	40
X-I	Y-IV	R ¹ -II	R ² -I	X-V	Y-I	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-V	R ¹ -I	R ² -I	X-V	Y-I	R ¹ -II	R ² -I	
X-I	Y-V	R ¹ -II	R ² -I	X-V	Y-II	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-VI	R ¹ -I	R ² -I	X-VI	Y-I	R ¹ -I	R ² -I	
X-I	Y-VI	R ¹ -II	R ² -I	X-VI	Y-I	R ¹ -II	R ² -I	
X-I	Y-VII	R ¹ -I	R ² -I	X-VI	Y-II	R ¹ -I	R ² -I	

【 0 0 7 5 】

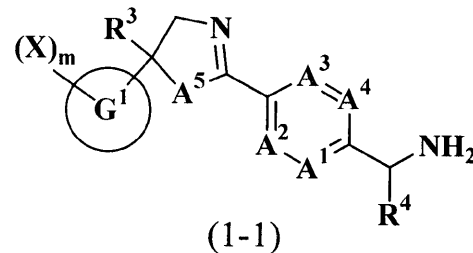
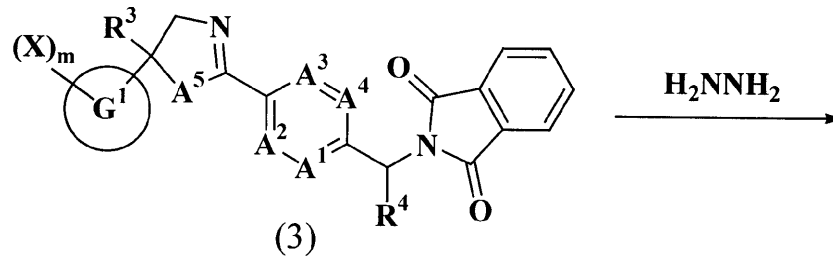
本発明の化合物は、例えば以下の方法により製造することが出来る。

製造法A

【化 8】



10



20

例えばジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー [J. Heterocyclic Chem .] 2003年、40巻、229頁等に記載の方法に準じて、一般式(2) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表し、 J^1 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホネート基 (例えば、メタンスルホニルオキシ基) 又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホネート基 (例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基) 等を表す。] で表される化合物1当量と1~1.5当量のフタルイミドカリウムとを、例えばトルエン、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、アセトン、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等を溶媒として用い、必要ならば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の塩基0.1~2当量の存在下、必要ならば触媒として0.1~1当量のテトラブチルアンモニウムヨード、トリブチルヘキサデシルホスホニウムブロミド、クラウンエーテル(18-Crown-6)等を添加し、室温~反応混合物の還流温度の温度範囲で0.5~24時間反応させることにより得られる一般式(3) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、例えばトルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、水又はそれらの2種類以上の任意の割合の混合物等を溶媒として用い、必要ならば窒素、アルゴン等の不活性ガス雰囲気下、一般式(3)で表される化合物1当量に対して1~4当量のヒドラジン-水和物又はヒドラジン水溶液と室温~反応混合物の還流温度の温度範囲で1~24時間反応させることにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 L が $-CH(R^4)-$ であり、 R^1 及び R^2 が水素原子である一般式(1-1) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物を得ることができる。

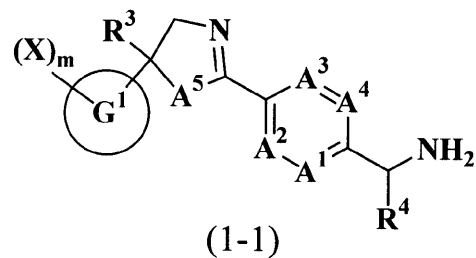
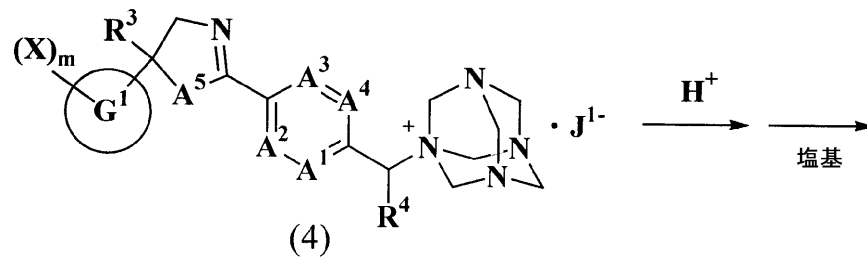
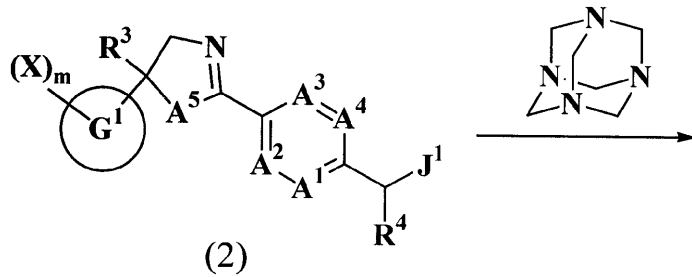
30

40

【0076】

製造法B

【化9】



例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1999年、64巻、1015頁等に記載の方法に準じて、一般式(2) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 , m 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物1当量と1~1.3当量のヘキサメチレンテトラミンとを、例えばベンゼン、トルエン、クロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、メタノール、エタノール等を溶媒として用い、室温~反応混合物の還流温度の温度範囲で0.5~24時間反応させることにより得られる一般式(4) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 , m 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される4級アンモニウム塩を、例えばメタノール、エタノール、酢酸、プロピオン酸、水又はそれらの2種類以上の任意の割合の混合物等を溶媒として用い、一般式(4)で表される化合物1当量に対して5~100当量の塩酸、臭化水素酸、プロピオン酸、リン酸等の酸触媒存在下、室温~反応混合物の還流温度の温度範囲で0.5~24時間加水分解することにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 L が $-CH(R^4)-$ であり、 R^1 及び R^2 が水素原子である一般式(1-1) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明の化合物を得ることができる。

【0077】

製造法C

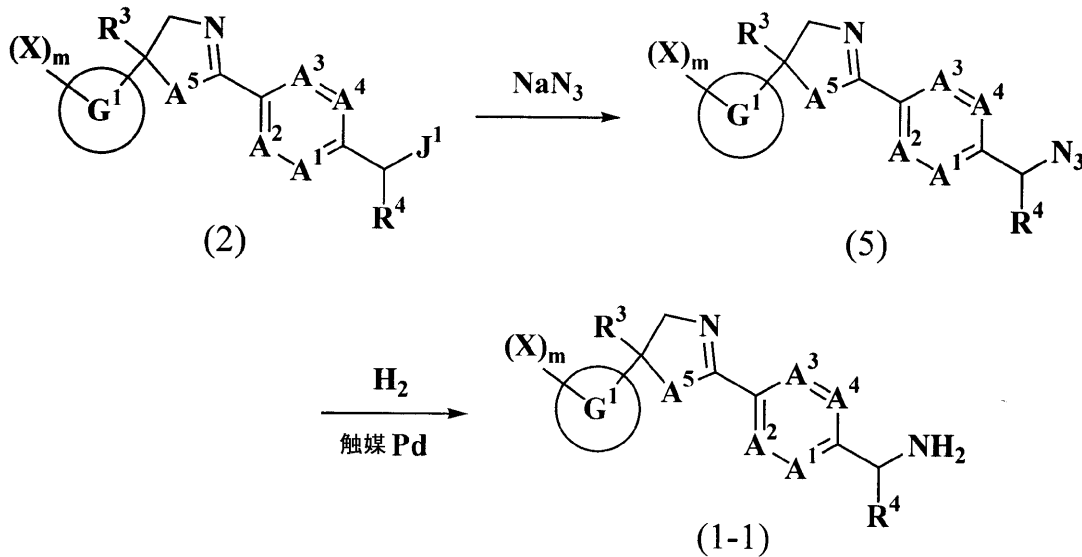
10

20

30

40

【化10】



10

例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1993年、36巻、2558頁等に記載の方法に準じて、一般式(2) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 , m 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物1当量と1.1~3.0当量のアジ化ナトリウム又はアジ化リチウムとを、必要ならば窒素、アルゴン等の不活性ガス雰囲気下、例えばクロロホルム、エタノール、アセトン、 N,N -ジメチルホルムアミド、DMPU (N,N' -ジメチルプロピレンウレア)、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、水又はそれらの2種類以上の任意の割合の混合物等を溶媒として用い、必要ならば触媒として0.005~0.3当量のテトラブチルアンモニウムヒドロジェンスルフェート、メチルトリオクチルアンモニウムクロリド、ヨウ化リチウム、ヨウ化カリウム等を添加し、室温~反応混合物の還流温度の温度範囲で0.5~48時間反応させることにより得られる一般式(5) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、例えばエタノール、テトラヒドロフラン、アセトニトリル又はそれらの2種類以上の任意の割合の混合物等を溶媒として用い、一般式(5)で表される化合物1当量に対して1~1.5当量のトリフェニルホスフィン及び2~5当量の水と、室温~反応混合物の還流温度の温度範囲で2~24時間反応させることにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 L が $-\text{CH}(R^4)-$ であり、 R^1 及び R^2 が水素原子である一般式(1-1) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^4 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物を得ることができる。

20

30

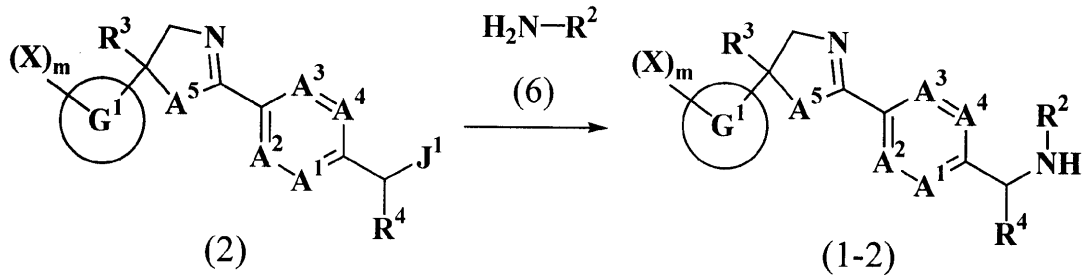
また、一般式(5)で表される化合物を、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 2003年、46巻、3116頁等に記載の方法に準じて、例えばジクロロメタン、メタノール、エタノール、酢酸エチル又はそれらの2種類以上の任意の割合の混合物等の溶媒中、酸化白金(IV)、パラジウム-炭等を触媒として用い、1~4気圧の水素ガス雰囲気下、室温にて20分~24時間水素添加することにより、一般式(1-1)で表される本発明の化合物を得ることもできる。

40

【0078】

製造法D

【化 1 1】



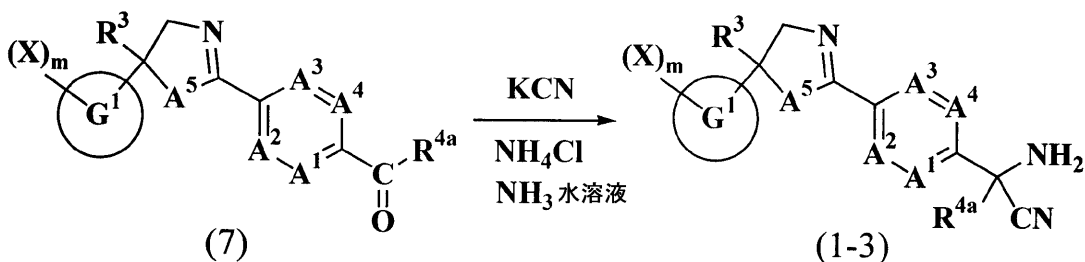
一般式(2) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 , m 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物 1 当量と 1 ~ 40 当量の一般式(6) [式中、 R^2 は水素原子、アルキル基、置換アルキル基、アルケニル基、アルキニル基等を表す。] で表されるアミン又はその塩とを、必要ならばベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、メタノール、エタノール、tert-ブチルメチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、N, N-ジメチルホルムアミド、DMPU (N, N'-ジメチルプロピレンウレア)、アセトニトリル、水又はそれらの2種類以上の任意の割合の混合物等を溶媒として用い、必要ならば水酸化リチウム、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、トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン等の塩基 1 ~ 10 当量の存在下、必要ならば触媒として 0.1 ~ 0.5 当量のヨウ化ナトリウム又はヨウ化カリウムを添加し、0 ~ 反応混合物の還流温度の温度範囲で 1 ~ 48 時間反応させることにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 L が $-C(R^4)-$ であり、 R^1 が水素原子である一般式(1-2) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表し、 R^2 は水素原子、アルキル基、置換アルキル基、アルケニル基、アルキニル基等を表す。] で表される本発明の化合物を得ることができる。

ここで用いられる一般式(6)で表される一級アミン類は公知化合物であり、一部は市販品としても入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な一級アミン類の合成方法に準じて容易に合成することができる。

【 0 0 7 9】

製造法E

【化 1 2】



一般式(7) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 及び m は前記と同じ意味を表し、 R^{4a} は水素原子、アルキル基等を表す。] で表される化合物を文献記載の一般的なストレッカー反応、例えばケミストリー・レターズ [Chem. Lett.] 1987年、687頁、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1985年、28巻、1280頁等に記載の反応条件等に準じて反応させることにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 L が $-C(R^{4a})(\text{CN})-$ であり、 R^1 及び R^2 が水素原子である一般式(1-3) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 及び m は前記と同じ意味を表し、 R^{4a} は水素原子、アルキル基等を表す。] で表される本発明の化合物を得ることができる。

【 0 0 8 0】

製造法F

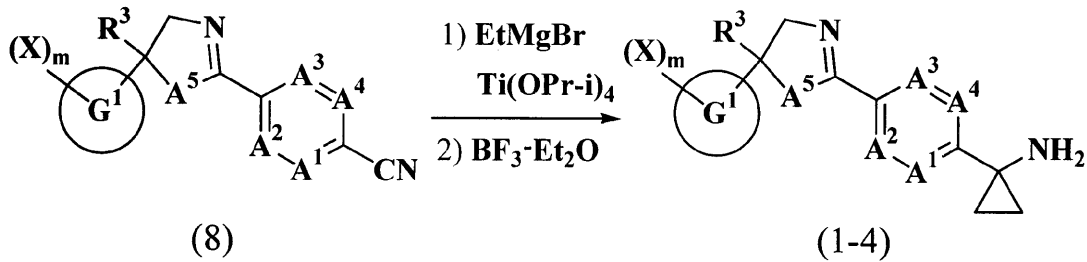
10

20

30

40

【化 1 3】



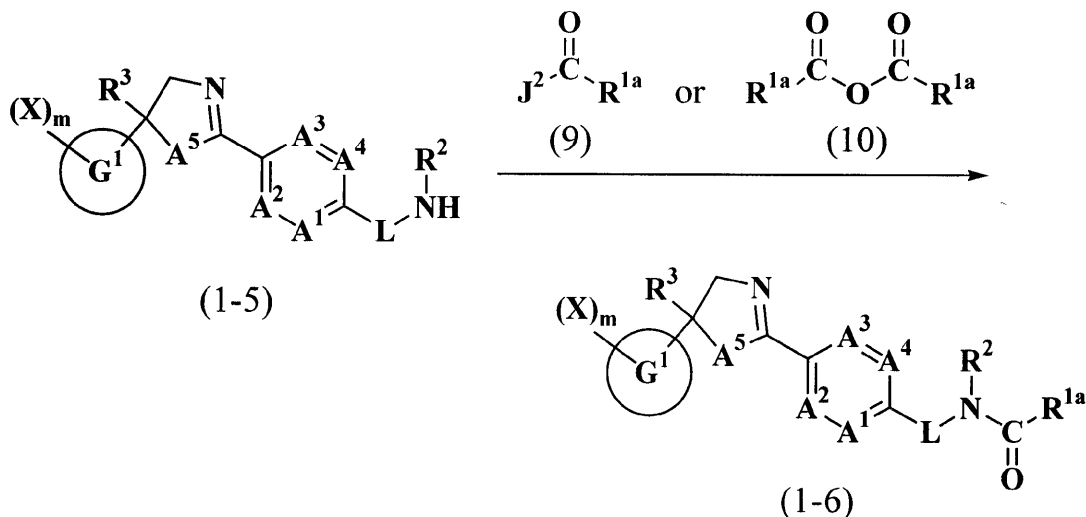
一般式(8) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 及び m は前記と同じ意味を表す。]
 で表される化合物を、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 2003年、68巻、7133頁等に記載の方法に準じてチタニウムテトラ-*i*-プロポキシド存在下、臭化エチルマグネシウムと反応させた後、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体と反応させることにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 L がシクロプロピリデン基であり、 R^1 及び R^2 が水素原子である一般式(1-4) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物を得ることができる。

ここで用いられる一般式(8)で表される化合物の或るものは日本国特許出願公報 (JP 2007/091708号公報) 記載の公知化合物であり、また、それ以外のものも当該文献記載の方法に準じて公知化合物と同様にして合成することができる。

【 0 0 8 1】

製造法G

【化 1 4】



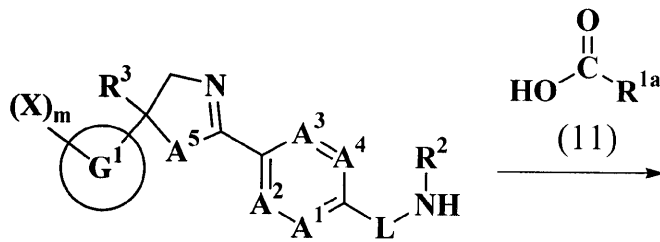
一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 R^1 が水素原子である一般式(1-5) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , L , X , R^2 , R^3 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物 1 当量と 1 ~ 1.5 当量の一般式(9) [式中、 R^{1a} は前記と同じ意味を表し、 J^2 は塩素原子、臭素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基 (例えば、ピバロイルオキシ基)、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルオキシ基 (例えば、イソブチルオキシカルボニルオキシ基) 又はアゾリル基 (例えば、イミダゾール-1-イル基) を表す。] で表される公知のカルボン酸誘導体又は一般式(10) [式中、 R^{1a} は前記と同じ意味を表す。] で表される公知のカルボン酸無水物とを、例えばジクロロメタン、クロロホルム、ジエチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサソラン、酢酸エチル、アセトニトリル等を溶媒として用い、必要ならば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン又は4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の塩基 1 ~ 2 当量の存在下、0 ~ 反応混合物の還流温度の温度範囲で 10 分 ~ 24 時間反応させることにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 R^1 が $-C(O)R^{1a}$ である一般式(1-6) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G

¹, L, X, R^{1a}, R², R³及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明の化合物を得ることができる。

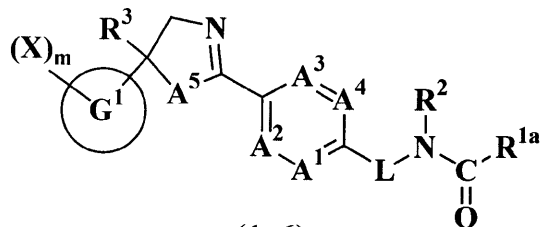
【0082】

製造法H

【化15】



(1-5)



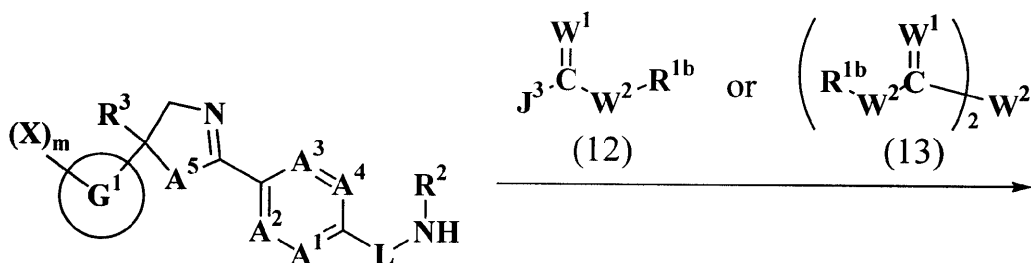
(1-6)

一般式(1)においてG²がG²⁻¹であり、R¹が水素原子である一般式(1-5) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, L, X, R², R³及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明の化合物1当量と1~1.1当量の一般式(11) [式中、R^{1a}は前記と同じ意味を表す。]で表される公知のカルボン酸とを、例えばジクロロメタン、クロロホルム、ジエチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等を溶媒として用い、必要ならば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン又は4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の塩基1~4当量の存在下、1~4当量のWSC(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)、CDI(カルボニルジイミダゾール)等の縮合剤を用い、0~反応混合物の還流温度の温度範囲で10分~24時間反応させることにより、一般式(1)においてG²がG²⁻¹であり、R¹が-C(O)R^{1a}である一般式(1-6) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, L, X, R^{1a}, R², R³及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明の化合物を得ることができる。

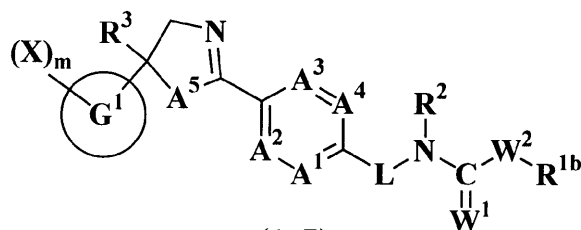
【0083】

製造法I

【化16】



(1-5)



(1-7)

一般式(1)においてG²がG²⁻¹であり、R¹が水素原子である一般式(1-5) [式中、A¹, A²,

10

20

30

40

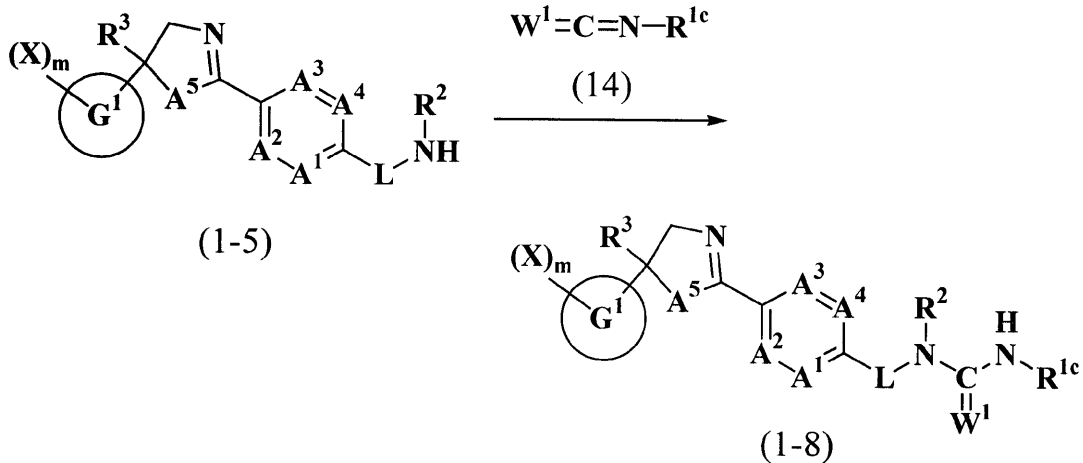
50

$A^3, A^4, A^5, G^1, L, X, R^2, R^3$ 及び m は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明の化合物と公知の一般式(12) [式中、 R^{1b} は前記と同じ意味を表し、 J^3 は塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子を表し、 W^1 及び W^2 は各々独立してO又はSを表す。]で表される化合物又は公知の一般式(13) [式中、 R^{1b} は前記と同じ意味を表し、 W^1 及び W^2 は各々独立してO又はSを表す。]で表される化合物とを、製造法Gと同様な条件を用いて反応させることにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 R^1 が $-C(W^1)-W^2-R^{1b}$ である一般式(1-7) [式中、 $A^1, A^2, A^3, A^4, A^5, G^1, L, X, R^{1b}, R^2, R^3$ 及び m は前記と同じ意味を表し、 W^1 及び W^2 は各々独立してO又はSを表す。]で表される本発明の化合物を得ることができる。

