

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2021-528473

(P2021-528473A)

(43) 公表日 令和3年10月21日 (2021. 10. 21)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 401/14 (2006. 01)	C O 7 D 401/14	4 C O 6 3
C O 7 D 403/04 (2006. 01)	C O 7 D 403/04 C S P	4 H O 1 1
C O 7 D 403/14 (2006. 01)	C O 7 D 403/14	
A O 1 N 43/653 (2006. 01)	A O 1 N 43/653 A	
A O 1 N 47/02 (2006. 01)	A O 1 N 47/02	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 243 頁) 最終頁に続く		

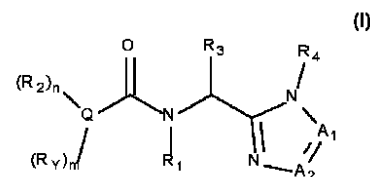
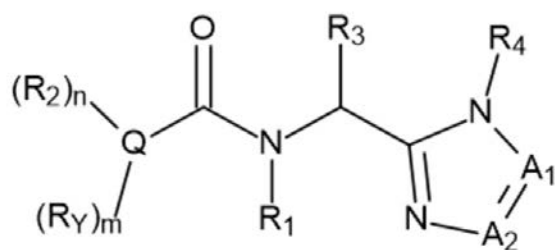
(21) 出願番号	特願2020-573174 (P2020-573174)	(71) 出願人	519295993 シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー
(86) (22) 出願日	令和1年6月27日 (2019. 6. 27)		スイス 4 0 5 8 パーゼル ローゼンタ ールシュトラッセ 6 7
(85) 翻訳文提出日	令和2年12月28日 (2020. 12. 28)	(74) 代理人	100094569 弁理士 田中 伸一郎
(86) 国際出願番号	PCT/EP2019/067266	(74) 代理人	100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦
(87) 国際公開番号	W02020/002563	(74) 代理人	100109070 弁理士