【0084】

製造法J

【化17】



10

20

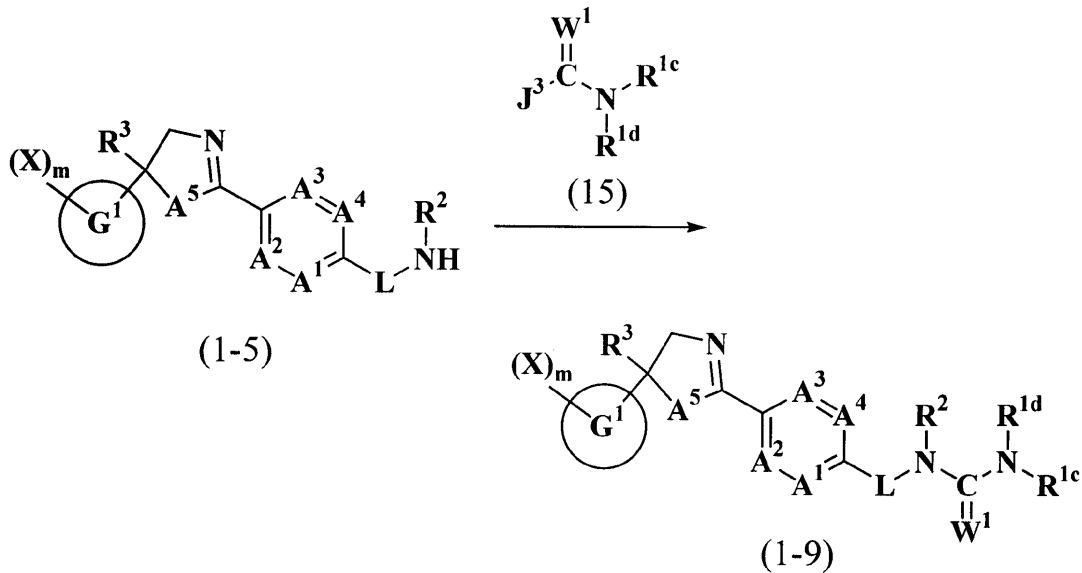
30

一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 R^1 が水素原子である一般式(1-5) [式中、 $A^1, A^2, A^3, A^4, A^5, G^1, L, X, R^2, R^3$ 及び m は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明の化合物1当量と1~1.2当量の一般式(14) [式中、 R^{1c} 及び W^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される公知のイソシアネートとを、例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、N,N-ジメチルホルムアミド、水等を溶媒として用い、必要ならば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン又は4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の塩基1~4当量の存在下、0~反応混合物の還流温度の温度範囲で2分~24時間反応させることにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 R^1 が $-C(W^1)NHR^{1c}$ である一般式(1-8) [式中、 $A^1, A^2, A^3, A^4, A^5, G^1, L, W^1, X, R^{1c}, R^2, R^3$ 及び m は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明の化合物を得ることができる。

【0085】

製造法K

【化 1 8】

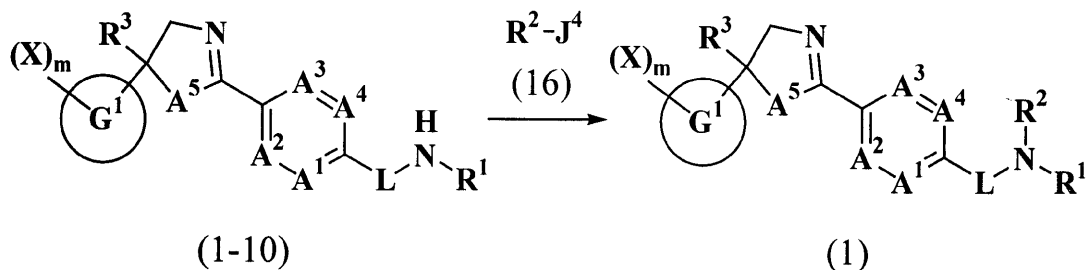


一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 R^1 が水素原子である一般式(1-5) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , L , X , R^2 , R^3 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物と公知の一般式(15) [式中、 R^{1c} , R^{1d} , W^1 及び J^3 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法Gと同様な条件を用いて反応させることにより、一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 R^1 が $-C(W^1)N(R^{1d})R^{1c}$ である一般式(1-9) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , L , W^1 , X , R^{1c} , R^{1d} , R^2 , R^3 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物を得ることができる。

【 0 0 8 6】

製造法L

【化 1 9】



一般式(1)において G^2 が G^2-1 であり、 R^2 が水素原子である一般式(1-10) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , L , X , R^1 , R^3 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物 1 当量と 1 ~ 10 当量の一般式(16) [式中、 R^2 は水素原子以外の前記と同じ意味を表し、 J^4 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基 (例えば、ピバロイルオキシ基)、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホネート基 (例えば、メタンスルホニルオキシ基)、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホネート基 (例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基)、アリールスルホネート基 (例えば、ベンゼンスルホニルオキシ基、p-トルエンスルホニルオキシ基) 又はアゾリル基 (例えば、イミダゾール-1-イル基) のような良好な脱離基を表す。] で表される化合物とを、例えばtert-ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、N,N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル等を溶媒として用い、必要ならば水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、カリウム-tert-ブトキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミン又はピリジン等の塩基 1 ~ 3 当量の存在下、0 ~ 90 の温度範囲で10分 ~ 24時間反応させることにより、一般式(1) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , L , X , R^1 , R^3 及び m は前記と同じ意味を表し、 R^2 は水素原子以外の前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物を

得ることができる。

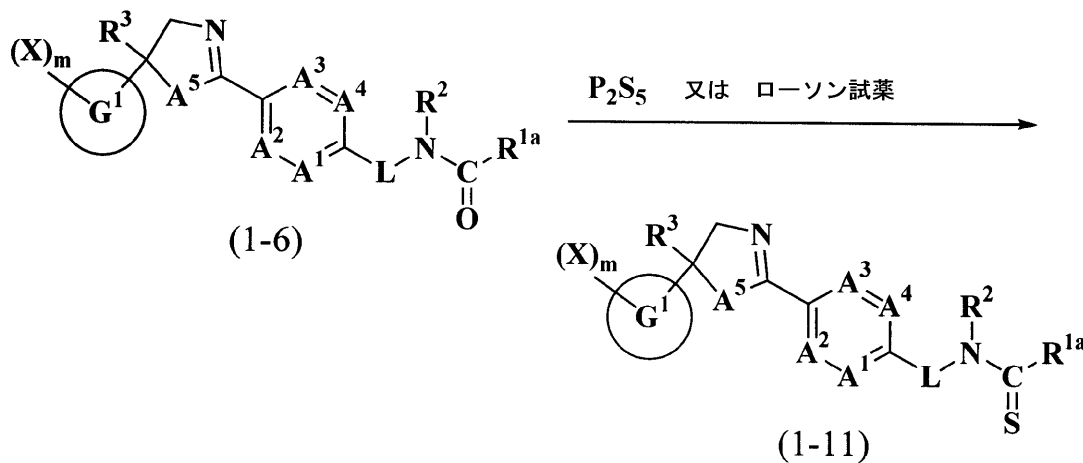
ここで用いられる一般式(16)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な合成方法、例えばケミストリー・レターズ [Chem. Lett.] 1976年、373頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J. Am. Chem. Soc.] 1964年、86巻、4383頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1976年、41巻、4028頁及び1978年、43巻、3244頁、オーガニック・シンセシス [Org. Synth.] 1988年、コレクティブボリューム6巻、101頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1972年、4339頁、英国特許公報 (GB 2,161,802号公報)、ヨーロッパ特許公報 (EP 0,051,273号公報) 等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

10

【0087】

製造法M

【化20】



20

一般式(1)においてG²がG²-1であり、R¹が-C(O)R^{1a}である一般式(1-6) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, L, X, R^{1a}, R², R³及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物1当量と1~10当量の五硫化二磷、五硫化二磷-HMD O(ヘキサメチルジシロキサン)、ローソン試薬(Lawesson's Reagent; 2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン=2,4-ジスルフィド)等の硫化剤とを、必要ならばベンゼン、トルエン、クロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、tert-ブチルメチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン又はHMPA(ヘキサメチルホスホリクトリアミド)等を溶媒として用い、必要ならば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、トリエチルアミン又はピリジン等の塩基1~4当量の存在下、室温~反応混合物の還流温度の温度範囲で10分~50時間反応させるか、或いはピリジン等の塩基を溶媒として用い、80~反応混合物の還流温度の温度範囲で1~3時間反応させることにより、一般式(1)においてG²がG²-1であり、R¹が-C(S)R^{1a}である一般式(1-11) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, L, X, R^{1a}, R², R³及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物を得ることができる。

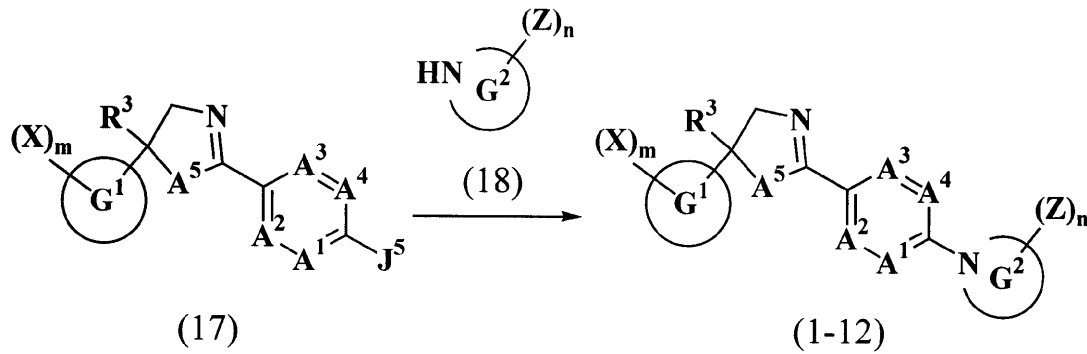
30

40

【0088】

製造法N

【化 2 1】



10

一般式(17) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³及びmは前記と同じ意味を表し、J⁵はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はC₁~C₄ハロアルキルスルホネート基(例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基)を表す。]で表される化合物1当量と1~10当量の一般式(18) [式中、G²はG²-2~G²-10のアゾリル基を表し、Z及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、例えばテトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド等を溶媒として用い、必要ならば水素化ナトリウム、カリウムターシャリーブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミン又はピリジン等の塩基1~3当量の存在下、0~90の温度範囲で10分~24時間反応させることにより、一般式(1)においてG²がG²-2~G²-10のアゾリル基である一般式(1-12) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, Z, R³, m及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明の化合物を得ることができる。

20

ここで用いられる一般式(17)で表される化合物の或るものは日本国特許出願公報(JP 2007/091708号公報)記載の公知化合物であり、また、それ以外のものも当該文献記載の方法に準じて公知化合物と同様にして合成することができる。

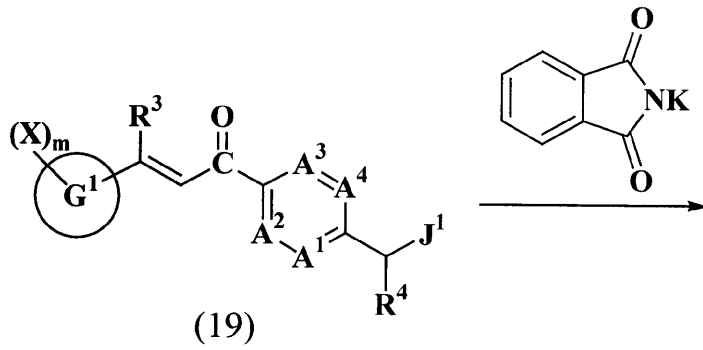
また、一般式(18)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の置換アゾール類の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

【0089】

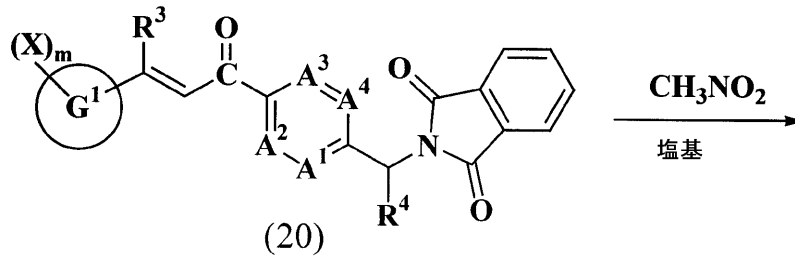
製造法0

30

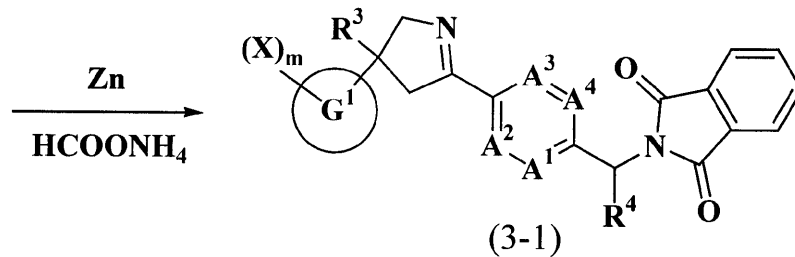
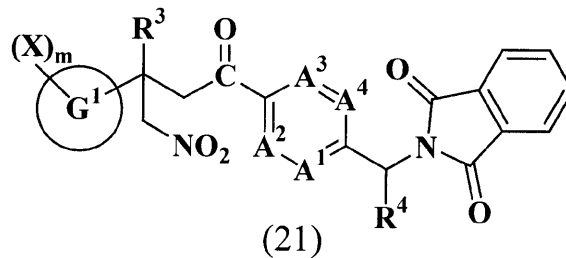
【化 2 2】



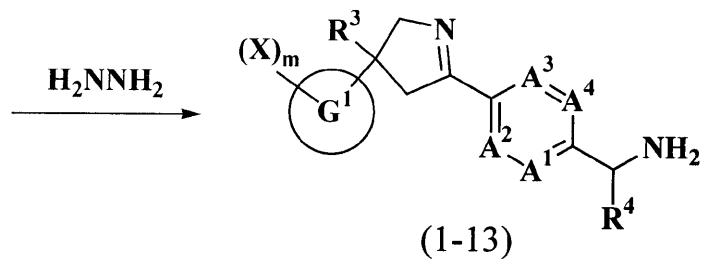
10



20



30



40

一般式(19) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , G^1 , X , R^3 , R^4 , m 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とフタルイミドカリウムとを、製造法Aと同様な条件を用いて反応させることにより得られる一般式(20) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、例えばメタノール、エタノール、アセトニトリル、*N,N*-ジメチルホルムアミド等を溶媒として用い、必要ならばナトリウムエトキシド、ジエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の塩基0.1~5当量の存在下、一般式(20)で表される化合物1当量に対して1.2~5当量のニトロメタンと室温~反応混合物の還流温度の温度範囲で12~36時間反応させることにより、一般式(21) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

50

このようにして得られた一般式(21)で表される化合物を、例えばシンセシス [Synthesis] 2006年、3301頁等に記載の方法に準じて、エタノール、テトラヒドロフラン、酢酸、N,N-ジメチルホルムアミド、水又はそれらの2種類以上の任意の割合の混合物等を溶媒として用い、塩酸、塩化アンモニウム、酢酸アンモニウム又は四塩化チタン等の存在下、亜鉛又は鉄等の金属を用いて還元することにより得られる一般式(3)において A^5 が $-CH_2-$ である一般式(3-1) [式中、 $A^1, A^2, A^3, A^4, G^1, X, R^3, R^4$ 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、製造法Aと同様な条件を用いてヒドラジン-水和物又はヒドラジン水溶液と反応させることにより、一般式(1)において A^5 が $-CH_2-$ であり、 G^2 が G^2-1 であり、 L が $-CH(R^4)-$ であり、 R^1 及び R^2 が水素原子である一般式(1-13) [式中、 $A^1, A^2, A^3, A^4, G^1, X, R^3, R^4$ 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明の化合物を得ることができる。

10

【0090】

製造法A~製造法Oにおいて、反応終了後の反応混合物は、直接濃縮、又は有機溶媒に溶解し、水洗後濃縮、又は氷水に投入、有機溶媒抽出後濃縮といった通常の後処理を行ない、目的の本発明の化合物を得ることができる。また、精製の必要が生じたときには、再結晶、カラムクロマトグラフ、薄層クロマトグラフ、液体クロマトグラフ分取等の任意の精製方法によって分離、精製することができる。

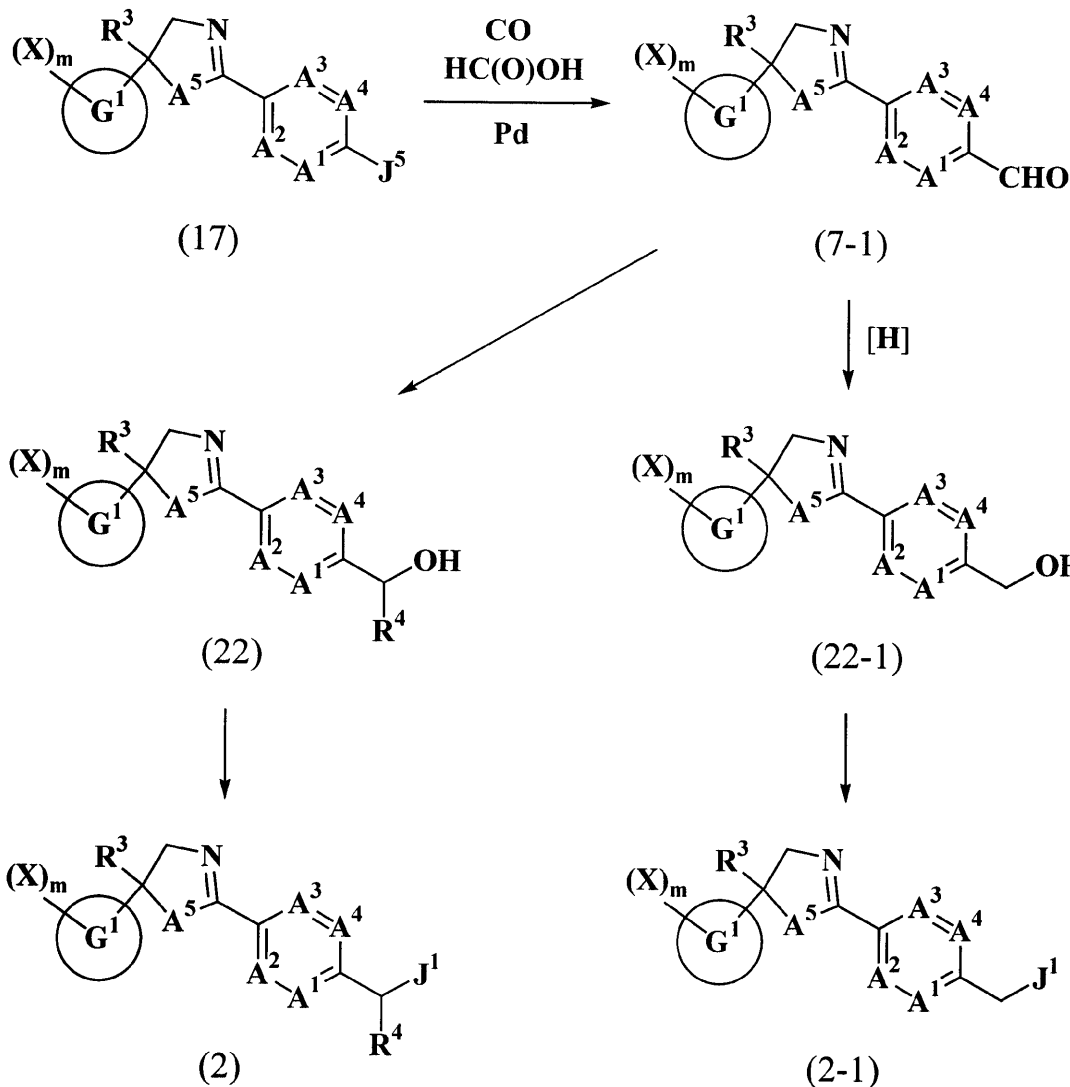
【0091】

製造法A~製造法Dで用いられる一般式(2)で表される化合物は、例えば反応式1~反応式4のようにして合成することができる。

20

反応式 1

【化 2 3】



一般式(17) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³及びmは前記と同じ意味を表し、J⁵は臭素原子、ヨウ素原子又はC₁~C₄ハロアルキルスルホネート基(例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基)等を表す。]で表される化合物を文献記載の公知の方法、例えばブレティン・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティー・オブ・ジャパン [Bull. Chem. Soc. Jpn.] 1994年、67巻、2329頁等に記載の方法に準じてギ酸等のハイドライド源共存下パラジウム等の遷移金属触媒を用いるCO挿入反応を行うことにより一般式(7)においてR^{4a}が水素原子である一般式(7-1) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を合成することができる。

このようにして得られた一般式(7-1)で表される化合物を文献記載の公知の方法、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1999年、64巻、2873頁、2000年、65巻、4618頁等に記載の方法に準じて一般式(2) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³及びmは前記と同じ意味を表し、R⁴は水素原子以外の上記と同じ意味を表す。]で表される2級アルコールとした後、例えばジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J. Am. Chem. Soc.] 1986年、108巻、6819頁等に記載の方法に準じてハロゲン化するか、或いは、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 2004年、69巻、1227頁等に記載の方法に準じてスルホニルエステル化することにより、一般式(2) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³, m及びJ¹は前記と同じ意味を表し、R⁴は水素原子以外の上記と同じ意味を表す。]で表される化合物を合成することができる。

また、一般式(7-1)で表される化合物を文献記載の公知の方法、例えばジャーナル・オ

10

20

30

40

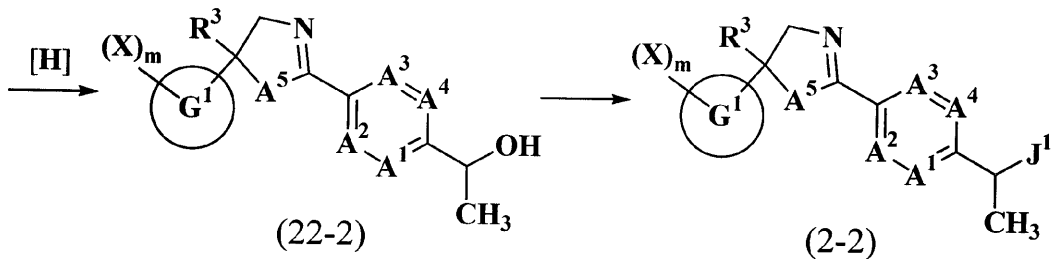
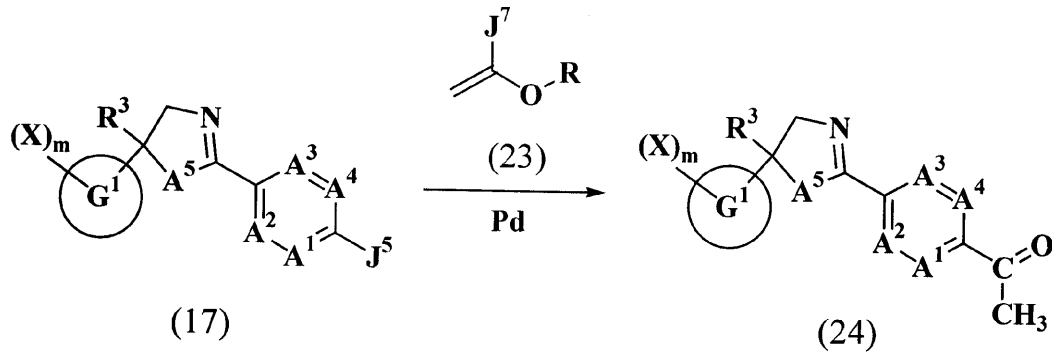
50

ブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 2007年、50巻、2424頁等に記載の方法に準じて一般式(22)においてR⁴が水素原子である一般式(22-1) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物へと還元した後ハロゲン化するか、或いは、例えばバイオオーガニック・アンド・メディシナル・ケミストリー [Bioorganic & Med. Chem.] 1999年、7巻、2647頁等に記載の方法に準じてスルホニルエステル化することにより、一般式(2)においてR⁴が水素原子である一般式(2-1) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³, m及びJ¹は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を合成することができる。

【0092】

反応式2

【化24】



一般式(17) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³及びmは前記と同じ意味を表し、J⁵は臭素原子、ヨウ素原子又はC₁~C₄ハロアルキルスルホネート基(例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基)等を表す。]で表される化合物を文献記載の公知の方法、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 2001年、66巻、4340頁等に記載の方法に準じてパラジウム等の遷移金属触媒を用い一般式(23) [式中、J⁷は水素原子又はトリ-n-ブチルスタニル基を表し、RはC₁~C₈アルキル基、2-ヒドロキシエチル基、2-ビニルオキシエチル基等を表す。]で表される公知のビニルエーテル類と反応させることにより一般式(24) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を合成することができる。

このようにして得られた一般式(24)で表される化合物を文献記載の公知の方法、例えばケミカル・アンド・ファーマシューティカル・プレティン [Chem. Pharm. Bull.] 2001年、49巻、799頁等に記載の方法に準じて一般式(22)においてR⁴がメチル基である一般式(22-2) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物へと還元した後ハロゲン化するか、或いは、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 2001年、44巻、3343頁等に記載の方法に準じてスルホニルエステル化することにより、一般式(2)においてR⁴がメチル基である一般式(2-2) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³, m及びJ¹は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を合成することができる。

【0093】

反応式3

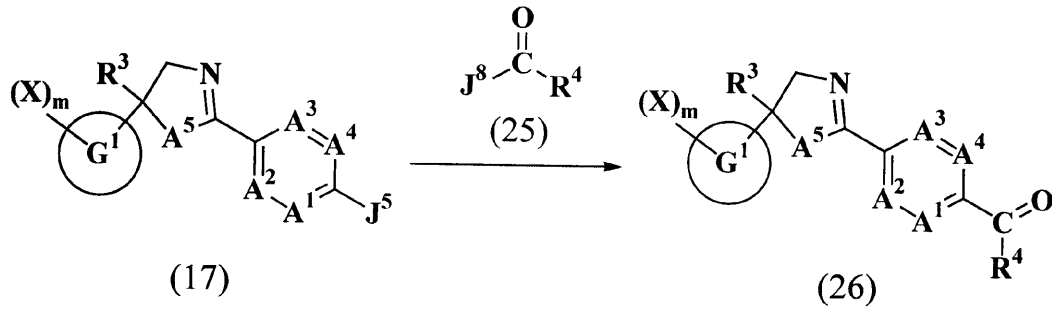
10

20

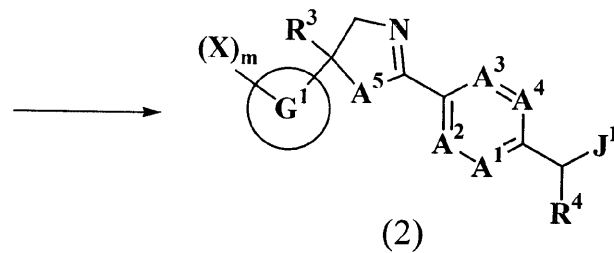
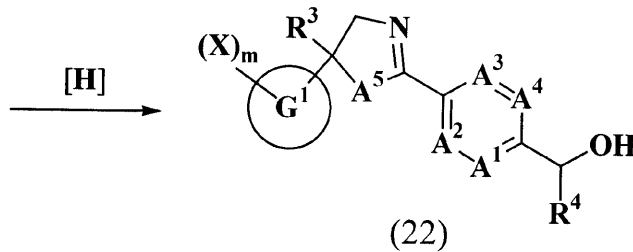
30

40

【化25】



10



20

一般式(17) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 及び m は前記と同じ意味を表し、 J^5 は臭素原子又はヨウ素原子を表す。]で表される化合物を文献記載の公知の方法、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 2004年、47巻、2405頁等に記載の方法に準じて一般式(25) [式中、 R^4 は前記と同じ意味を表し、 J^8 は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メトキシ(メチル)アミノ基等を表す。]で表される化合物と反応させることにより、一般式(26) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を合成することができる。

30

ここで用いられる一般式(25)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な公知化合物の合成方法に準じて容易に合成することができる。

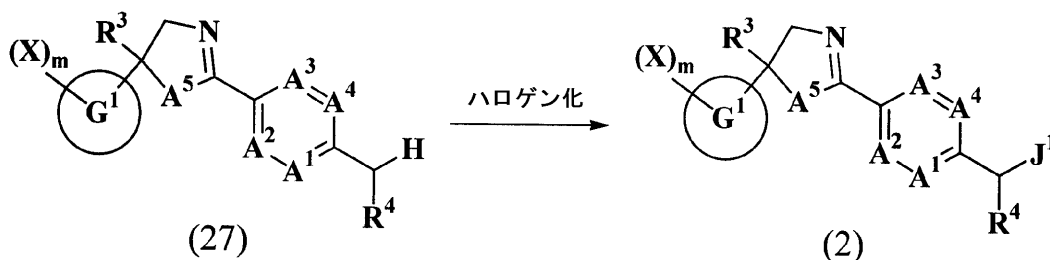
このようにして得られた一般式(26)で表される化合物を反応式2と同様に反応させることにより、一般式(2) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 , m 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を合成することができる。

【0094】

反応式4

40

【化26】



一般式(27) [式中、 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , G^1 , X , R^3 , R^4 及び m は前記と同じ意味を表す

50

。]で表される化合物を文献記載の公知の方法、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1991年、34巻、2209頁等に記載の方法に準じてN-クロロコハク酸イミド、N-プロモコハク酸イミド等を用いてハロゲン化することにより、一般式(2) [式中、A¹, A², A³, A⁴, A⁵, G¹, X, R³, R⁴及びmは前記と同じ意味を表し、J¹は塩素原子、臭素原子等を表す。]で表される化合物を合成することができる。

【0095】

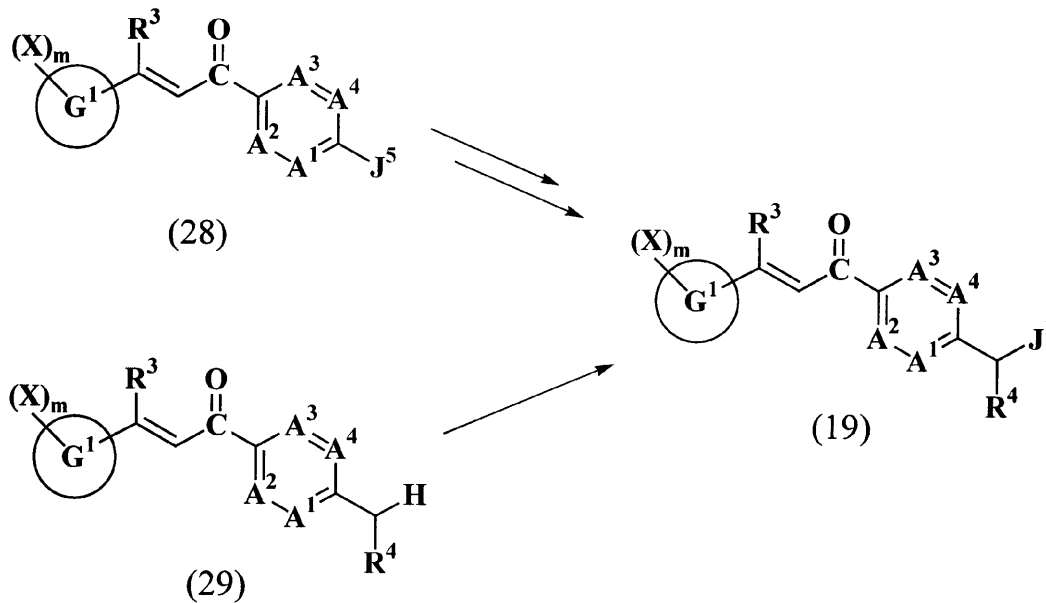
製造法Eで用いられる一般式(7)で表される化合物は、例えば反応式1の一般式(7-1)で表される化合物、反応式2の一般式(24)で表される化合物及び反応式3の一般式(26)で表される化合物と同様にして合成することができる。

10

【0096】

製造法Oで用いられる一般式(19)で表される化合物は、一般式(28) [式中、A¹, A², A³, A⁴, G¹, X, R³及びmは前記と同じ意味を表し、J⁵は臭素原子又はヨウ素原子を表す。]で表される化合物を反応式1~反応式3と同様にして反応させるか、又は一般式(29) [式中、A¹, A², A³, A⁴, G¹, X, R³, R⁴及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を反応式4と同様にして反応させることにより合成することができる。

【化27】



20

30

ここで用いられる一般式(28)で表される化合物及び一般式(29)で表される化合物の或るものは国際特許出願公報 (WO 2007/074789号公報) 記載の公知化合物であり、また、それ以外のもも当該文献記載の方法に準じて公知化合物と同様に合成することができる。

これらの各反応においては、反応終了後、通常の後処理を行なうことにより製造法A~製造法Oの原料化合物となる各々の製造中間体を得ることができる。

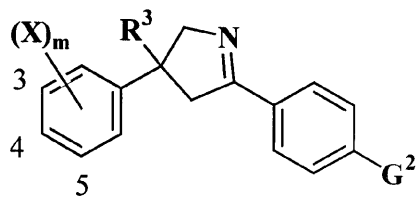
また、これらの方法により製造された各々の製造中間体は、単離・精製することなく、それぞれそのまま次工程の反応に用いることもできる。

40

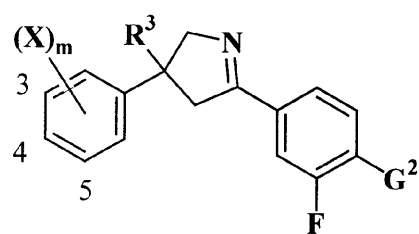
【0097】

本発明に包含される構造式[1]-1~[1]-54で表される活性化合物としては、具体的に例えば第2表及び第3表に示す化合物が挙げられる。但し、第2表及び第3表の化合物は例示のためのものであって、本発明はこれらだけに限定されるものではない。

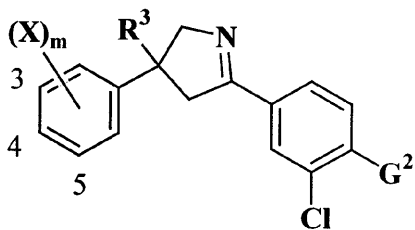
【化 2 8】



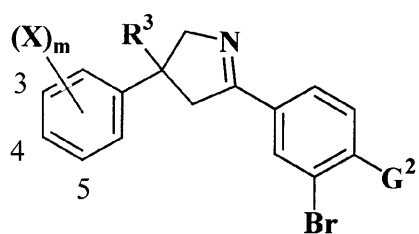
[1] - 1



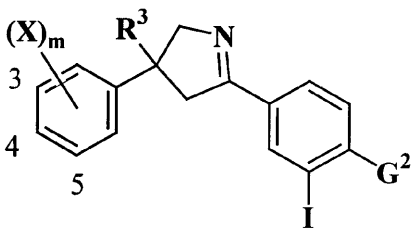
[1] - 2



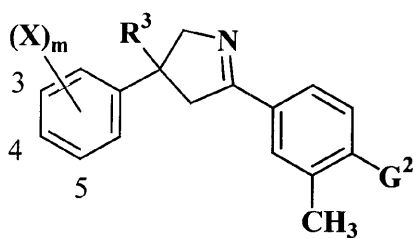
[1] - 3



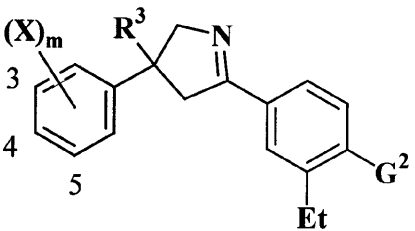
[1] - 4



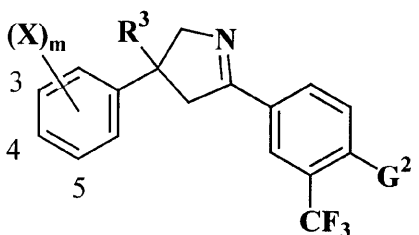
[1] - 5



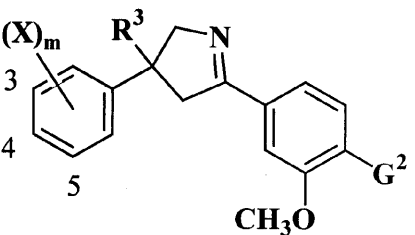
[1] - 6



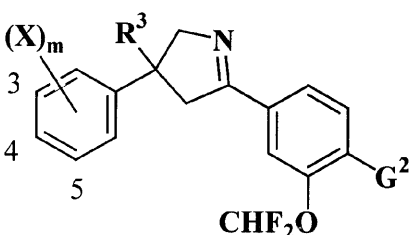
[1] - 7



[1] - 8



[1] - 9



[1] - 10

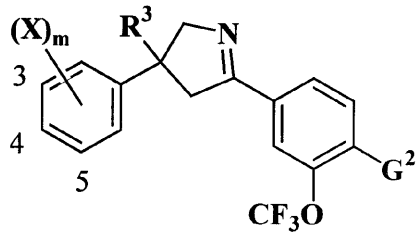
10

20

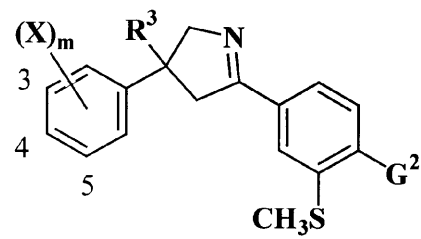
30

40

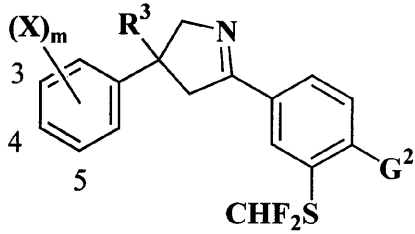
【化 2 9】



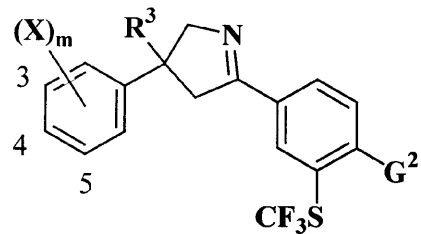
[1] - 11



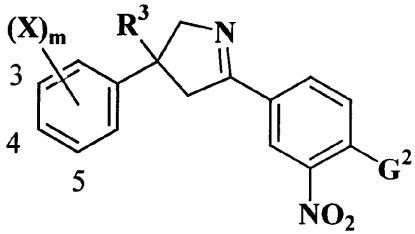
[1] - 12



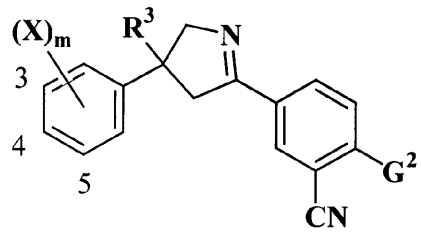
[1] - 13



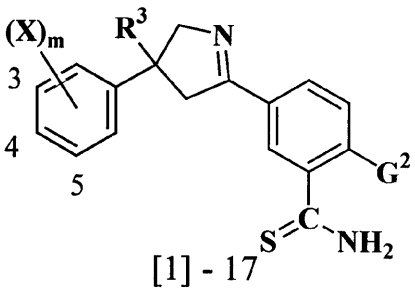
[1] - 14



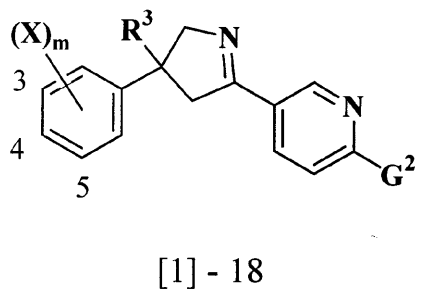
[1] - 15



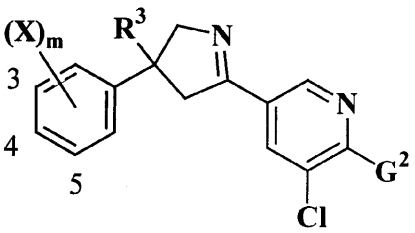
[1] - 16



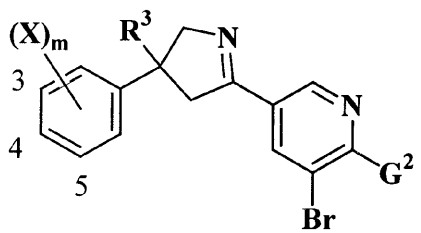
[1] - 17



[1] - 18



[1] - 19



[1] - 20

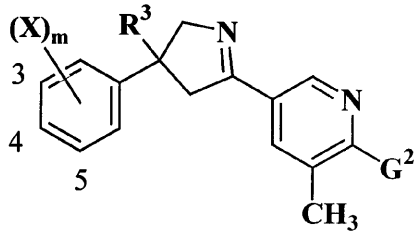
10

20

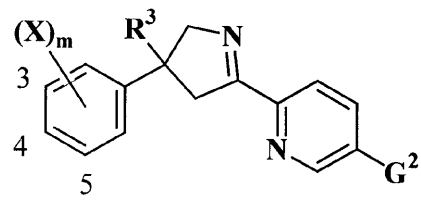
30

40

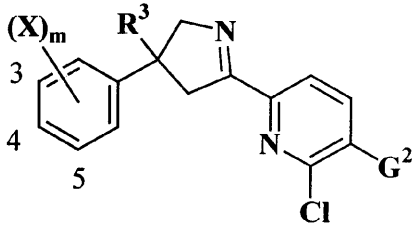
【化 3 0】



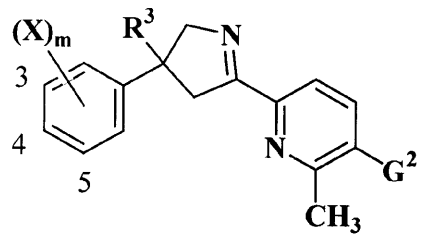
[1] - 21



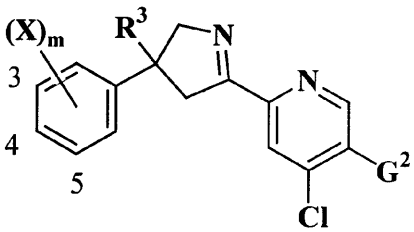
[1] - 22



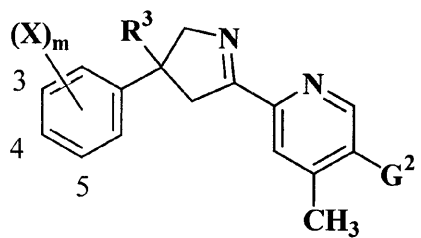
[1] - 23



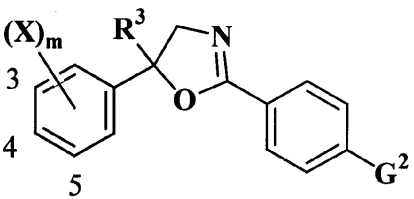
[1] - 24



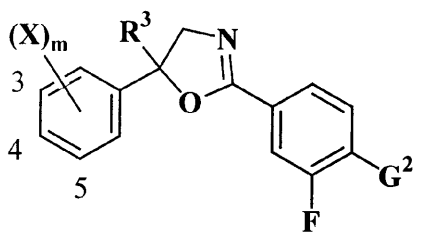
[1] - 25



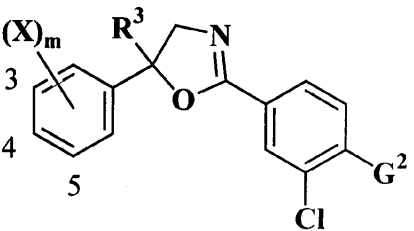
[1] - 26



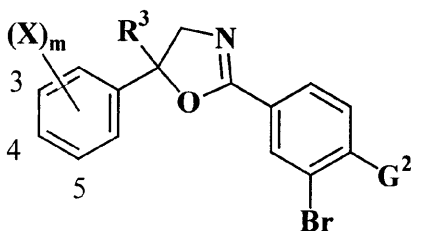
[1] - 27



[1] - 28



[1] - 29



[1] - 30

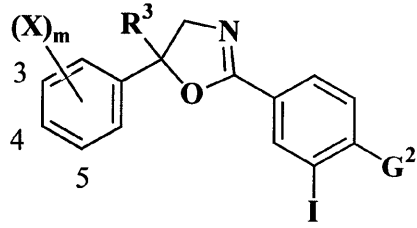
10

20

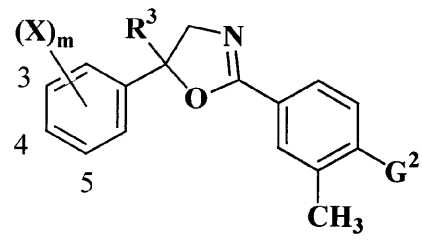
30

40

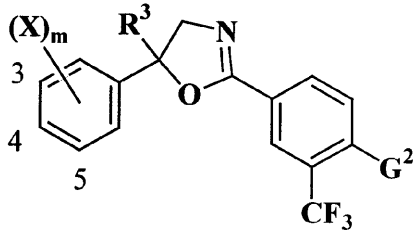
【化 3 1】



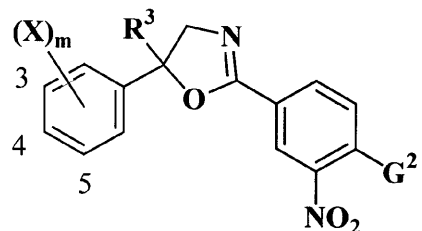
[1] - 31



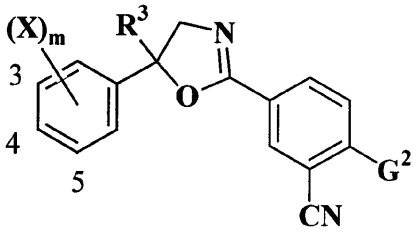
[1] - 32



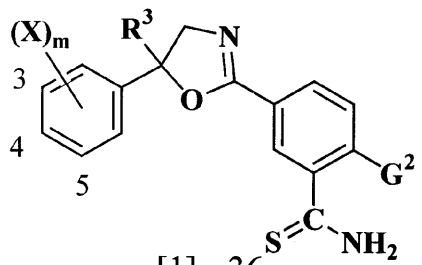
[1] - 33



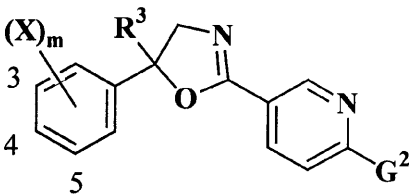
[1] - 34



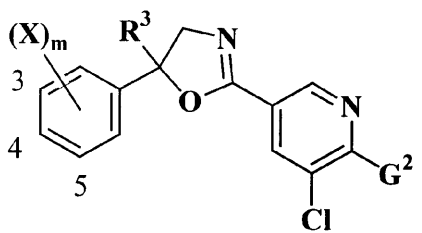
[1] - 35



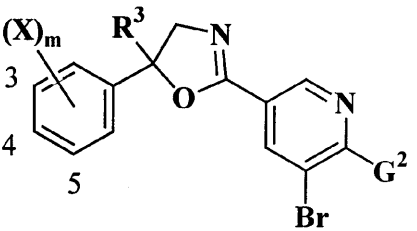
[1] - 36



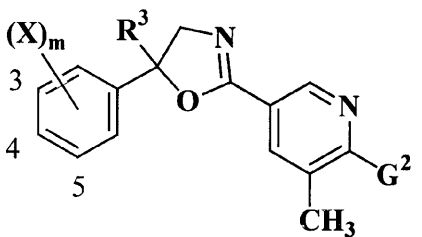
[1] - 37



[1] - 38



[1] - 39



[1] - 40

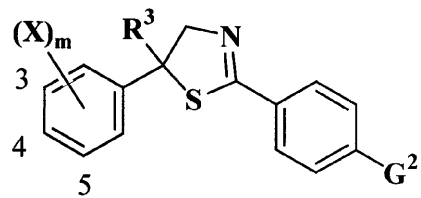
10

20

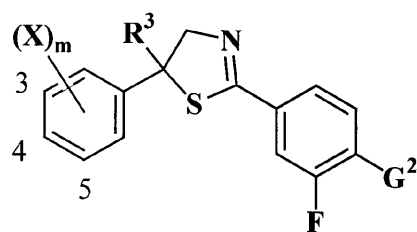
30

40

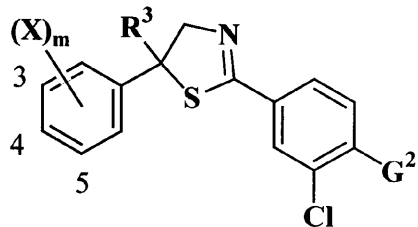
【化 3 2】



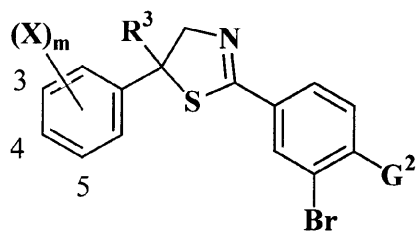
[1] - 41



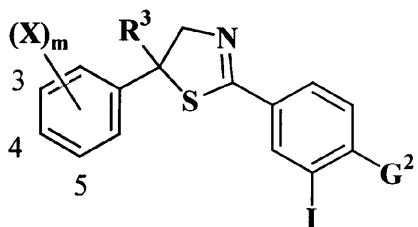
[1] - 42



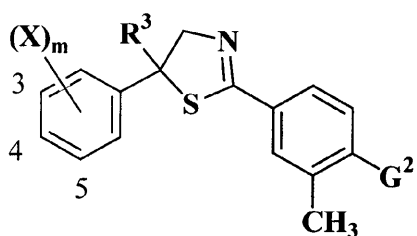
[1] - 43



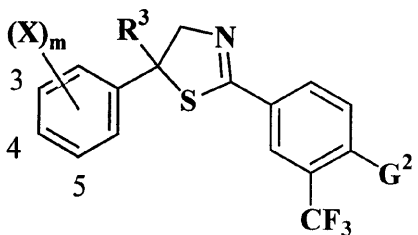
[1] - 44



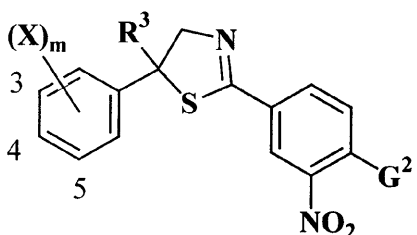
[1] - 45



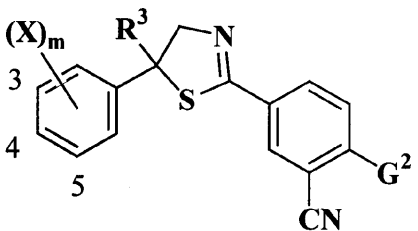
[1] - 46



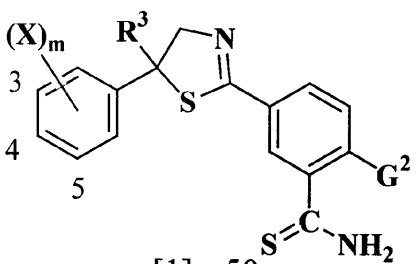
[1] - 47



[1] - 48



[1] - 49



[1] - 50

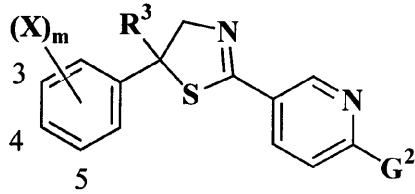
10

20

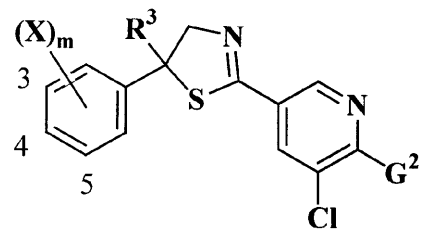
30

40

【化33】

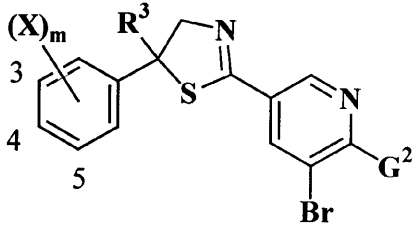


[1]-51



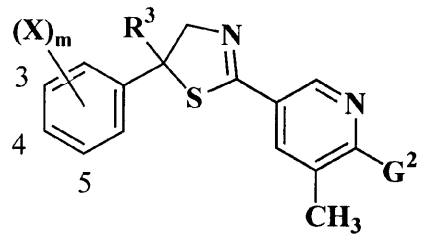
[1]-54

10



[1]-53

または



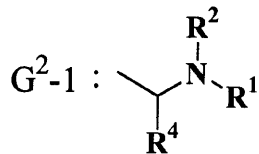
[1]-54

第2表

G^2 が G^2-1 で表される構造を有する構造式[1]-1～[1]-54で表される化合物。

20

【化34】

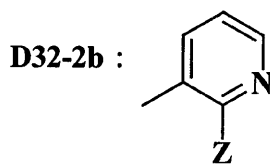


表中、置換基 $(X)_m$ の置換位置を表す番号は、それぞれ上記の構造式[1]-1～[1]-54に於いて記された番号の位置に対応するものである。

また、表中、D32-2bで表される芳香族複素環は、下記の構造を表し、

30

【化35】

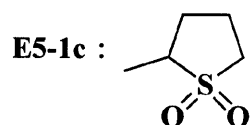
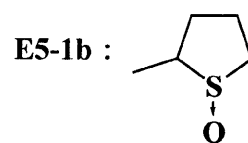
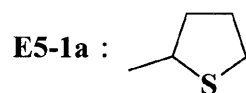
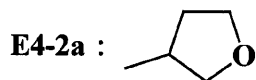


例えば、 $[C(O)(D32-2b)Cl]$ の表記は2-クロロニコチノイル基を表し、

表中、E4-2a、E5-1a、E5-1b及びE5-1cで表される脂肪族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、

40

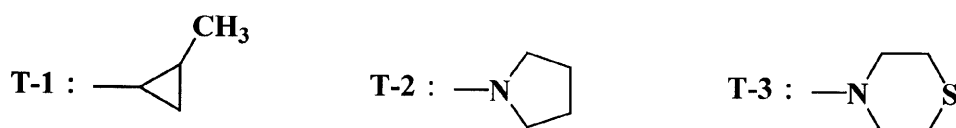
【化36】



例えば、 $[C(O)(E4-2a)]$ の表記は3-テトラヒドロフリルカルボニル基を表す。

50

さらに、表中、T-1~T-3は、それぞれ下記の構造を表し、
【化37】



表中、Etとの記載はエチル基を表し、以下同様にPr-nはノルマルプロピル基を、Pr-iはイソプロピル基を、Pr-cはシクロプロピル基を、Bu-iはイソブチル基を、Bu-cはシクロブチル基をそれぞれ表す。

【表3】

(X) _m	R ³	R ⁴	R ²	R ¹
3-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Et
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et
3-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)Et
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c
3-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃
3-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃
3-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃

10

20

30

【表 4】

3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-I	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)Et	10
3-I	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	20
3-I	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-I	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-I	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	30
3-I	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	40
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	

【表 5】

3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	10
3-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	20
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	30
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	40
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	

【表 6】

3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	10
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	20
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	30
3-CF(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-C(CF ₃) ₂ OH	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-C(CF ₃) ₂ OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	40
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	

【表 7】

3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)Et	10
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-OCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-OCF ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	20
3-OCF ₂ CHFC1	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-OCF ₂ CHFCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-OCF ₂ CHFOCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	30
3-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	40
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	

【表 8】

3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-SCF ₂ Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	10
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-SCF ₂ Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	20
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-SF ₅	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-SF ₅	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-SF ₅	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	30
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-SF ₅	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,4-F ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,5-F ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Cl-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Cl-4-F	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-Cl-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Et	40
3-Cl-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-Cl-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	

【表 9】

3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	10
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-4-F	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	20
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-F-5-C1	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	30
3-F-5-C1	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-F-5-C1	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-F-5-C1	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-F-5-C1	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-F-5-C1	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-F-5-C1	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-F-5-C1	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-F-5-C1	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-C1	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-C1	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	40
3-F-5-C1	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-F-5-C1	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-F-5-C1	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-C1	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-C1	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	

【表 1 0】

3-F-5-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-F-5-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-F-5-Cl	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-F-5-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-F-5-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-F-5-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-F-5-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-F-5-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-F-5-Cl	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	10
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	20
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-F-5-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3,4-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	30
3,4-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	40
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	

【表 1 1】

3,4-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)NHP _r -c	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	10
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,4-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-Cl ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	20
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	30
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	40
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	

【表 1 2】

3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	10
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3,5-Cl ₂	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	20
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	30
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,5-Cl ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-4-F	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	40
3-Br-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	

【表 1 3】

3-Br-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	10
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Br-4-F	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	20
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-F-5-Br	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	30
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-F-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-F-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-F-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	40
3-F-5-Br	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-F-5-Br	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	

【表 1 4】

3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-F-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	10
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-F-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	20
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	30
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Br-4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	40
3-Cl-4-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-4-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-4-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	

【表 1 5】

3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Cl-4-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Cl-5-Br	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	10
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	20
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	30
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	40
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	

【表 1 6】

3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O) (E5-1a)	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O) CH(SCH ₃) ₂	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O) CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O) CH(SET) ₂	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O) CH(SET)S(O)Et	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O) CH(SET)SO ₂ Et	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O) (D32-2b)Cl	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O) NHEt	
3-Cl-5-Br	CF ₃	H	H	C(O) NHPPr-c	10
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O) NHPPr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₃	CH ₃	H	C(O) NHCH ₂ C≡CH	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) Et	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) Pr-n	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) Pr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O) CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O) CH ₂ CF ₃	20
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O) (E4-2a)	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH ₂ SCH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH ₂ SEt	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH(SCH ₃) ₂	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	H	H	C(O) CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH ₃	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) Et	30
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) Pr-n	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) Pr-c	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH ₂ Pr-c	
3, 4-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O) CH ₂ Pr-c	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH ₂ CF ₃	
3, 4-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O) CH ₂ CF ₃	
3, 4-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O) (E4-2a)	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH ₂ SCH ₃	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH ₂ SO ₂ CH ₃	40
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH ₂ SEt	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH ₂ S(O)Et	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH(SCH ₃) ₂	
3, 4-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O) CH[S(O)CH ₃] ₂	

【表 17】

3,5-Br ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	10
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	20
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	30
3,5-Br ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	40
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	

【表 1 8】

3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3,5-Br ₂	CF ₃	H	H	C(O)NHP _r -c	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHP _r -c	
3,5-Br ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	10
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	20
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,5-Br ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	30
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-I-4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)Et	40
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	

【表 19】

3-F-5-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-F-5-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	10
3-F-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	20
3-C1-5-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	30
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-5-I	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	40
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	

【表 2 0】

3-Cl-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-I	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-I ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CH ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-4-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	10
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-4-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	20
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	30
3,5-(CH ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	40
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	

【表 2 1】

3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	10
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	20
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₃ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	30
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	40
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	

【表 2 2】

3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	10
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	20
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	30
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	40
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	

【表 2 3】

3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₃	10
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	20
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Cl-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)CH ₃	30
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	40
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)Et	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)Pr-n	

【表 2 4】

3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)Pr-n	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Pr-n	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)Pr-n	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-n	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)Pr-i	10
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Pr-i	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-i	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)Pr-i	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)Pr-i	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)Pr-c	20
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	Et	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ Pr-c	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)Pr-c	30
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	C≡CH	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)CH ₂ Pr-c	40
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	Et	C(O)CH ₂ Pr-c	

【表 2 5】

3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O) (T-1)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CH ₂ Cl	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	10
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	Et	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ CF ₃	20
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ OCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O) (E4-2a)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O) (E4-2a)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O) (E4-2a)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ SCH ₃	30
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	40
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	

【表 2 6】

3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ S(O)Et	10
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	20
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1b)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1c)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CF ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CF ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃)S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃)SO ₂ CH ₃	30
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃]SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)Et] ₂	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)Et]SO ₂ Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ C(O)NH ₂	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH=CH ₂	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH=CHCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)C(CH ₃)=CHCH ₃	40
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)C≡CCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CH ₂ C≡CH	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(Ph-2, 4, 6-F ₃)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(Ph-2, 4, 6-F ₃)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	

【表 2 7】

3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(O)NHEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)NHEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)NHPr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃	10
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(T-2)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(T-3)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	Et	C(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	20
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-i	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Bu-i	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	30
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)NHPr-c	40
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Br	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Et	

【表 2 8】

3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	10
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Br-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	20
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	30
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	40
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	Et	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	

【表 2 9】

3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ Pr-c	10
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	20
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(O)CH ₂ SEt	30
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	40
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃)S(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	

【表 3 0】

3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)NHEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPPr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPPr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)NHPPr-c	10
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	Et	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-i	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	20
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Bu-i	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	30
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)NHPPr-c	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Br	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	40
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-n	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-c	

【表 3 1】

3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SEt	10
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-I-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)CH ₃	20
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	30
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	40
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	Et	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	

【表 3 2】

3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	10
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	20
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ SEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(O)CH ₂ SEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	30
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	40
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃)S(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	

【表 3 3】

3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O) (D32-2b)Cl	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)NHEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHP _{r-c}	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHP _{r-c}	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)NHP _{r-c}	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	10
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SCH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	Et	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr _n	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr _i	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr _c	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)Pr _c	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Bu _i	20
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr _c	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr _c	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O) (E4-2a)	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	30
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)NHP _{r-c}	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Br	H	H	C(O)CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ CHF ₂	H	H	C(O)Et	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ CF ₃	H	H	C(O)Pr _n	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	40
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr _n	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr _c	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr _c	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	

【表 3 4】

3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CH ₃ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-n	10
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SEt	20
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,5-(CF ₃) ₂	CHF ₂	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	30
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	Et	C(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	40
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	Et	C(O)Pr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)Pr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)Pr-c	

【表 3 5】

3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	Et	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	10
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	20
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	30
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	40
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	

【表 3 6】

3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃)S(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	10
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)NHEt	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHEt	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)NHPr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	20
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SCH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SEt	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	Et	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-i	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Bu-i	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	30
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	40
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	

【表 3 7】

3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)NHPr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Br	H	H	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₂ CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₂ CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	10
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₃ -5-OCH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	20
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	30
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	40
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	

【表 3 8】

3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	10
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	20
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	30
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	40
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	

【表 3 9】

3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	10
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	20
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	30
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	40
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	

【表 4 0】

3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	10
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	20
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	30
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	40
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	

【表 4 1】

3-Cl-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	10
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-SCF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-S(O)CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	20
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	30
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	40
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	

【表 4 2】

3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Br-5-S(O)CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	10
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-SO ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-SCF ₂ CHFC1	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Br-5-SCF ₂ CHFC1	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	20
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	30
3-CF ₃ -5-NO ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	40
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-Cl-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)Et	

【表 4 3】

3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	10
3-Br-5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	20
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	30
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,4,5-F ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4,5-F ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4,5-F ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	40
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,4,5-F ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,5-Cl ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-n	

【表 4 4】

3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	10
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	20
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	30
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	40
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	
3,5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)NH ₂ Et	

【表 4 5】

3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	10
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	20
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 4, 5-Cl ₃	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	30
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	40
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	

【表 4 6】

3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	10
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	20
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)NH ₂ Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	30
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	40
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-n	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)Pr-c	

【表 4 7】

3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SEt	10
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CHF ₂	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)CH ₃	20
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	Et	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	30
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	Et	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ Pr-c	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C(S)NH ₂	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	40
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	Et	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CN	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	

【表 4 8】

3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	10
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CN	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	C(S)NH ₂	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	20
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	30
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	40
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃)S(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	

【表 4 9】

3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O) (D32-2b)Cl	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)NHEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)NHPr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃	10
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	H	H	C(S)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	Et	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-i	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Bu-i	20
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O) (E4-2a)	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	30
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	H	H	C(O)NHPr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Br	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	40
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	

【表 5 0】

3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	10
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	20
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	30
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	40
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	

【表 5 1】

3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	10
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 4-Cl ₂ -5-CH ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	20
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	30
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	40
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	

【表 5 2】

3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	10
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	20
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	30
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	40
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	

【表 5 3】

3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	10
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	20
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	30
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	40
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	

【表 5 4】

3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	10
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3-C1-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Et	20
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	30
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	40
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,4-C1 ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	

【表 5 5】

3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	10
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NH ₂	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	20
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	30
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3,4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CHF ₂	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	Et	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₃	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₂ CN	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₃	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Et	40
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-n	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-i	
3,5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-i	

【表 5 6】

3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)Bu-i	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	10
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃ (S)	H	C(O)(E4-2a)	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₂ C≡CH	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	20
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	CH ₃	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH(CH ₃)SCH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)(E5-1a)	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt) ₂	30
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)S(O)Et	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)CH(SEt)SO ₂ Et	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)(D32-2b)Cl	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)NHEt	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	H	H	C(O)NHPr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHPr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	CH ₃	H	C(O)NHCH ₂ C≡CH	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Et	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-n	40
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	

【表 5 7】

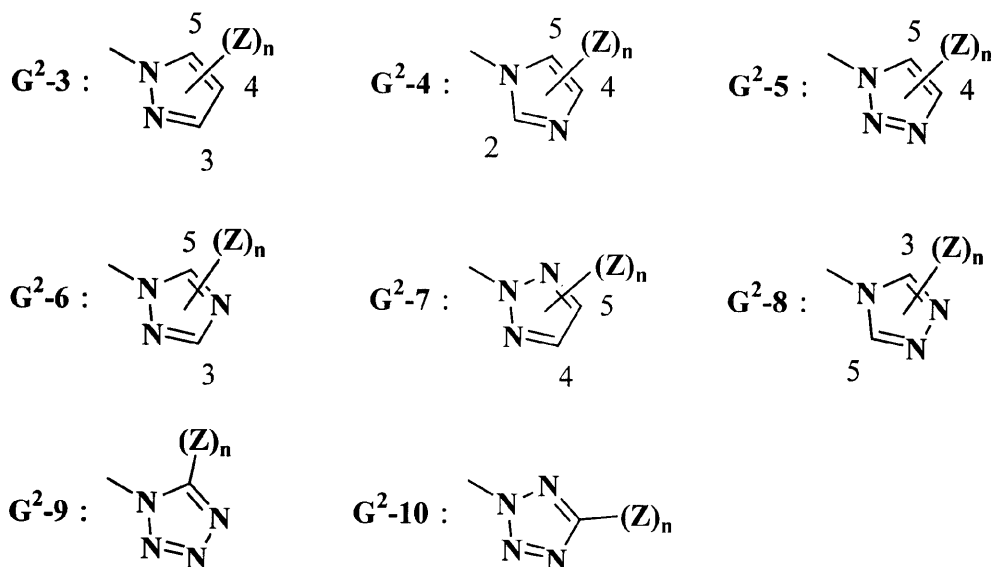
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	CH ₃	H	C(O) (E4-2a)	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	10
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O) (E4-2a)	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	20
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Et	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-n	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)Pr-c	30
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ Pr-c	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	CH ₃	H	C(O) (E4-2a)	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SCH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SEt	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ S(O)Et	40
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH(SCH ₃) ₂	
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH[S(O)CH ₃] ₂	
3, 5-Cl ₂ -4-NH ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₂ SO ₂ Et	
3, 5-Br ₂ -4-NH ₂	CF ₃	H	H	C(O)CH ₃	

【 0 0 9 8 】

第 3 表

G²がG²-3~G²-10で表される構造を有する構造式[1]-1~[1]-54で表される化合物。

【化 3 8】



10

表中、置換基 $(X)_m$ の置換位置を表す番号は、それぞれ上記の構造式 [1]-1 ~ [1]-54 に於いて記された番号の位置に対応するものであり、置換基 $(Z)_n$ の置換位置を表す番号は、上記の $G^2-3 \sim G^2-8$ に於いて記された番号の位置に対応するものであり、- の表記は無置換を表す。

20

【表 5 8】

$(X)_m$	R^3	G^2	$(Z)_n$
3-Br	CF_3	G^2-6	—
3-I	CF_3	G^2-6	—
3-I	CF_3	G^2-9	—
3- CF_3	CF_3	G^2-6	—
3- CF_3	CF_3	G^2-9	—
3- CF_2CF_3	CF_3	G^2-6	—
3- OCF_3	CF_3	G^2-6	—
3- SCF_3	CF_3	G^2-6	—
3- SF_5	CF_3	G^2-6	—
3-Cl-4-F	CF_3	G^2-6	—
3-Cl-4-F	CF_3	G^2-9	—
3-F-5-Cl	CF_3	G^2-6	—
3-F-5-Cl	CF_3	G^2-9	—
3,4- Cl_2	CF_3	G^2-6	—
3,4- Cl_2	CF_3	G^2-9	—
3,5- Cl_2	CF_3	G^2-3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃
3,5- Cl_2	CF_3	G^2-5	—
3,5- Cl_2	CF_3	G^2-6	—
3,5- Cl_2	CF_3	G^2-8	—

30

40

【表 5 9】

3, 5-Cl ₂	CF ₃	G ² -9	—	
3, 5-Cl ₂	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3, 5-Cl ₂	CF ₂ Cl	G ² -6	—	
3-Br-4-F	CF ₃	G ² -6	—	
3-Br-4-F	CF ₃	G ² -9	—	
3-F-5-Br	CF ₃	G ² -6	—	
3-F-5-Br	CF ₃	G ² -9	—	
3-Br-4-Cl	CF ₃	G ² -6	—	
3-Cl-4-Br	CF ₃	G ² -6	—	10
3-Cl-5-Br	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₃	G ² -5	—	
3-Cl-5-Br	CF ₃	G ² -6	—	
3-Cl-5-Br	CF ₃	G ² -8	—	
3-Cl-5-Br	CF ₃	G ² -9	—	
3-Cl-5-Br	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3-Cl-5-Br	CF ₂ Cl	G ² -6	—	
3, 4-Br ₂	CF ₃	G ² -6	—	
3, 5-Br ₂	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂	CF ₃	G ² -5	—	
3, 5-Br ₂	CF ₃	G ² -6	—	20
3, 5-Br ₂	CF ₃	G ² -8	—	
3, 5-Br ₂	CF ₃	G ² -9	—	
3, 5-Br ₂	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3, 5-Br ₂	CF ₂ Cl	G ² -6	—	
3-I-4-F	CF ₃	G ² -6	—	
3-F-5-I	CF ₃	G ² -6	—	
3-Cl-5-I	CF ₃	G ² -6	—	
3-Cl-5-I	CF ₃	G ² -9	—	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	G ² -6	—	
3-CF ₃ -4-F	CF ₃	G ² -9	—	30
3-F-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-F-5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	—	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	G ² -6	—	
3-CF ₃ -4-Cl	CF ₃	G ² -9	—	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	—	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-F	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-Br	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-NO ₂	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -4	—	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -5	—	40
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	3-Br	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	5-Br	
3-Cl-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	3-NH ₂	

【表 6 0】

3-C1-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	5-NH ₂	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	G ² -7	—	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	G ² -8	—	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	—	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3-C1-5-CF ₃	CF ₃	G ² -10	—	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	G ² -6	—	
3-C1-5-CF ₃	CF ₂ Cl	G ² -9	—	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	—	10
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-F	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-Br	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-NO ₂	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -4	—	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -5	—	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	3-Br	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	5-Br	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	3-NH ₂	20
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	5-NH ₂	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -7	—	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -8	—	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	—	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3-Br-5-CF ₃	CF ₃	G ² -10	—	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	G ² -6	—	
3-Br-5-CF ₃	CF ₂ Cl	G ² -9	—	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	—	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-F	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-Br	30
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-NO ₂	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -4	—	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -5	—	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	3-Br	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	5-Br	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	3-NH ₂	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	5-NH ₂	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -7	—	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -8	—	40
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	—	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3-I-5-CF ₃	CF ₃	G ² -10	—	
3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	G ² -6	—	

【表 6 1】

3-I-5-CF ₃	CF ₂ Cl	G ² -9	—	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -3	—	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -3	4-F	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -3	4-Br	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -3	4-NO ₂	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -4	—	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -5	—	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -6	—	10
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -6	3-Br	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -6	5-Br	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -6	3-NH ₂	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -6	5-NH ₂	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -7	—	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -8	—	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -9	—	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₃	G ² -10	—	
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	G ² -6	—	20
3, 5-(CF ₃) ₂	CF ₂ Cl	G ² -9	—	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	G ² -6	—	
3-C1-5-OCHF ₂	CF ₃	G ² -9	—	
3-Br-5-OCHF ₂	CF ₃	G ² -6	—	
3-CF ₃ -5-OCHF ₂	CF ₃	G ² -6	—	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-C1-5-OCF ₃	CF ₃	G ² -9	—	
3-Br-5-OCF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-CF ₃ -5-OCF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-C1-5-SCF ₃	CF ₃	G ² -9	—	30
3-Br-5-SCF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-CF ₃ -5-CN	CF ₃	G ² -6	—	
3, 4, 5-F ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	G ² -5	—	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	G ² -6	—	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	G ² -8	—	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	G ² -9	—	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3, 5-Cl ₂ -4-F	CF ₂ Cl	G ² -6	—	40
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	G ² -5	—	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	G ² -8	—	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	G ² -9	—	

【表 6 2】

3, 4, 5-Cl ₃	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3, 4, 5-Cl ₃	CF ₂ Cl	G ² -6	—	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -3	—	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -3	4-F	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -3	4-Br	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -3	4-NO ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -4	—	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -5	—	10
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -6	—	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -6	3-Br	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -6	5-Br	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -6	3-NH ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -6	5-NH ₂	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -7	—	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -8	—	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -9	—	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₃	G ² -10	—	
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	G ² -6	—	20
3, 5-Br ₂ -4-F	CF ₂ Cl	G ² -9	—	
3, 5-Br ₂ -4-Cl	CF ₃	G ² -6	—	
3, 4, 5-Br ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -5	—	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -8	—	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	—	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3, 4-F ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	G ² -6	—	30
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	G ² -5	—	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	G ² -8	—	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	—	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3-Cl-4-F-5-CF ₃	CF ₂ Cl	G ² -6	—	
3, 4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	
3, 4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -5	—	
3, 4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -6	—	
3, 4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -8	—	40
3, 4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	—	
3, 4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₃	G ² -9	CH ₃	
3, 4-Cl ₂ -5-CF ₃	CF ₂ Cl	G ² -6	—	
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	G ² -3	4-C(O)NHCH ₂ CF ₃	

【表 6 3】

3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	G ² -5	—
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	G ² -6	—
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	G ² -8	—
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	G ² -9	—
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₃	G ² -9	CH ₃
3, 5-(CF ₃) ₂ -4-Cl	CF ₂ Cl	G ² -6	—
3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	G ² -6	—
3, 5-Br ₂ -4-OCHF ₂	CF ₃	G ² -6	—

10

【 0 0 9 9 】

本発明の化合物は、農園芸作物及び樹木などを加害する所謂農業害虫、家畜・家禽類に寄生する所謂家畜害虫、家屋等の人間の生活環境で様々な悪影響を与える所謂衛生害虫、倉庫に貯蔵された穀物等を加害する所謂貯穀害虫等としての昆虫類、及び同様の場面で発生、加害するダニ類、甲殻類、軟体動物、線虫類の何れの有害生物も低濃度で有効に防除できる。

【 0 1 0 0 】

本発明の化合物を用いて防除しうる昆虫類、ダニ類、甲殻類、軟体動物及び線虫類には具体的に、例えば、

チャノコカクモンハマキ(*Adoxophyes honmai*)、リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana faciata*)、リンゴモンハマキ(*Archips breviplicanus*)、ミダレカクモンハマキ(*Archips fuscocupreanus*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、チャハマキ(*Homona magnanima*)、マメシンクイガ(*Leguminivora glycinivorella*)、マメヒメサヤムシガ(*Matsumuraeses phaseoli*)、トビハマキ(*Pandemis heparana*)、ナシチビガ(*Bucculatrix pyrivorella*)、モモハモグリガ(*Lyonetia clerkella*)、ギンモンハモグリガ(*Lyonetia prunifoliella malinella*)、チャノホソガ(*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoniella*)、ミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)、ネギコガ(*Acrolepiopsis sapporensis*)、ヤマノイモコガ(*Acrolepiopsis suzukiella*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、カキノヘタムシガ(*Stathmopoda masinissa*)、イモキバガ(*Helcystogramma triannulella*)、ワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella*)、モモシンクイガ(*Carposina sasakii*)、コドリノガ(*Cydla pomonella*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、モモノゴマダラノメイガ(*Conogethes punctiferalis*)、ワタヘリクロノメイガ(*Diaphania indica*)、シロイチモジマダラメイガ(*Etiella zinckenella*)、クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、ハイマダラノメイガ(*Hellula undalis*)、アワノメイガ(*Ostrinia furnacalis*)、アズキノメイガ(*Ostrinia scapulalis*)、ヨーロピアンコーンボラー(*Ostrinia nubilalis*)、シバツトガ(*Parapediasia teterrella*)、イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、オオモンシロチョウ(*Pieris brassicae*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)、ヨモギエダシャク(*Ascotis selenaria*)、ソイビーンルーパー(*Pseudoplusia includens*)、チャドクガ(*Euproctis pseudoconsersa*)、マイマイガ(*Lymntria dispar*)、ヒメシロモンドクガ(*Orgyia thyellina*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、クワゴマダラヒトリ(*Lemyra imparilis*)、アケビコノハ(*Adris tyrannus*)、ナカジロシタバ(*Aedia leucomelas*)、タマナヤガ(*Agrotis ipsilon*)、カブラヤガ(*Agrotis segetum*)、タマナギンウワバ(*Autographa nigrisigna*)、ミツモンキンウワバ(*Ctenoplosia agnata*)、オオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)、タバコガ(*Helicoverpa assulta*)、コットンボールワーム(*Helicoverpa zea*)、タバコバッドワーム(*Heliothis virescens*)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、アワヨトウ(*Mythimna separata*)、フタオビコヤガ(*Naranga aenescens*)、サザンアーミーワーム(*Spodoptera eridania*)、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera exigua*)、フォールアーミーワーム(*Spodoptera frugiperda*)、コットンリーフワーム(*Spodoptera littoralis*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、スジキリヨトウ(*Spodoptera depravata*)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、グレープベリーモス(

20

30

40

50

Endopiza viteana)、トマトホーンワーム(Manduca quinquemaculata)、タバコホーンワーム(Manduca sexta)等の鱗翅目昆虫、

ヒラズハナアザミウマ(Frankliniella intonsa)、ミカンキイロアザミウマ(Frankliniella occidentalis)、クロトンアザミウマ(Heliothrips haemorrhoidalis)、チャノキイロアザミウマ(Scirtothrips dorsalis)、ミナミキイロアザミウマ(Thrips palmi)、ネギアザミウマ(Thrips tabaci)、カキクダアザミウマ(Ponticulothrips diospyrosi)等の総翅目昆虫、

ブチヒゲカメムシ(Dolycoris baccarum)、ナガメ(Eurydema rugosum)、トゲシラホシカメムシ(Eysarcoris aeneus)、オオトゲシラホシカメムシ(Eysarcoris lewisi)、シラホシカメムシ(Eysarcoris ventralis)、ツヤアオカメムシ(Glaucias subpunctatus)、クサギカメムシ(Halyomorpha halys)、アオクサカメムシ(Nezara antennata)、ミナミアオカメムシ(Nezara viridula)、イチモンジカメムシ(Piezodorus hybneri)、チャバネアオカメムシ(Plautia crossota)、イネクロカメムシ(Scotinophora lurida)、ホソハリカメムシ(Cletus punctiger)、クモヘリカメムシ(Leptocorisa chinensis)、ホソハリカメムシ(Rip tortus clavatus)、アカヒメヘリカメムシ(Rhopalus msculatus)、カンシャコバナナガカメムシ(Cavelerius saccharivorus)、コバナヒョウタンナガカメムシ(Togo hemipterus)、アカホシカメムシ(Dysdercus cingulatus)、ツツジゲンバイ(Stephanitis pyrioides)、クロトビカスミカメ(Halticus insularis)、ターニッシュドプラントバグ(Lygus lineolaris)、ナガムギカスミカメ(Stenodema sibiricum)、アカスジカスミカメ(Stenotus rubrovittatus)、イネホソミドリカスミカメ(Trigonotylus caelestialium)、フタテンヒメヨコバイ(Arboridia apicalis)、ミドリナガヨコバイ(Balclutha saltuella)、フタテンオオヨコバイ(Epiacanthus stramineus)、ポテトリーフホッパー(Empoasca fabae)、カキノヒメヨコバイ(Empoasca nipponica)、チャノミドリヒメヨコバイ(Empoasca onukii)、マメノミドリヒメヨコバイ(Empoasca sakaii)、ヒメフタテンヨコバイ(Macrosteles strifrons)、ツマグロヨコバイ(Nephotettix cincticeps)、コットンフリーホッパー(Pseudatomoscelis seriatus)、ヒメトビウンカ(Laodelphax striatella)、トビイロウンカ(Nilaparvata lugens)、セジロウンカ(Sogatella furcifera)、ミカンキジラミ(Diaphorina citri)、ナシキジラミ(Psylla pyrisuga)、ミカントゲコナジラミ(Aleurocanthus spiniferus)、シルバーリーフコナジラミ(Bemisia argentifolii)、タバココナジラミ(Bemisia tabaci)、ミカンコナジラミ(Dialeurodes citri)、オンシツコナジラミ(Trialeurodes vaporariorum)、ブドウネアブラムシ(Viteus vitifolii)、ワタアブラムシ(Aphis gossypii)、ユキヤナギアブラムシ(Aphis spiraeicola)、モモアカアブラムシ(Myzus persicae)、コミカンアブラムシ(Toxoptera aurantii)、オオワラジカイガラムシ(Drosicha corpulenta)、イセリアカイガラムシ(Icerya purchasi)、ナスコナカイガラムシ(Phenacoccus solani)、ミカンコナカイガラムシ(Planococcus citri)、フジコナカイガラムシ(Planococcus kuraunhiaie)、クワコナカイガラムシ(Pseudococcus comstocki)、ツノロウムシ(Ceroplastes ceriferus)、ルビーロウムシ(Ceroplastes rubens)、アカマルカイガラムシ(Aonidiella aurantii)、ナシマルカイガラムシ(Comstockaspis perniciososa)、ティースケール(Fiorinia theae)、チャノマルカイガラムシ(Pseudaonidia paeoniae)、クワシロカイガラムシ(Pseudaulacaspis pentagona)、ウメシロカイガラムシ(Pseudaulacaspis prunicola)、マサキナガカイガラムシ(Unaspis euonymi)、ヤノネカイガラムシ(Unaspis yanonensis)、トコジラミ(Cimex lectularius)等の半翅目昆虫、

ドウガネブイブイ(Anomala cuprea)、ヒメコガネ(Anomala rufocuprea)、コアオハナムグリ(Gametis jucunda)、ナガチャコガネ(Heptophylla picea)、マメコガネ(Popillia japonica)、コロラドポテトビートル(Lepinotarsa decemlineata)、マルクビクシコメツキ(Melanotus fortnumi)、カンシャクシコメツキ(Melanotus tamsuyensis)、タバコシバンムシ(Lasioderma serricornis)、ヒメヒラタケシキスイ(Epuraea domina)、インゲンテントウ(Epilachna varivestis)、ニジュウヤホシテントウ(Epilachna vigintioctopunctata)、チャイロコメノゴミムシダマシ(Tenebrio molitor)、コクヌストモドキ(Tribolium castaneum)、ゴマダラカミキリ(Anoplophora malasiaca)、マツノマダラカミキリ(Monochamus

10

20

30

40

50

s alternatus)、キボシカミキリ(*Psacotheta hilaris*)、ブドウトラカミキリ(*Xylotrechus pyrrhoderus*)、アズキゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、テンサイトビハムシ(*Chaetocnema concinna*)、サザンコーンルートワーム(*Diabrotica undecimpunctata*)、ウエスタンコーンルートワーム(*Diabrotica virgifera*)、ノーザンコーンルートワーム(*Diabrotica barberi*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、ナスナガスネットビハムシ(*Psylliodes angusticollis*)、モモチョッキリゾウムシ(*Rhynchites heros*)、アリモドキゾウムシ(*Cylas formicarius*)、ワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*)、イネゾウムシ(*Echinocnemus squameus*)、イモゾウムシ(*Euscepes postfasciatus*)、アルファルファタコゾウムシ(*Hypera postica*)、イネミズゾウムシ(*Lissohoptrus oryzophilus*)、キンケクチフトゾウムシ(*Otiorhynchus sulcatus*)、グラナリーウィービル(*Sitophilus granarius*)、コクゾウムシ(*Sitophilus zeamais*)、シバオサゾウムシ(*Sphenophorus venatus vestitus*)、アオバアリガタハネカクシ(*Paederus fuscipes*)等の鞘翅目昆虫、

10

ダイズサヤタマバエ(*Asphondylia yushimai*)、ムギアカタマバエ(*Sitodiplosis mosellana*)、ウリミバエ(*Bactrocera cucurbitae*)、ミカンコミバエ(*Bactrocera dorsalis*)、チチュウカイミバエ(*Ceratitis capitata*)、イネヒメハモグリバエ(*Hydrellia griseola*)、オウトウショウジョウバエ(*Drosophila suzukii*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、ナモグリバエ(*Chromatomyia horticola*)、ナスハモグリバエ(*Liriomyza bryoniae*)、ネギハモグリバエ(*Liriomyza chinensis*)、トマトハモグリバエ(*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)、タネバエ(*Delia platura*)、テンサイモグリハナバエ(*Pegomya cunicularia*)、アップルマゴット(*Rhagoletis pomonella*)、ヘシアンフライ(*Mayetiola destructor*)、イエバエ(*Musca domestica*)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans*)、ヒツジシラミバエ(*Melophagus ovinus*)、ウシバエ(*Hypoderma bovis*)、キスジウシバエ(*Hypoderma lineatum*)、ヒツジバエ(*Oestrus ovis*)、ツエツエバエ(*Glossina palpalis*, *Glossina morsitans*)、キアシオオブユ(*Prosimulium yezoensis*)、ウシアブ(*Tabanus trigonus*)、オオチョウバエ(*Telmatoscopus albipunctatus*)、トクナガヌカカ(*Leptoconops nipponensis*)、アカイエカ(*Culex pipiens pallens*)、ネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、シナハマダラカ(*Anopheles hyaracanus sinesis*)等の双翅目昆虫、

20

クリハバチ(*Apethymus kuri*)、カブラハバチ(*Athalia rosae*)、チュウレンジハバチ(*Arge pagana*)、マツノキハバチ(*Neodiprion sertifer*)、クリタマバチ(*Dryocosmus kuriphilus*)、グンタイアリ(*Eciton burchelli*, *Eciton schmitti*)、クロオオアリ(*Camponotus japonicus*)、オオスズメバチ(*Vespa mandarina*)、ブルドックアント(*Myrmecia* spp.)、ファイヤーアント類(*Solenopsis* spp.)、ファラオアント(*Monomorium pharaonis*)等の膜翅目昆虫、

30

エンマコオロギ(*Teleogryllus emma*)、ケラ(*Gryllotalpa orientalis*)、トノサマバッタ(*Locusta migratoria*)、コバネイナゴ(*Oxya yezoensis*)、サバクワタリバッタ(*Schistocerca gregaria*)等の直翅目昆虫、

トゲナシシロトビムシ(*Onychiurus folsomi*)、シベリアシロトビムシ(*Onychiurus sibiricus*)、キボシマルトビムシ(*Bourletiella hortensis*)等の粘管目昆虫、

40

クロゴキブリ(*Periplaneta fuliginosa*)、ヤマトゴキブリ(*Periplaneta japonica*)、チャパネゴキブリ(*Blattella germanica*)等の網翅目昆虫、

イエシロアリ(*Coptotermes formosanus*)、ヤマトシロアリ(*Reticulitermes speratus*)、タイワンシロアリ(*Odontotermes formosanus*)等のシロアリ目昆虫、

ネコノミ(*Ctenocephalidae felis*)、イヌノミ(*Ctenocephalides canis*)、ニワトリノミ(*Echidnophaga gallinacea*)、ヒトノミ(*Pulex irritans*)、ケオプスネズミノミ(*Xenopsylla cheopis*)等の等翅目昆虫、

ニワトリオオハジラミ(*Menacanthus stramineus*)、ウシハジラミ(*Bovicola bovis*)等のハジラミ目昆虫、

ウシジラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ(*Haematopinus suis*)、ウシホソ

50

ジラミ(*Linognathus vituli*)、ケブカウシジラミ(*Solenopotes capillatus*)等のシラミ目昆虫、

シクラメンホコリダニ(*Phytonemus pallidus*)、チャノホコリダニ(*Polyphagotarsonemus latus*)、スジプトホコリダニ(*Tarsonemus bilobatus*)等のホコリダニ類、

ハクサイダニ(*Penthaleus erythrocephalus*)、ムギダニ(*Penthaleus major*)等のハシリダニ類、

イネハダニ(*Oligonychus shinkajii*)、ミカンハダニ(*Panonychus citri*)、クワオオハダニ(*Panonychus mori*)、リンゴハダニ(*Panonychus ulmi*)、カンザワハダニ(*Tetranychus kanzawai*)、ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)等のハダニ類、

チャノナガサビダニ(*Acaphylla theavagrans*)、チューリップサビダニ(*Aceria tulipae*)、トマトサビダニ(*Aculops lycopersici*)、ミカンサビダニ(*Aculops pelekassi*)、リンゴサビダニ(*Aculus schlechtendali*)、ニセナシサビダニ(*Eriophyes chibaensis*)、シトラスラストマイト(*Phyllocoptruta oleivora*)等のフシダニ類、

ロビンダニ(*Rhizoglyphus robini*)、ケナガコナダニ(*Tyrophagus putrescentiae*)、ハウレンソウケナガコナダニ(*Tyrophagus similis*)等のコナダニ類、

ミツパチヘギイタダニ(*Varroa jacobsoni*)等のハチダニ類、

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*)、ヤマトマダニ(*Ixodes ovatus*)、シユルツェマダニ(*Ixodes persulcatus*)、オオマダニ(*Amblyomma* spp.)、アミメマダニ(*Demacator* spp.)等のマダニ類、

イヌツメダニ(*Cheyletiella yasguri*)、ネコツメダニ(*Cheyletiella blakei*)等のツメダニ類、

イヌニキビダニ(*Demodex canis*)、ネコニキビダニ(*Demodex cati*)などのニキビダニ類、

ヒツジキュウセンダニ(*Psoroptes ovis*)等のキュウセンダニ類、

センコウヒゼンダニ(*Sarcoptes scabiei*)、ネコショウセンコウヒゼンダニ(*Notoedres cati*)、ニワトリヒゼンダニ(*Knemidocoptes* spp.)等のヒゼンダニ類、

オカダンゴムシ(*Armadillidium vulgare*)等の甲殻類、

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(*Limax Valentiana*)、ウスカワマイマイ(*Acusta despecta sieboldiana*)、ミスジマイマイ(*Euhadra peliomphala*)等の腹足類、

ミナミネグサレセンチュウ(*Prathylenchus coffeae*)、キタネグサレセンチュウ(*Prathylenchus penetrans*)、クルミネグサレセンチュウ(*Prathylenchus vulnus*)、ジャガイモシストセンチュウ(*Globodera rostochiensis*)、ダイズシストセンチュウ(*Heterodera glycines*)、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*)、イネシンガレセンチュウ(*Aphelenchoides besseyi*)、マツノザイセンチュウ(*Bursaphelenchus xylophilus*)等の線虫類、

等が挙げられるが、本発明はこれらにのみ限定されるものではない。

【0101】

また、本発明の化合物を用いて防除しうる家畜、家禽、愛玩動物等の内部寄生虫としては具体的に、例えば、

ヘモンクス属(*Haemonchus*)、トリコストロンギルス属(*Trichostrongylus*)、オステルターギヤ属(*Ostertagia*)、ネマトディルス属(*Nematodirus*)、クーペリア属(*Cooperia*)、アスカリス属(*Ascaris*)、ブノストムーム属(*Bunostomum*)、エスファゴストムーム属(*Oesophagostomum*)、チャベルチア属(*Chabertia*)、トリキュリス属(*Trichuris*)、ストロンギルス属(*Storonylus*)、トリコネマ属(*Trichonema*)、ディクチオカウルス属(*Dictyocaulus*)、キャピラリア属(*Capillaria*)、ヘテラキス属(*Heterakis*)、トキソカラ属(*Toxocara*)、アスカリディア属(*Ascaridia*)、オキシウリス属(*Oxyuris*)、アンキロストーマ属(*Ancylostoma*)

ma)、ウンシナリア属(Uncinaria)、トキサスカリス属(Toxascaris)、パラスカリス属(Parascaris)などの線虫類、

ブツレリア属(Wuchereria)、ブルーシア属(Brugia)、オンコセルカ属(Onchoceca)、ディロフィラリア属(Dirofilaria)、ロア系状虫属(Loa)などのフィラリア科(Filariidae)線虫類、

ドラクンクルス属(Deacunculus)などの蛇状線虫科(Dracunculidae)線虫類、

犬条虫(Dipylidium caninum)、猫条虫(Taenia taeniaeformis)、有鉤条虫(Taenia solium)、無鉤条虫(Taenia saginata)、縮小条虫(Hymenolepis diminuta)、ベネデン条虫(Moniezia benedeni)、広節裂頭条虫(Diphyllobothrium latum)、マンソン裂頭条虫(Diphyllobothrium erinacei)、単包条虫(Echinococcus granulosus)、多包条虫(Echinococcus multilocularis)などの条虫類、

肝蛭(Fasciola hepatica, F. gigantica)、ウエステルマン肺吸虫(Paragonimus westermanii)、肥大吸虫(Fasciolopsis bruskii)、臍吸虫(Eurytrema pancreaticum, E. coelomaticum)、肝吸虫(Clonorchis sinensis)、日本住血吸虫(Schistosoma japonicum)、ビルハルツ住血吸虫(Schistosoma haematobium)、マンソン住血吸虫(Schistosoma mansoni)などの吸虫類、

エイメリア・テネラ(Eimeria tenella)、エイメリア・アセルブリナ(Eimeria acervulina)、エイメリア・ブルネッチ(Eimeria brunetti)、エイメリア・マクシマ(Eimeria maxima)、エイメリア・ネカトリクス(Eimeria necatrix)、エイメリア・ボビス(Eimeria bovis)、エイメリア・オビノイダリス(Eimeria ovinoidalis)のようなエイメリア類(Eimeria spp.)、

クルーズトリパノソーマ(Trypanosoma cruzi)、リーシュマニア類(Leishmania spp.)、マラリア原虫(Plasmodium spp.)、パベシア類(Babesia spp.)、トリコモナス類(Trichomonadidae spp.)、ヒストモナス類(Histomonas spp.)、ジアルディア類(Giardia spp.)、トキソプラズマ類(Toxoplasma spp.)、赤痢アメーバ(Entamoeba histolytica)、タイレリア類(Theileria spp.)、

等が挙げられるが、本発明はこれらのみ限定されるものではない。

【0102】

さらに、本発明の化合物は、有機燐系化合物、カーバメート系化合物又はピレスロイド系化合物等の既存の殺虫剤に対して抵抗性の発達した有害生物に対しても有効である。

すなわち、本発明の化合物は、粘管目(トビムシ目)、網翅目(ゴキブリ目)、直翅目(バッタ目)、シロアリ目、総翅目(アザミウマ目)、半翅目(カメムシ目及びヨコバイ目)、鱗翅目(チョウ目)、鞘翅目(コウチュウ目)、膜翅目(ハチ目)、双翅目(ハエ目)、等翅目(ノミ目)及びシラミ目等の昆虫類、ダニ類、腹足類及び線虫類等に属する有害生物を低濃度で有効に防除することが出来る。一方、本発明の化合物はホ乳類、魚類、甲殻類及び益虫(ミツバチ、マルハナバチ等の有用昆虫やツヤコバチ、アブラバチ、ヤドリバエ、ヒメハナカメムシ、カブリダニ等の天敵)に対してほとんど悪影響の無い極めて有用な特長を有している。

【0103】

本発明の化合物を使用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤、消泡剤、防腐剤および分解防止剤等を添加して、液剤(soluble concentrate)、乳剤(emulsifiable concentrate)、水和剤(wettable powder)、水溶剤(water soluble powder)、顆粒水和剤(water dispersible granule)、顆粒水溶剤(water soluble granule)、懸濁剤(suspension concentrate)、乳濁剤(concentrated emulsion)、サスポエマルジョン(suspoemulsion)、マイクロエマルジョン(microemulsion)、粉剤(dustable powder)、粒剤(granule)錠剤(tablet)および乳化性ゲル剤(emulsifiable gel)等の任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を、水溶性カプセルおよび水溶性フィルムの袋等の水溶性包装体に封入して供することもできる。

【0104】

固体担体としては、例えば石英、方解石、海泡石、ドロマイト、チョーク、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、ハロサイト、メタハロサイト、木節粘土、蛙目粘土、陶石、ジークライト、アロフェン、シラス、きら、タルク、ベントナイト、活性白土、酸性白土、軽石、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質、例えば焼成クレイ、パーライト、シラスパルーン、パーミキュライト、アタパルガスクレーおよび焼成珪藻土等の天然鉱物質の焼成品、例えば炭酸マグネシウム、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、硫酸マグネシウム、リン酸水素二アンモニウム、リン酸二水素アンモニウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、例えばブドウ糖、果糖、しょ糖および乳糖などの糖類、例えば澱粉、粉末セルロースおよびデキストリン等の多糖類、例えば尿素、尿素誘導体、安息香酸および安息香酸の塩等の有機物、例えば木粉、コルク粉、トウモロコシ穂軸、クルミ殻およびタバコ茎等の植物類、フライアッシュ、ホワイトカーボン（例えば、含水合成シリカ、無水合成シリカおよび含水合成シリケート等）ならびに肥料等が挙げられる。

10

【0105】

液体担体としては、例えばキシレン、アルキル（ C_9 または C_{10} 等）ベンゼン、フェニルキシリルエタンおよびアルキル（ C_1 または C_3 等）ナフタレン等の芳香族炭化水素類、マシン油、ノルマルパラフィン、イソパラフィンおよびナフテン等の脂肪族炭化水素類、ケロシン等の芳香族炭化水素と脂肪族炭化水素の混合物、エタノール、イソプロパノール、シクロヘキサノール、フェノキシエタノールおよびベンジルアルコール等のアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、ジエチレングリコール、ヘキシレングリコール、ポリエチレングリコールおよびポリプロピレングリコール等の多価アルコール、プロピルセロソルブ、ブチルセロソルブ、フェニルセロソルブ、プロピレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノエチルエーテル、プロピレングリコールモノプロピルエーテル、プロピレングリコールモノブチルエーテルおよびプロピレングリコールモノフェニルエーテル等のエーテル、アセトフェノン、シクロヘキサノンおよびγ-ブチロラクトン等のケトン、脂肪酸メチルエステル、コハク酸ジアルキルエステル、グルタミン酸ジアルキルエステル、アジピン酸ジアルキルエステルおよびフタル酸ジアルキルエステル等のエステル、N-アルキル（ C_1 、 C_8 または C_{12} 等）ピロリドン等の酸アミド、大豆油、アマニ油、ナタネ油、ヤシ油、綿実油およびヒマシ油等の油脂、ジメチルスルホキシドならびに水が挙げられる。

20

30

これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0106】

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキル（モノまたはジ）フェニルエーテル、ポリオキシエチレン（モノ、ジまたはトリ）スチリルフェニルエーテル、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、ポリオキシエチレン脂肪酸（モノまたはジ）エステル、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、ヒマシ油エチレンオキサイド付加物、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、アセチレングリコールのエチレンオキサイド付加物、アセチレンアルコールのエチレンオキサイド付加物およびアルキルグリコキシド等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸エステル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、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、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸または燐酸エステル塩、ポリオキシエチレン（モノまたはジ）アルキルフェニルエーテル硫酸または燐酸エステル塩、ポリオキシエチレン（モノ、ジまたはトリ）スチリルフェニルエーテル硫酸または燐酸エステル塩、ポリカルボン酸塩（例えば、ポリアクリル酸塩、ポリマレイン酸塩およびマレイン酸とオレフィンとの共重合体等）およびポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤、アミノ酸型およびペタイン型等の両性界面活性剤、シ

40

50

リコーン系界面活性剤ならびにフッ素系界面活性剤が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05~20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0107】

本発明の化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異は有るが、一般には有効成分量としてヘクタール(ha)当たり0.005~50kg程度が適当である。

【0108】

一方、家畜及び愛玩動物としての哺乳動物および鳥類の外部又は内部寄生虫の防除に本発明の化合物を使用するにあたっては、有効量の本発明の化合物を製剤用添加物とともに経口投与、注射(筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内)などの非経口投与;浸漬、スプレー、入浴、洗浄、滴下(pouring-on)およびスポッティング(spotting-on)並びにダスティング(dusting)などの経皮投与;経鼻投与により投与することができる。本発明の化合物はまた、細片、プレート、バンド、カラー、イヤーマーク(ear mark)、リム(limb)・バンド、標識装置などを用いた成形製品により投与することができる。投与にあたっては本発明の化合物を投与経路に適した任意の剤型とすることができる。

10

【0109】

調製される任意の剤型としては、粉剤、粒剤、水和剤、ペレット、錠剤、大丸薬、カプセル剤、活性化合物を含む成形製品などの固体調製物;注射用液剤、経口用液剤、皮膚上または体腔中に用いる液剤;滴下(Pour-on)剤、点下(Spot-on)剤、フロアブル剤、乳剤などの溶液調製物;軟膏剤、ゲルなどの半固体調製物などが挙げられる。

20

【0110】

固体調製物は、主に経口投与あるいは水などで希釈して経皮投与にあるいは環境処理にて用いることができる。固体調製物は、活性化合物を必要ならば補助剤を加えて適当な賦形剤と共に混合し、そして所望の形状に変えることにより調製できる。適当な賦形剤としては、例えば炭酸塩、炭酸水素塩、リン酸塩、酸化アルミニウム、シリカ、粘土などの無機物質、糖、セルロース、粉碎された穀物、澱粉などの有機物質がある。

【0111】

注射用液剤は、静脈内、筋肉内および皮下に投与できる、注射用液剤は、活性化合物を適当な溶媒に溶解させ、そして必要ならば可溶化剤、酸、塩基、緩衝用塩、酸化防止剤および保護剤などの添加剤を加えることにより調製できる。適当な溶媒としては、水、エタノール、ブタノール、ベンジルアルコール、グリセリン、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、N-メチルピロリドン並びにこれらの混合物、生理学的に許容しうる植物油、注射に適する合成油などがあげられる。可溶化剤としては、ポリビニルピロリドン、ポリオキシエチル化されたヒマシ油およびポリオキシエチル化されたソルビタンエステルなどがあげられる。保護剤には、ベンジルアルコール、トリクロロブタノール、p-ヒドロキシ安息香酸エステルおよびn-ブタノールなどがある。

30

【0112】

経口液剤は直接または希釈して投与することができる。注射用液剤と同様に調製することができる。

40

【0113】

フロアブル剤、乳剤、などは直接または希釈して経皮的に、または環境処理にて投与できる。

【0114】

皮膚上で用いる液剤は、滴下し、広げ、すり込み、噴霧し、散布するか、または浸漬(浸漬、入浴または洗浄)により塗布することにより投与できる。これらの液剤は注射用液剤と同様に調製できる。

【0115】

滴下(Pour-on)剤および点下(Spot-on)剤は皮膚の限定された場所に滴下するか、または

50

噴霧し、これにより活性化合物を皮膚に浸漬させそして全身的に作用させることができる。滴下剤および点下剤は、有効成分を適当な皮膚適合性溶媒または溶媒混合物に溶解するか、懸濁させるかまたは乳化することにより調製できる。必要ならば、界面活性剤、着色剤、吸収促進物質、酸化防止剤、光安定剤および接着剤などの補助剤を加えてもよい。

【0116】

適当な溶媒としては、水、アルカノール、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、ベンジルアルコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール、酢酸エチル、酢酸ブチル、安息香酸ベンジル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテル、アセトン、メチルエチルケトン、芳香族および/または脂肪族炭化水素、植物または合成油、DMF、流動パラフィン、軽質流動パラフィン、シリコーン、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドンまたは2,2-ジメチル-4-オキシ-メチレン-1,3-ジオキサランが挙げられる。吸収促進物質には、DMSO、ミリスチン酸イソプロピル、ペラルゴン酸ジプロピレングリコール、シリコーン油、脂肪族エステル、トリグリセリドおよび脂肪アルコールが挙げられる。酸化防止剤には、亜硫酸塩、メタ亜硫酸塩、アスコルビン酸、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソールおよびトコフェロールが挙げられる。

10

【0117】

乳剤は、経口投与、経皮投与または注射として投与できる。乳剤は、有効成分を疎水性相または親水性相に溶解させ、このものを適当な乳化剤により、必要ならばさらに着色剤、吸収促進物質、保護剤、酸化防止剤、遮光剤および増粘物質などの補助剤と共に他の相の溶媒と均質化することにより調製できる。

20

【0118】

疎水性相（油）としては、パラフィン油、シリコーン油、ゴマ油、アーモンド油、ヒマシ油、合成トリグリセリド、ステアリン酸エチル、アジピン酸ジ-n-ブチリル、ラウリル酸ヘキシル、ペラルゴン酸ジプロピレングリコール、分枝鎖状の短鎖長脂肪酸と鎖長C16~C18の飽和脂肪酸とのエステル、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、鎖長C12~C18の飽和脂肪アルコールのカプリル/カプリン酸エステル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル、オレイン酸エチル、乳酸エチル、ワックス状脂肪酸エステル、フタル酸ジブチル、アジピン酸ジイソプロピル、イソトリデシルアルコール、2-オクチルドデカノール、セチルステアリルアルコール、オレイルアルコールが挙げられる。

30

【0119】

親水性相としては、水、プロピレングリコール、グリセリン、ソルビトールが挙げられる。

乳化剤としては、ポリオキシエチル化されたヒマシ油、ポリオキシエチル化されたモノオレフィン酸ソルビタン、モノステアリン酸ソルビタン、モノステアリン酸グリセリン、ステアリン酸ポリオキシエチル、アルキルフェノールポリグリコールエーテルなどの非イオン性界面活性剤；N-ラウリル-イミノジプロピオン酸二ナトリウム、レシチンなどの両性界面活性剤；ラウリル硫酸ナトリウム、脂肪アルコール硫酸エーテル、モノ/ジアルキルポリグリコールオルトリン酸エステルのモノエタノールアミン塩などの陰イオン性界面活性剤；塩化セチルトリメチルアンモニウムなどの陽イオン性界面活性剤などが挙げられる。

40

【0120】

他の補助剤として、カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、ポリアクリレート、アルギネート、ゼラチン、アラビアゴム、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、メチルビニルエーテル、無水マレイン酸の共重合体、ポリエチレングリコール、ワックス、コロイド状シリカが挙げられる。

【0121】

半固体調製物は皮膚上に塗布するか、もしくは広げるか、または体腔中に導入することにより投与できる。ゲルは注射用液剤について上記したように調製した溶液に、軟膏状の

50

粘稠性を有する透明な物質を生じさせるに十分なシックナーを加えることにより調製できる。

【0122】

次に本発明の化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

【0123】

【表64】

〔水和剤〕		
本発明の化合物	0.1～80部	10
固体担体	5～98.9部	
界面活性剤	1～10部	
その他	0～5部	

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげられる。

【0124】

【表65】

〔乳剤〕		
本発明の化合物	0.1～30部	20
液体担体	45～95部	
界面活性剤	4.9～15部	
その他	0～10部	

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0125】

〔懸濁剤〕

【表66】

〔懸濁剤〕		
本発明の化合物	0.1～70部	30
液体担体	15～98.89部	
界面活性剤	1～12部	
その他	0.01～30部	

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

【0126】

【表67】

〔顆粒水和剤〕		
本発明の化合物	0.1～90部	40
固体担体	0～98.9部	
界面活性剤	1～20部	
その他	0～10部	

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0127】

【表 6 8】

〔液 剤〕	
本発明の化合物	0.01～70部
液体担体	20～99.99部
その他	0～10部

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

【0128】

【表 6 9】

10

〔粒 剤〕	
本発明の化合物	0.01～80部
固体担体	10～99.99部
その他	0～10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0129】

【表 7 0】

20

〔粉 剤〕	
本発明の化合物	0.01～30部
固体担体	65～99.99部
その他	0～5部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0130】

次に、本発明の化合物を有効成分とする製剤例をより具体的に示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、以下の配合例において、「部」は重量部を意味する。

30

【表 7 1】

〔配合例1〕水和剤	
本発明の化合物 No. 1-001	20部
パイロフィライト	74部
ソルポール5039	4部
(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株)商品名)	
カープレックス#80D	2部
(合成含水珪酸：塩野義製薬(株)商品名)	

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

40

【0131】

【表 7 2】

〔配合例2〕乳 剤	
本発明の化合物 No. 1-001	5部
キシレン	75部
N-メチルピロリドン	15部
ソルポール2680	5部
(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株)商品名)	

50

以上を均一に混合して乳剤とする。

【0132】

【表73】

〔配合例3〕乳剤

本発明の化合物No. 1-001	4部	
DBE	36部	
(アジピン酸ジメチル、グルタル酸ジメチル、コハク酸ジメチルの混合物：インビスタ (IN VISTA) 社製商品名)		
アジピン酸ジイソブチル	30部	10
N-メチルピロリドン	10部	
ソプロフォールBSU	14部	
(非イオン性界面活性剤：ローディア (Rhodia) 社商品名)		
ローダカル70BC	6部	
(アニオン性界面活性剤：ローディア (Rhodia) 社商品名)		

以上を均一に混合して乳剤とする。

【0133】

【表74】

〔配合例4〕乳剤

本発明の化合物No. 1-001	4部	20
DBE	11部	
(アジピン酸ジメチル、グルタル酸ジメチル、コハク酸ジメチルの混合物：インビスタ (IN VISTA) 社製商品名)		
アジピン酸ジイソブチル	30部	
N-メチルピロリドン	5部	
ソプロフォールBSU	14部	
(非イオン性界面活性剤：ローディア (Rhodia) 社商品名)		
ローダカル70BC	6部	
(アニオン性界面活性剤：ローディア (Rhodia) 社商品名)		
プロピレングリコール	10部	30
水	20部	

以上を均一に混合して乳剤とする。

【0134】

【表75】

〔配合例5〕懸濁剤

本発明の化合物No. 1-001	25部	
アグリゾールS-710	10部	40
(非イオン性界面活性剤：花王 (株) 商品名)		
ルノックス1000C	0.5部	
(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業 (株) 商品名)		
キサントガム	0.2部	
水	64.3部	

以上を均一に混合した後、湿式粉碎して懸濁剤とする。

【0135】

【表 7 6】

〔配合例6〕 顆粒水和剤	
本発明の化合物No. 1-001	75部
ハイテノールNE-15	5部
(アニオン性界面活性剤：第一工業製薬(株) 商品名)	
バニレックスN	10部
(アニオン性界面活性剤：日本製紙(株) 商品名)	
カープレックス#80D	10部
(合成含水珪酸：塩野義製薬(株) 商品名)	

10

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して顆粒水和剤とする。

【0136】

【表 7 7】

〔配合例7〕 粒 剤	
本発明の化合物No. 1-001	5部
ベントナイト	50部
タルク	45部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

20

【0137】

【表 7 8】

〔配合例8〕 粉 剤	
本発明の化合物No. 1-001	3部
カープレックス#80D	0.5部
(合成含水珪酸：塩野義製薬(株) 商品名)	
カオリナイト	95部
リン酸ジイソプロピル	1.5部

30

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

使用に際しては、上記製剤を水で1～10000倍に希釈して、又は希釈せずに直接散布する。

【0138】

【表 7 9】

〔配合例9〕 水和剤調製物	
本発明の化合物No. 1-004	25部
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1部
n-ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	10部
アルキルアリール ポリグリコールエーテル	12部
ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物のナトリウム塩	3部
エマルジョン型シリコーン	1部
二酸化ケイ素	3部
カオリン	45部

40

【0139】

【表 8 0】

〔配合例 1 0〕 水溶性濃厚剤調製物

本発明の化合物 No. 1-004	20部
ポリオキシエチレンラウリルエーテル	3部
ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム	3.5部
ジメチルスルホキシド	37部
2-プロパノール	36.5部

【 0 1 4 0 】

【表 8 1】

10

〔配合例 1 1〕 噴霧用液剤

本発明の化合物 No. 1-004	2部
ジメチルスルホキシド	10部
2-プロパノール	35部
アセトン	53部

【 0 1 4 1 】

【表 8 2】

〔配合例 1 2〕 経皮投与用液剤

本発明の化合物 No. 1-004	5部
ヘキシレングリコール	50部
イソプロパノール	45部

20

【 0 1 4 2 】

【表 8 3】

〔配合例 1 3〕 経皮投与用液剤

本発明の化合物 No. 1-004	5部
プロピレングリコールモノメチルエーテル	50部
ジプロピレングリコール	45部

30

【 0 1 4 3 】

【表 8 4】

〔配合例 1 4〕 経皮投与(滴下)用液剤

本発明の化合物 No. 1-004	2部
軽質流動パラフィン	98部

【 0 1 4 4 】

【表 8 5】

40

〔配合例 1 5〕 経皮投与(滴下)用液剤

本発明の化合物 No. 1-004	2部
軽質流動パラフィン	58部
オリーブ油	30部
ODO-H	9部
信越シリコーン	1部

【 0 1 4 5 】

また、本発明の化合物を農薬として使用する場合には、必要に応じて製剤時又は散布時

50

に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤等と混合施用しても良い。

【 0 1 4 6 】

特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の低減による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺虫スペクトラムの拡大やより高い有害生物防除効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明の化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えばザ・ペスティサイド・マニュアル(The Pesticide Manual) 14版、2006年に記載されている化合物等が挙げられる。具体的にその一般名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみ限定されるものではない。

10

【 0 1 4 7 】

殺菌剤：アシベンゾラルーS - メチル(acibenzolar-S-methyl)、アシルアミノベンザミド(acylaminobenzamide)、アシペタックス(acypetacs)、アルジモルフ(aldimorph)、アミスルプロム(amisulbrom)、アンバム(amobam)、アムプロピルホス(ampropyfos)、アニラジン(anilazine)、アザコナゾール(azaconazole)、アジチラム(azithiram)、アゾキシストロビン(azoxystrobin)、バリウムポリサルファイド(barium polysulfide)、ベナラキシル(benalaxyl)、ベノダニル(benodanil)、ベノミル(benomyl)、ベンキノックス(benquinox)、ベントアルロン(bentaluron)、ベンチアパリカルブ(benthiavalicarb)、ベンチアゾール(benthiazole)、ベンザマクリル(benzamacril)、ベンズアモルフ(benzamorf)、ベトキサジン(bethoxazine)、ビナパクリル(binapacryl)、ビフェニル(biphenyl)、ピテルタノール(bitertanol)、ブラストサイジン-S(blasticidin-S)、ボルドー液(bordeaux mixture)、ボスカリド(boscalid)、プロモコナゾール(bromoconazole)、ブピリメート(bupirimate)、ブチオベート(buthiobate)、カルシウムポリスルフィド(calcium polysulfide)、キャプタフォール(captafol)、キャプタン(captan)、カルプロパミド(carpropamid)、カルバモルフ(carbamorph)、カルベンダジン(carbendazim)、カルボキシ(carboxin)、カルボン(carvone)、チェシュントミクスチャ(cheshunt mixture)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロベンチアゾン(chlobenthiazole)、クロラニフォルメタン(chloraniformethane)、クロラニル(chloranil)、クロルフェナゾール(chlorfenazol)、クロロネブ(chloroneb)、クロロピクリン(chloropicrin)、クロロタロニル(chlorothalonil)、クロロキノックス(chlorquinox)、クロゾリネート(chlozolate)、クリムバゾール(climbazole)、クロトリマゾール(clotrimazole)、銅酢酸塩(copper acetate)、塩基性炭酸銅(copper carbonate, basic)、水酸化第二銅(copper hydroxide)、銅ナフタレン(copper naphthenate)、銅オレイト(copper oleate)、銅オキシクロリド(copper oxychloride)、硫酸銅(copper sulfate)、塩基性硫酸銅(copper sulfate, basic)、銅ジクロロクロム(copper zinc chromate)、クフラネブ(cufraneb)、クプロバム(cuprobam)、シアゾファミド(cyazofamid)、シクラフルアミド(cyclafuramid)、シクロヘキシミド(cycloheximide)、シフルフェナミド(cyflufenamid)、シモキサニル(cymoxanil)、サイペンダゾール(cypendazole)、シプロコナゾール(cyproconazol)、シプロジニル(cyprodinil)、シプロフラム(cyprofuram)、ダゾメット(dazomet)、デバカルブ(debacarb)、デカフェンチン(decafentin)、デハイドロアセテート(dehydroacetic acid)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)、ジクロン(dichlone)、ジクロロフェン(dichlorophen)、ジクロゾリン(dichlozoline)、ジクロブトラゾール(diclobutrazol)、ジクロシメット(diclocy met)、ジクロメジン(diclomedine)、ジクロラン(dicloran)、ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、ジフルメトリン(diflumetorim)、ジメチリモール(dimethirimol)、ジメトモルフ(dimethomorph)、ジモキシストロビン(dimoxystrobin)、ジニコナゾール(diniconazole)、ジニコナゾール-M(diniconazole-M)、ジノブトン(dinobuton)、ジノカップ(dinocap)、ジノカップ-4(dinocap-4)、ジノカップ-6(dinocap-6)、ジノクトン(dinocton)、ジノスルフォン(dinosulfon)、ジノテルボン(dinoterbon)、ジフェニルアミン(diphenylamine)、ジピリチオン(

20

30

40

50

dipyrithione)、ジタリムホス(ditalimfos)、ジチアノン(dithianon)、ドデモルフ(dodemorph)、ドジン(dodine)、ドラゾクソロン(drazoxolon)、エデフェノホス(edifenphos)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、エタコナゾール(etaconazole)、エテム(etem)、エチリモル(ethirimol)、エトキシキン(ethoxyquin)、エトリジアノール(etridiazole)、ファモキサゾン(famoxadone)、フェナリモル(fenarimol)、フェブコナゾール(febuconazole)、フェナミドン(fenamidone)、フェナミノスルフ(fenaminosulf)、フェナパニル(fenapanil)、フェンダゾスラム(fendazosulam)、フェンフラム(fenfuram)、フェンヘキサミド(fenhexamid)、フェニトロパン(fenitropan)、フェノキサニル(fenoxanil)、フェンピクロニル(fenpiclonil)、フェンプロピジン(fenpropidin)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、フェンチン(fentin)、フェルバン(ferbam)、フェリムゾン(ferimzone)、フルアジナム(fluzazinam)、フルジオキシソニル(fludioxonil)、フルメトベル(flumetover)、フルモルフ(flumorph)、フルオピコリド(fluopicolide)、フルオロイミド(fluoroimide)、フルオトリマゾール(fluotrimazole)、フルオキサストロビン(fluoxastrobin)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)、フルシラゾール(flusilazole)、フルスルファミド(flusulfamide)、フルトラニル(flutolanil)、フルトリアフォール(flutriafol)、フォルペット(folpet)、フォセチル-アルミニウム(fosetyl-aluminium)、フベリダゾール(fuberidazole)、フララキシル(furalaxyl)、フラメトピル(furametpyr)、フルカルバニル(furcarbanil)、フルコナゾール(furconazole)、フルコナゾール-シス(furconazole-cis)、フルメシクロックス(furmecyclox)、フルファネート(furphanate)、グリオジン(glyodin)、グリセオフルビン(griseofulvin)、グアザチン(guazatine)、ハラクリネイト(halacrinat)、ヘキサクロロベンゼン(hexachlorobenzene)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、ヘキシルチオフォス(hexylthiofos)、ハイドロキシキノリンサルフェイト(8-hydroxyquinoline sulfate)、ヒメキサゾール(hymexazol)、イマザリル(imazalil)、イミベンコナゾール(imirconazole)、イミノクタジン(iminoctadine)、イブコナゾール(ipconazole)、イプロベンホス(iprobenfos)、イプロジオン(iprodione)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)、イソプロチオラン(isoprothiolane)、イソバレジオン(isovalledione)、カスガマイシン(kasugamycin)、クレソキシム-メチル(kresoxim-methyl)、マンカップー(mancopper)、マンコゼブ(mancozeb)、マンジプロパミド(mandipropamid)、マンネブ(maneb)、メベニル(mebenil)、メカルピンジド(mecarbinzid)、メパニピリム(mepanipyrim)、メプロニル(mepronil)、メタラキシル(metalaxyl)、メタラキシル-M(metalaxyl-M)、メタム(metam)、メタゾキシロン(metazoxolon)、メトコナゾール(metconazole)、メタスルホカルブ(methasulfocarb)、メトフロキサム(methfuroxam)、メチルイソチオシアネイト(methyl isothiocyanate)、メチラム(metiram)、メトミノストロビン(metominostrobin)、メトラフェノン(metrafenone)、メトスルフォバックス(metsulfovax)、ミルネブ(milneb)、ミクロブタニル(myclobutanil)、ミクロゾリン(myclozolin)、ナバム(nabam)、ナタマイシン(natamycin)、ニックルピス(ジメチルジチオカーバメート)(nickel bis(dimethyldithiocarbamate))、ニトロスチレン(nitrostyrene)、ニトロタル-イソプロピル(nitrothal-isopropyl)、ヌアリモル(nuarimol)、オーシーエイチ(OCH)、オクチリノン(octhilinone)、オフレース(ofurace)、オリサストロビン(orysastrobin)、オキサジキシル(oxadixyl)、有機銅(oxine copper)、オキシカルボキシ(oxycarboxin)、オキスポコナゾールフマル酸塩(oxpoconazole fumarate)、ペフラゾエート(pefurzoate)、ペンコナゾール(penconazole)、ペンシクロン(pencycuron)、ペンチオピラド(penthiopyrad)、オルソフェニルフェノール(o-phenylphenol)、フォスジフェン(phosdiphen)、フタライド(phthalide)、ピコキシストロビン(picoxystrobin)、ピペラリン(piperalin)、ポリカーバメート(polycarbamate)、ポリオキシ(oxins)、ポリオクソリム(polyoxorim)、ポタシウムアザイド(potassium azide)、炭酸水素カリウム(potassium hydrogen carbonate)、プロキナジド(proquinazid)、プロベナゾール(probenazole)、プロクロラズ(prochloraz)、プロシミドン(procymidone)、プロバモカルブ塩酸塩

10

20

30

40

50

(propamocarb hydrochloride)、プロピコナゾール(propiconazole)、プロピネブ(propineb)、プロチオカルブ(prothiocarb)、プロチオコナゾール(prothioconazole)、ピラカルボリド(pyracarbolid)、ピラクロストロビン(pyraclostrobin)、ピラゾホス(pyrazophos)、ピリジニトリル(pyridinitril)、ピリフェノックス(pyrifenox)、ピリメタニル(pyrimethanil)、ピロキロン(pyroquilon)、ピロキシクロル(pyroxychlor)、ピロキシフル(pyroxyfur)、キノメチオネート(quinomethionate)、キノキシフェン(quinoxyfen)、キントゼン(quintozene)、キナセトール・スルフェート(quinacetol-sulfate)、キナザミド(quinazamid)、キンコナゾール(quinconazole)、ラベンザゾール(rabenzazole)、アジ化ナトリウム(sodium azide)、炭酸水素ナトリウム(sodium hydrogen carbonate)、次亜塩素酸ナトリウム(sodium hypochlorite)、硫黄(sulfur)、スピロキサミン(spiroxamine)、サリチルアニリド(salicylanilide)、シルチオファミン(silthiofam)、シメコナゾール(simeconazole)、テブコナゾール(tebuconazole)、テクナゼン(tecnazene)、テコラム(tecoram)、テトラコナゾール(tetraconazole)、チアベンダゾール(thiabendazole)、チアジフルオール(thiadifluor)、チシオフェン(thicyofen)、チフルザミド(thifluzamide)、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)、チオキノックス(thioquinox)、チラム(thiram)、チアジニル(tiadinil)、チオキシミド(tioxymid)、トルクロホス-メチル(tolclofos-methyl)、トリルフラニド(tolyfluanid)、トリアジメホン(triadimefon)、トリアジメノール(toriadimenol)、トリアミフォス(triamiphos)、トリアリモル(triarimol)、トリアゾキシド(triazoxide)、トリアズブチル(triazbutyl)、トリブチルチンオキサイド(tributyltin oxide)、トリクラミド(trichlamide)、トリシクラゾール(tricyclazole)、トリデモルフ(tridemorph)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)、トリフルミゾール(triflumizole)、トリホリン(triforine)、トリチコナゾール(triticonazole)、バリダマイシン(validamycin)、ビンクロゾリン(vinclozolin)、ザリルアミド(zarilamide)、硫酸亜鉛(zinc sulfate)、ジネブ(zineb)、ジラム(ziram)、ゾキサミド(zoxamide)及びシイタケ菌系体抽出物など。

10

20

【0148】

殺バクテリア剤：ベンザルコニウムクロライド(benzalkonium chloride)、ビチオノール(bithionol)、プロノポール(bronopol)、クレゾール(cresol)、ホルムアルデヒド(formaldehyde)、ニトラピリン(nitrapyrin)、オキシソリニックアシド(oxolinic acid)、オキシテトラサイクリン(oxytetracycline)、ストレプトマイシン(streptomycin)及びテクロフトラム(tecloftalam)など。

30

【0149】

殺線虫剤：アルドキシカルブ(aldoxycarb)、カズサホス(cadusafos)、デービーシーピー(DBCP)、ジクロフェンチオン(dichlofenthion)、デーエスピー(DSP)、エトプロホス(ethoprophos)、フェナミホス(fenamiphos)、フェンスルホチオン(fensulfot hion)、フォスチアゼート(fosthiazate)、フォスチエタン(fosthietan)、イミシアホス(imicyafos)、イサミドホス(isamidofos)、イサゾホス(isazofos)、オキサミル(oxamyl)及びチオナジン(thionazin)など。

40

【0150】

殺ダニ剤：アセキノシル(acequinocyl)、アクリナトリン(acrinathrin)、アミトラズ(amtiraz)、BCI-033(試験名)、ビフェナゼート(bifenazate)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、チノメチオネート(chinomethionat)、クロロベンジラート(chlorobezilate)、クロフェンテジン(clofentezine)、シエノピラフェン(cyeno pyrafen)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、サイヘキサチン(cyhexatine)、ジコフォール(dicofol)、ジエノクロール(dienochlor)、デーエヌオーシー(DNOC)、エトキサゾール(etoxazole)、フェナザキン(fenazaquin)、フェンブタチンオキシド(fenbutatin oxide)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェンプロパトリン(fenproprathrin)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フルアクリピリム(flucacrypyrim)

50

、ハルフェンプロックス (halfenprox)、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、ミルベメクチン (milbemectin)、プロパルギット (propargite)、ピリダベン (pyridaben)、ピリミジフェン (pyrimidifen)、S - 1 8 7 0 (試験名)、スピロジクロフェン (spirodiclofen)、スピロメシフェン (spyromesifen) 及びテブフェンピラド (tebufenpyrad) など。

【 0 1 5 1 】

殺虫剤：アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセタミピリド (acetamipirid)、アラニカルブ (alanycarb)、アルディカルブ (aldicarb)、アレスリン (allethrin)、アジンホス - メチル (azinphos-methyl)、パチルスチューリングシス (bacillus thuringiensis)、ベンジオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、ベンスルタップ (bensultap)、ピフェントリン (bifenthrin)、ブプロフェジン (buprofezin)、プトカルボキシム (butocarboxim)、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルタップ (cartap)、クロルアントラニリプロール (chlorantraniliprole)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロピリホス - メチル (chlorpyrifos-methyl)、クロマフェノジド (chromafenozide)、クロチアニジン (clothianidin)、シアジピル (cyazpyr)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、シフルトリン (cyfluthrin)、ベータ - シフルトリン (beta-cyfluthrin)、シハロトリン (cyhalothrin)、ラムダ - シハロトリン (lambda-cyhalothrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、シロマジン (cyromazine)、デルタメトリン (deltamethrin)、ジアクロデン (diaclofen)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ダイアジノン (diazinon)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジノテフラン (dinotefuran)、ジオフェノラン (diofenolan)、ジスルフォトン (disulfoton)、ジメトエート (dimethoate)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、イーピーエヌ (EPN)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフエンカルブ (ethiofencarb)、エチプロール (ethiprole)、エトフェンプロックス (etofenprox)、エトリムホス (etrimfos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェノブカルブ (fenobucarb)、フェノキシカーブ (fenoxycarb)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、フェンチオン (fenthion)、フェンバレレート (fenvalerate)、フィプロニル (fipronil)、フロニカミド (flonicamid)、フルベンジアミド (flubendiamide)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルフェネリム (flufenimer)、フルフェノクスウロン (flufenoxuron)、フルフェンプロックス (flufenprox)、フルバリネート (fluvalinate)、タウ - フルバリネート (tau-fluvalinate)、ホノホス (fonophos)、フォルメタネート (formetanate)、フォルモチオン (formothion)、フラチオカルブ (furathiocarb)、ハロフェノジド (halofenozide)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、イミダクロプリド (imidacloprid)、イソフェンホス (isofenphos)、インドキサカルブ (indoxacarb)、イソプロカルブ (isoprocarb)、イソキサチオン (isoxathion)、レピメクチン (lepimectin)、ルフエヌウロン (lufenuron)、マラチオン (malathion)、メタルデヒド (metaldehyde)、メタミドホス (methamidophos)、メチダチオン (methidathion)、メタクリホス (methacryfos)、メタフルミゾン (metaflumizone)、メタルカルブ (metalcarb)、メソミル (methomyl)、メソプレン (methoprene)、メトキシクロール (methoxychlor)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、メチルブロマイド (methyl bromide)、モノクロトホス (monocrotophos)、ムスカール (muscalure)、ニテンピラム (nitenpyram)、ノバルロン (novaluron)、オメトエート (omethoate)、オキサミル (oxamyl)、オキシデメトン - メチル (oxydemeton-methyl)、オキシデプロホス (oxydeprofos)、パラチオン (parathion)、パラチオン - メチル (parathion-methyl)、ペンタクロロフェノール (pentachlorophenol (PCP))、ペルメトリン (permethrin)、フェントエート (phenthoate)、フォキシム (phoxim)、ホレート (phorate)、ホサロン (phosalone)、ホスメット (ph

10

20

30

40

50

osmet)、ホスファミドン(phosphamidon)、ピリミカルブ(pirimicarb)、ピリミホス
 -メチル(pirimiphos-methyl)、プロフェノホス(profenofos)、プロチオホス(prothiofos)、
 プロパホス(propaphos)、プロトリフェンブト(protrifenbute)、ピメトロ
 ジン(pymetrozine)、ピラクロホス(pyraclofos)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフル
 ルキナゾン(pyrifluquinazon)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、ロテノン(rot
 enone)、S I - 0 4 0 5 (試験名)、スルプロホス(sulprofos)、シラフルオフエン(silafluofen)、
 スピネトラム(spinetoram)、スピノサド(spinosad)、スピロテトラ
 マート(spirotetramat)、スルホテップ(sulfotep)、S Y J - 1 5 9 (試験名)、テ
 ブフェノジド(tebfenozide)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、テフルトリン(te
 fluthorin)、テルブホス(terbufos)、テトラクロロピンホス(tetrachlorvinphos)、
 チアクロプリド(thiacloprid)、チオシクラム(thiocyclam)、チオジカルブ(thiodic
 arb)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チオファノックス(thiofanox)、チオメトン
 (thiometon)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、トラロメスリン(tralomethrin)、
 トリクロルホン(trichlorfon)、トリアズロン(triazuron)、トリフルムロン(triflu
 muron)及びバミドチオン(vamidothion)など。

10

【実施例】

【0152】

以下に本発明の化合物の合成例、試験例を実施例として具体的に述べることで、本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

20

【0153】

[合成例]

合成例1

2 - プロモ - N - シクロプロピルカルボニル - 4 - [4 - (3,5 - ジクロロフェニル) - 4 - トリフルオロメチル - 4,5 - ジヒドロ - 3 H - ピロール - 2 - イル]ベンジルアミン(本発明の化合物No.1-001)。

工程1; 1 - (3 - プロモ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (3,5 - ジクロロフェニル) - 4,4,4 - トリフルオロ - 3 - ヒドロキシブタン - 1 - オンの製造

3',5' - ジクロロ - 2,2,2 - トリフルオロアセトフェノン3.42g及び3' - プロモ - 4' - メチルアセトフェノン3.00gのヘプタン5ml溶液にトリエチルアミン0.71gを添加し、60にて8時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷、析出した固体を濾別、ヘキサン3mlにて洗浄し、目的物6.16gを白色結晶として得た。

30

融点141.0 ~ 142.0

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 400MHz) 8.08 (d, J=2.0Hz, 1H), 7.77 (dd, J=7.6, 2.0Hz, 1H), 7.49 (d, J=1.8Hz, 2H), 7.38 (d, J=7.6Hz, 1H), 7.35 (t, J=1.8Hz, 1H), 5.69 (s, 1H), 3.80 (d, J=17.6Hz, 1H), 3.64 (d, J=17.6Hz, 1H), 2.49 (s, 3H)。

工程2; 1 - (3 - プロモ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (3,5 - ジクロロフェニル) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - プテン - 1 - オンの製造

1 - (3 - プロモ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (3,5 - ジクロロフェニル) - 4,4,4 - トリフルオロ - 3 - ヒドロキシブタン - 1 - オン6.00g及び塩化チオニル4.70gのトルエン30ml溶液に、80にて加熱攪拌下、ピリジン3.12gを添加し、同温度にてさらに2時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷、トルエン30mlにて希釈し水洗(30ml x 1)、飽和食塩水次いで無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去し、目的物6.04gを黄色油状物質として得た。

40

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) 7.97 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.65 (dd, J=7.8, 1.8Hz, 1H), 7.3-7.45 (m, 3H), 7.15 (d, J=1.8Hz, 2H), 2.45 (s, 3H)。

工程3; N - [2 - プロモ - 4 - [3 - (3,5 - ジクロロフェニル) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - プテノイル]フェニルメチル]フタルイミドの製造

1 - (3 - プロモ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (3,5 - ジクロロフェニル) - 4,4,4 - トリフルオロ - 2 - プテン - 1 - オン2.00gの1,2 - ジクロロエタン15ml溶液にN - プロモコハク酸イミド0.98g及び , ' - アゾビスイソブチロニトリル0.06g

50

を添加し、加熱還流下にて1時間攪拌、次いでN-プロモコハク酸イミド0.61g及び、'-アゾビスイソブチロニトリル0.05gを追加し、同温度にてさらに2時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷、クロロホルム50mlにて希釈し水洗(30ml×2)、飽和食塩水次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をN,N-ジメチルホルムアミド10mlに溶解しフタルイミドカリウム0.85gを添加、室温にて13時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水30mlを加え、酢酸エチルにて抽出(50ml×1)、有機層を飽和食塩水次いで無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:1)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物1.67gを黄色結晶として得た。

融点99.0~103.0

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) 8.00 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.85-7.95 (m, 2H), 7.75-7.85 (m, 2H), 7.66 (dd, J=8.1-1.8Hz, 1H), 7.15-7.4 (m, 3H), 7.11 (d, J=1.8Hz, 2H), 4.98 (s, 2H)。

工程4; N-[2-プロモ-4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロ-3-(ニトロメチル)ブタノイル]フェニルメチル]フタルイミドの製造

N-[2-プロモ-4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロ-2-ブテノイル]フェニルメチル]フタルイミド0.80g及びニトロメタン0.12gのアセトニトリル10ml溶液に1,8-ジアザピシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン0.23gを添加し、室温にて15時間攪拌した。反応完結後、反応混合物に水20mlを加え酢酸エチルにて抽出(30ml×2)、有機層を飽和食塩水次いで無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去し、目的物0.90gを黄色樹脂状物質として得た。

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) 8.15 (d, J=1.8Hz, 1H), 7.85-7.95 (m, 2H), 7.75-7.85 (m, 3H), 7.40 (t, J=1.7Hz, 1H), 7.28 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.17 (d, J=1.7Hz, 2H), 5.56 (d, J=12.7Hz, 1H), 5.44 (d, J=12.7Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.09 (d, J=18.9Hz, 1H), 3.92 (d, J=18.9Hz, 1H)。

工程5; N-[2-プロモ-4-[4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロール-2-イル]フェニルメチル]フタルイミドの製造

N-[2-プロモ-4-[3-(3,5-ジクロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロ-3-(ニトロメチル)ブタノイル]フェニルメチル]フタルイミド0.70g及びギ酸アンモニウム1.03gのテトラヒドロフラン20ml溶液に亜鉛粉末1.07gを添加し、加熱還流下にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷、酢酸エチル100ml及び水50mlを加えセライト濾過し有機層を分取、飽和食塩水次いで無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をクロロホルムにて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物0.18gを白色結晶として得た。

融点199.0~203.0

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) 8.07 (d, J=1.5Hz, 1H), 7.85-7.95 (m, 2H), 7.75-7.85 (m, 2H), 7.70 (dd, J=8.1, 1.5Hz, 1H), 7.37 (t, J=1.8Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 3H), 5.00 (s, 2H), 4.87 (dd, J=17.4, 1.8Hz, 1H), 4.43 (d, J=17.4Hz, 1H), 3.73 (dd, J=17.4, 1.8Hz, 1H), 3.39 (d, J=17.4Hz, 1H)。

工程6; 2-(4-アミノメチル-3-プロモフェニル)-4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロールの製造

N-[2-プロモ-4-[4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロール-2-イル]フェニルメチル]フタルイミド0.22gのエタノール5ml溶液にヒドラジン-水和物0.074gを添加し、加熱還流下にて2時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷、析出した不溶物を濾別し、減圧下にて溶媒を留去した。残留物にクロロホルム20mlを加え、不溶物を濾別、濾液を水洗(20ml×1)後、飽和食塩水次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去し、目的物0.18gを黄色樹脂状物質として得た。

10

20

30

40

50

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) 8.05 (d, $J=1.5\text{Hz}$, 1H), 7.77 (dd, $J=7.8$, 1.5Hz, 1H), 7.49 (d, $J=7.8\text{Hz}$, 1H), 7.38 (t, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H), 4.89 (dd, $J=7.1$, 1.8Hz, 1H), 4.44 (d, $J=17.1\text{Hz}$, 1H), 3.96 (s, 2H), 3.77 (dd, $J=17.4$, 1.8Hz, 1H), 3.43 (d, $J=17.4\text{Hz}$, 1H), 1.5-1.7 (bs, 2H)。

工程 7 ; 2 - プロモ - N - シクロプロピルカルボニル - 4 - [4 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 4 - トリフルオロメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 H - ピロール - 2 - イル] ベンジルアミンの製造

2 - (4 - アミノメチル - 3 - プロモフェニル) - 4 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 4 - トリフルオロメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 H - ピロール 0.18g 及び トリエチルアミン 0.056g のジクロロメタン 3ml 溶液に、氷冷攪拌下、シクロプロパンカルボニル = クロリド 0.046g を滴下し、滴下終了後、室温にてさらに 20 分間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物にクロロホルム 20ml を加え 3N 塩酸水溶液 10ml 及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 10ml にて洗浄、飽和食塩水次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル - ヘキサン (1 : 1) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 0.054g を白色結晶として得た。

10

融点 204.0 ~ 207.0

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) 8.06 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 7.72 (dd, $J=8.4$, 1.8Hz, 1H), 7.47 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 1H), 7.37 (t, $J=1.7\text{Hz}$, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H), 6.25 (t, $J=6.0\text{Hz}$, 1H), 4.88 (dd, $J=17.1$, 1.5Hz, 1H), 4.56 (d, $J=6.0\text{Hz}$, 2H), 4.43 (d, $J=17.1\text{Hz}$, 1H), 3.75 (dd, $J=18.0$, 1.5Hz, 1H), 3.41 (d, $J=18.0\text{Hz}$, 1H), 1.3-1.45 (m, 1H), 0.95-1.1 (m, 2H), 0.7-0.85 (m, 2H)。

20

【 0 1 5 4 】

合成例 2

4 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - [4 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) フェニル] - 4 - トリフルオロメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 H - ピロール (本発明の化合物 No.3-001) 。

工程 1 ; 3 , 5 - ジクロロ - 1 - (1 - トリフルオロメチルエチル) ベンゼンの製造

3 , 5 - ジクロロフェニルホウ酸 25.0g のテトラヒドロフラン 200ml 及び水 100ml 溶液に、2 - プロモ - 3 , 3 , 3 - トリフルオロプロペン 27.5g、炭酸カリウム 38.0g 及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II) 1.84g を添加し、加熱還流下にて 3 時間攪拌した。反応完結後、室温まで放冷、氷水 500ml を加え、酢酸エチルにて抽出 (500ml x 1) した。有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧下にて溶媒を留去し、残留物をヘキサンにて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 25.7g を無色油状物質として得た。

30

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 400MHz) 7.41 (t, $J=2.0\text{Hz}$, 1H), 7.3-7.35 (m, 2H), 6.05 (q, $J=3.2\text{Hz}$, 1H), 5.82 (q, $J=3.2\text{Hz}$, 1H)。

工程 2 ; N - (4 - プロモベンジル) ホルムアミドの製造

4 - プロモベンジルアミン塩酸塩 9.87g 及び トリエチルアミン 5.04g の混合物にギ酸 20ml 溶液を滴下し、80 にて 3.5 時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を氷水 100ml に注ぎ、酢酸エチルにて抽出 (30ml x 2)、有機層を飽和食塩水次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体をヘキサンにて洗浄し、目的物 9.29g を白色結晶として得た。

40

融点 120.0 ~ 123.0

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 400MHz) 8.28 (s, 1H), 7.47 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 2H), 7.18 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 2H), 5.85 (bs, 1H), 4.25 (d, $J=6.0\text{Hz}$, 2H)。

工程 3 ; 2 - (4 - プロモフェニル) - 4 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 4 - トリフルオロメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 H - ピロールの製造

N - (4 - プロモベンジル) ホルムアミド 1.47g 及び トリエチルアミン 2.08g のトルエン 15ml 溶液に、氷冷攪拌下、オキシ塩化リン 1.12g を滴下し、滴下終了後室温まで

50

徐々に昇温させ、室温にてさらに1時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物を水50mlに注意深く注ぎ、飽和炭酸ナトリウム水溶液を加えて中和、酢酸エチルにて抽出(30ml×2)した。有機層を飽和食塩水次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留物をトルエン35mlに溶解し、工程1にて合成した3,5-ジクロロ-1-(1-トリフルオロメチルエチニル)ベンゼン1.69g及び酸化銅(II)0.09gを添加し、加熱還流下にて4日間攪拌した。反応完結後、固形物をセライト濾過にて除去、濾液を水30mlにて洗浄し、飽和食塩水次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の5-(4-プロモフェニル)-3-(3,5-ジクロロフェニル)-3-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロールを得た。

得られた粗製の5-(4-プロモフェニル)-3-(3,5-ジクロロフェニル)-3-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロールをテトラヒドロフラン35mlに溶解、氷冷攪拌下、カリウム tert-ブトキシド0.78gを添加し、室温にて16時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を水150mlに注ぎ、酢酸エチルにて抽出(30ml×2)、有機層を飽和食塩水次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(1:5)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物1.60gを無色油状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 400MHz) 7.74 (s, 2H), 7.62 (s, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.26 (s, 2H), 4.89 (d, $J=21.6\text{Hz}$, 1H), 4.42 (d, $J=21.6\text{Hz}$, 1H), 3.77 (d, $J=21.6\text{Hz}$, 1H), 3.46 (d, $J=21.6\text{Hz}$, 1H)。

工程4; 4-(3,5-ジクロロフェニル)-2-[4-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)フェニル]-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロールの製造
2-(4-プロモフェニル)-4-(3,5-ジクロロフェニル)-4-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-3H-ピロール1.60g、1,2,4-トリアゾール0.53g、炭酸カリウム1.01g及びヨウ化カリウム1.25gのN-メチルピロリドン20ml懸濁液にヨウ化銅0.21gを添加、190にて1時間攪拌した。反応完結後、反応混合物を室温まで放冷し、水50mlに注意深く注ぎ、酢酸エチルにて抽出(30ml×2)、有機層を飽和食塩水次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチル-ヘキサン(3:2)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物0.27gを白色結晶として得た。

融点 197.0 ~ 198.0

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 400MHz) 8.65 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.04 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 2H), 7.82 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.28 (s, 2H), 4.93 (d, $J=17.2\text{Hz}$, 1H), 4.49 (d, $J=16.8\text{Hz}$, 1H), 3.85 (d, $J=17.6\text{Hz}$, 1H), 3.51 (d, $J=18.0\text{Hz}$, 1H)。

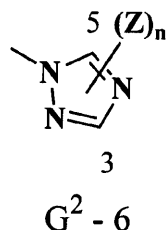
【0155】

本発明の化合物は、前記製造法及び実施例に準じて製造することができる。合成例1及び合成例2と同様に製造した本発明の化合物の例を第4表~第6表に示すが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

尚、表中、c-Prはシクロプロピル基を、Phはフェニル基ををそれぞれ表し、

表中、 G^2-6 で表される複素環は、下記で示される構造を表し、

【化39】



また、表中、置換基(X)_m及び(Z)_nの置換位置を表す番号は、それぞれ上記及び下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものであり、-の表記は、無置換を表す。

さらに、表中、*1は「樹脂状」を意味する。

10

20

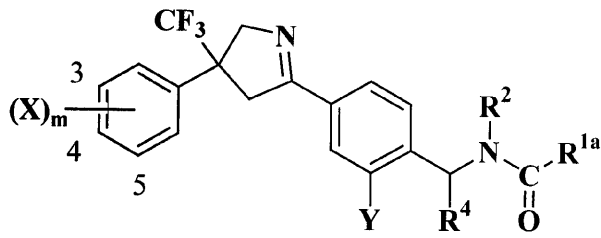
30

40

50

第 4 表

【化 4 0】



【表 8 6】

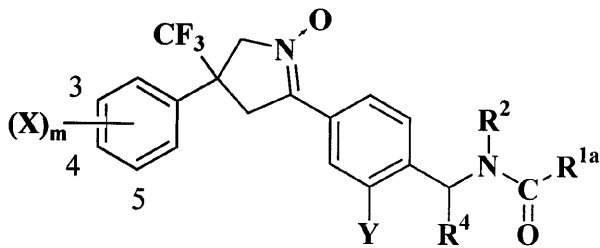
No.	(X) _m	Y	R ⁴	R ²	R ^{1a}	m. p. (°C)
1-001	3,5-Cl ₂	Br	H	H	c-Pr	204.0-207.0
1-002	3,5-Cl ₂	Br	H	H	Ph-2,4,6-F ₃	114.5-118.0
1-003	3,5-Cl ₂	H	CH ₃	H	c-Pr	*1
1-004	3,5-Cl ₂	H	CH ₃	H	CH ₂ CF ₃	*1

10

【0 1 5 6】

第 5 表

【化 4 1】



20

【表 8 7】

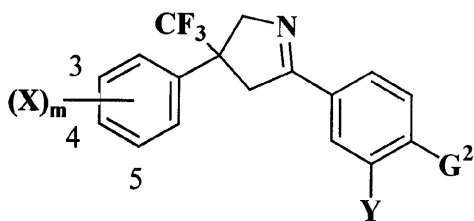
No.	(X) _m	Y	R ⁴	R ²	R ^{1a}	m. p. (°C)
2-001	3,5-Cl ₂	H	CH ₃	H	CH ₂ CF ₃	99.5-103.0

30

【0 1 5 7】

第 6 表

【化 4 2】



40

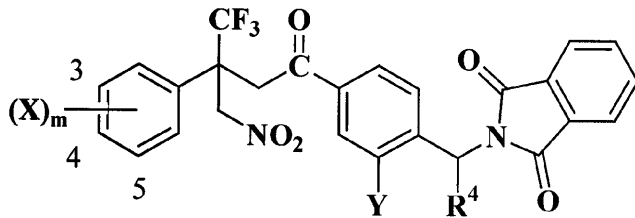
【表 8 8】

No.	(X) _m	Y	G ²	(Z) _n	m. p. (°C)
3-001	3,5-Cl ₂	H	G ² -6	—	197.0-198.0

【0158】

第 7 表

【化 4 3】



10

【表 8 9】

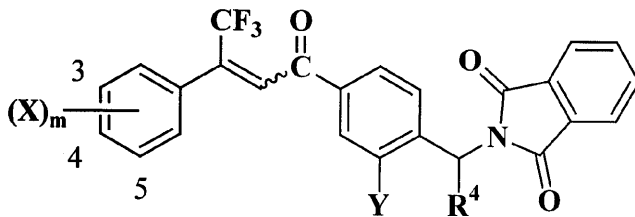
No.	(X) _m	Y	R ⁴	m. p. (°C)
4-001	3,5-Cl ₂	Br	H	*1

20

【0159】

第 8 表

【化 4 4】



30

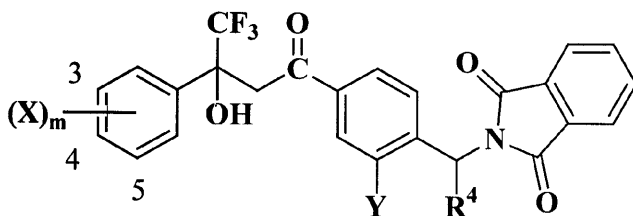
【表 9 0】

No.	(X) _m	Y	R ⁴	m. p. (°C)
5-001	3,5-Cl ₂	H	CH ₃	112.0-115.0
5-002	3,5-Cl ₂	Br	H	99.0-103.0

【0160】

第 9 表

【化 4 5】



40

【表 9 1】

No.	(X) _m	Y	R ⁴	m. p. (°C)
6-001	3,5-Cl ₂	Br	H	*1

へら

【0161】

本発明の化合物のうち、融点の記載のない化合物の¹H NMRデータを第10表に示す。
第10表

【表 9 2】

10

No.	¹ H NMR (CDCl ₃ , Me ₄ Si, 300MHz)
1-003	δ 7.82 (d, J=8.4Hz, 2H), 7.40 (d, J=8.4Hz, 2H), 7.36 (d, J=1.7Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H), 5.87 (d, J=7.2Hz, 1H), 5.1-5.25 (m, 1H), 4.87 (d, J=17.0Hz, 1H), 4.43 (d, J=17.0Hz, 1H), 3.78 (d, J=17.8Hz, 1H), 3.43 (d, J=17.8Hz, 1H), 1.51 (d, J=7.2Hz, 3H), 1.3-1.45 (m, 1H), 0.9-1.1 (m, 2H), 1.65-1.85 (m, 2H)。
1-004	δ 7.83 (d, J=8.3Hz, 2H), 7.35-7.45 (m, 3H), 7.27 (s, 2H), 6.08 (d, J=7.9Hz, 1H), 5.1-5.25 (m, 1H), 4.87 (d, J=17.0Hz, 1H), 4.43 (d, J=17.0Hz, 1H), 3.78 (d, J=17.8Hz, 1H), 3.43 (d, J=17.8Hz, 1H), 3.08 (q, J=11.0Hz, 2H), 1.53 (d, J=7.2Hz, 3H)。

20

【0162】

[試験例]

次に、本発明の化合物の有害生物防除剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明するが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

【0163】

試験例 1 コナガに対する殺虫試験

本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、10ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にコナガ(*Plutella xylostella*)の2齢幼虫をシャーレ当たり5頭放虫し、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、下記の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

30

$$\text{死虫率(\%)} = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-001~1-004,2-001*,3-001*。

尚、上記*印は100ppm濃度の薬液を用いて殺虫試験を実施したことを表す。

【0164】

試験例 2 ハスモンヨトウに対する殺虫試験

本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、10ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)の2齢幼虫をシャーレ当たり5頭放虫し、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

40

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-001~1-004,2-001*。

尚、上記*印は100ppm濃度の薬液を用いて殺虫試験を実施したことを表す。

【0165】

試験例 3 チャハマキに対する殺虫試験

50

本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、100ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にチャハマキ(*Homona magnanima*)の2齢幼虫をシャーレ当たり5頭放虫し、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-003。

【0166】

試験例4 オオタバコガに対する殺虫試験

本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、100ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にオオタバコガ(*Helicoverpa armigera*)の2齢幼虫をシャーレ当たり1頭放虫し、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は12連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-001,1-003,1-004。

【0167】

試験例5 ミカンキイロアザミウマに対する殺虫試験

内径7cmのスチロールカップに湿った濾紙を敷き、その上に同径に切り取ったインゲンの葉を置き、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)の1齢幼虫を1葉当たり10頭接種した。本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製し、回転式散布塔を用いて薬液をスチロールカップ当たり2.5mlずつ散布、蓋をして25℃恒温室に収容した。2日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-003,3-001。

【0168】

試験例6 ミナミキイロアザミウマに対する殺虫試験

内径7cmのスチロールカップに湿った濾紙を敷き、その上に同径に切り取ったインゲンの葉を置き、ミナミキイロアザミウマ(*Thrips palmi*)の成虫を1葉当たり10頭接種した。本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、100ppm濃度の薬液を調製し、回転式散布塔を用いて薬液をスチロールカップ当たり2.5mlずつ散布、蓋をして25℃恒温室に収容した。2日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-003。

【0169】

試験例7 トビイロウンカに対する殺虫試験

本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にイネの葉鞘を約10秒間浸漬し、風乾後試験管に入れ、この中にトビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)の2齢幼虫を試験管当たり5頭放虫し、スポンジで蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-002,1-003。

【0170】

10

20

30

40

50

試験例 8 シルバーリーフコナジラミに対する殺虫試験

内径7cmのスチロールカップに湿った濾紙を敷き、その上にシルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*) に産卵させたトマトの葉(10卵/葉)を切り取って置いた。本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製し、回転式散布塔を用いて薬液をスチロールカップ当たり2.5mlずつ散布、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-003,3-001。

【0171】

10

試験例 9 モモアカアブラムシに対する殺虫試験

内径3cmのガラスシャーレに湿った脱脂綿を敷き、その上に同径に切り取ったカンランの葉を置き、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)無翅成虫を4頭放虫した。1日後、本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製し、回転式散布塔にて薬液を散布(2.5mg/cm²)、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-003。

【0172】

20

試験例 10 フジコナカイガラムシに対する殺虫試験

内径7cmのスチロールカップに湿った濾紙を敷き、その上に同径に切り取ったインゲンの葉を置き、フジコナカイガラムシ(*Planococcus kraunhiae*)の1齢幼虫を1葉当たり10頭接種した。本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製し、回転式散布塔を用いて薬液をスチロールカップ当たり2.5mlずつ散布、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.3-001。

【0173】

30

試験例 11 ウリハムシに対する殺虫試験

本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にキュウリの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)の2齢幼虫をシャーレ当たり5頭放虫し、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.3-001。

【0174】

40

試験例 12 マメハモグリバエに対する殺虫試験

本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にマメハモグリバエ(*Liriomyza trifolii*)に産卵させた直径7cmに切り取ったインゲンの葉(10卵/葉)を約10秒間浸漬し、風乾後、内径7cmのスチロールカップに敷いた湿った濾紙の上に置き、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.3-001。

50

【 0 1 7 5 】

試験例 1 3 ナミハダニに対する殺虫試験

内径7cmのスチロールカップに湿った濾紙を敷き、その上に同径に切り取ったインゲンの葉を置き、ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)の幼虫を1葉当たり10頭接種した。本発明の化合物の10%乳剤(化合物によっては10%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製し、回転式散布塔を用いて薬液をスチロールカップ当たり2.5mlずつ散布、蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-002,1-003,3-001。

10

【 0 1 7 6 】

試験例 1 4 ネコノミ(Cat flea)に対する殺虫試験

内径5.3cmのシャーレの底面と側面とに、本発明の化合物4mgを40mlのアセトンに溶解(100ppm濃度)したアセトン溶液400 μ lを塗布した後、アセトンを揮発させて本発明の化合物の薄膜をシャーレ内壁に作成した。用いたシャーレの内壁は40cm²なので、処理薬量は1.0 μ g/cm²となる。これにネコノミ(*Ctenocephalides felis*)成虫(雌雄混合)を10頭放虫し、蓋をして25℃恒温室に収容した。4日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は1連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-004。

20

【 0 1 7 7 】

試験例 1 5 マダニ(American dog tick)に対する殺虫試験

内径5.3cmのシャーレ2枚の底面と側面とに、本発明の化合物4mgを40mlのアセトンに溶解(100ppm濃度)したアセトン溶液400 μ lを塗布した後、アセトンを揮発させて本発明の化合物の薄膜をシャーレ内壁に作成した。用いたシャーレの内壁は40cm²なので、処理薬量は0.1 μ g/cm²となる。これにAmerican dog tick(*Dermacentor variabilis*)第1若虫(雌雄混合)を10頭放虫し、2枚合わせて、逃亡しないようにつなぎ目をテープで止め、25℃恒温室に収容した。4日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は1連制で行なった。

その結果、供試した化合物の内、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明の化合物：No.1-004。

30

【 産業上の利用可能性 】

【 0 1 7 8 】

本発明に係る置換ジヒドロアゾール化合物は、優れた有害生物防除活性、特に殺虫・殺ダニ活性を示し、且つ、ホ乳動物、魚類及び益虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物である。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2008/072182

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER C07D207/20(2006.01)i, A01N43/36(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04 (2006.01)i, A61K31/40(2006.01)i, A61K31/4196(2006.01)i, A61P33/00 (2006.01)i, A61P33/10(2006.01)i, A61P33/12(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) C07D207/20, A01N43/36, A01P7/02, A01P7/04, A61K31/40, A61K31/4196, A61P33/00, A61P33/10, A61P33/12, A61P33/14, C07D403/04 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 1996-2009 Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2009 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2009 Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAplus (STN), REGISTRY (STN)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP 2007-91708 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 12 April, 2007 (12.04.07), Claims; examples (Family: none)	1-10
Y	JP 2007-16017 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 25 January, 2007 (25.01.07), Claims; examples (Family: none)	1-10
Y	WO 2007/105814 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 20 September, 2007 (20.09.07), Claims; examples (Family: none)	1-10
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> 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 05 January, 2009 (05.01.09)		Date of mailing of the international search report 20 January, 2009 (20.01.09)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer
Facsimile No.		Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2008/072182

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 2005/085216 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 15 September, 2005 (15.09.05), Claims; examples & US 2007/0066617 A1 & EP 1731512 A1 & KR 2007010145 A & CN 1930136 A	1-10

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2008/072182

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

A61P33/14(2006.01)i, C07D403/04(2006.01)i

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

国際調査報告		国際出願番号 PCT/J P 2 0 0 8 / 0 7 2 1 8 2	
A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) Int.Cl. C07D207/20(2006.01)i, A01N43/36(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, A61K31/40(2006.01)i, A61K31/4196(2006.01)i, A61P33/00(2006.01)i, A61P33/10(2006.01)i, A61P33/12(2006.01)i, A61P33/14(2006.01)i, C07D403/04(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 (IPC)) Int.Cl. C07D207/20, A01N43/36, A01P7/02, A01P7/04, A61K31/40, A61K31/4196, A61P33/00, A61P33/10, A61P33/12, A61P33/14, C07D403/04			
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 1922-1996年 日本国公開実用新案公報 1971-2009年 日本国実用新案登録公報 1996-2009年 日本国登録実用新案公報 1994-2009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 (STN), REGISTRY (STN)			
C. 関連すると認められる文献			
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号	
Y	JP 2007-91708 A (日産化学工業株式会社) 2007.04.12, 特許請求の範囲, 実施例 (ファミリーなし)	1-10	
Y	JP 2007-16017 A (日産化学工業株式会社) 2007.01.25, 特許請求の範囲, 実施例 (ファミリーなし)	1-10	
Y	WO 2007/105814 A1 (日産化学工業株式会社) 2007.09.20, 請求の範囲, 実施例 (ファミリーなし)	1-10	
<input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。			
* 引用文献のカテゴリー		の日の後に公表された文献	
「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの		「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの	
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの		「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの	
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)		「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの	
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献		「&」同一パテントファミリー文献	
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願			
国際調査を完了した日 05.01.2009		国際調査報告の発送日 20.01.2009	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/J P) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号		特許庁審査官 (権限のある職員) 福井 悟	4 P 9160
		電話番号 03-3581-1101 内線 3491	

国際調査報告		国際出願番号 PCT/JP2008/072182
C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	WO 2005/085216 A1 (日産化学工業株式会社) 2005.09.15, 請求の範囲, 実施例 & US 2007/0066617 A1 & EP 1731512 A1 & KR 2007010145 A & CN 1930136 A	1-10

フロントページの続き

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	
A 6 1 P 33/00 (2006.01)	A 6 1 P 33/00	1 7 1
A 6 1 P 33/12 (2006.01)	A 6 1 P 33/12	
A 0 1 N 43/36 (2006.01)	A 0 1 N 43/36	C
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 0 1 N 43/653 (2006.01)	A 0 1 N 43/36	B
	A 0 1 N 43/653	H

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

(72) 発明者 池田 栄達

千葉県船橋市坪井町 7 2 2 番地 1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内

(72) 発明者 高橋 寛明

千葉県船橋市坪井町 7 2 2 番地 1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内

(72) 発明者 菰田 充陽

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡 1 4 7 0 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内

F ターム(参考) 4C063 AA01 BB01 CC41 DD04 EE01 EE03

4C069 AB03 BB02 BB38

4C086 AA01 BC06 BC60 GA07 MA01 MA04 NA14 ZB37

4H011 AC01 AC04 BA01 BB09 BB10 BC01 BC03 BC06 BC07 BC09

BC20 DA02 DA15 DA16 DC05 DC06 DD03

【要約の続き】

Xはハロゲン原子、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル等を表し、Zはメチル、 $-NH_2$ 等を表し、 R^1 は $-C(O)R^{1a}$ 等を表し、 R^{1a} は $C_1 \sim C_4$ アルキル等を表し、 R^2 は水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル等を表し、 R^3 は $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル等を表し、 R^4 は水素原子、シアノ、メチル等を表し、mは1、2、3等の整数を表し、nは0又は1の整数を表す。]で表される置換ジヒドロアゾール化合物又はその塩、及びそれらを含む有害生物防除剤。

(注) この公表は、国際事務局(WIPO)により国際公開された公報を基に作成したものである。なおこの公表に係る日本語特許出願(日本語実用新案登録出願)の国際公開の効果は、特許法第184条の10第1項(実用新案法第48条の13第2項)により生ずるものであり、本掲載とは関係ありません。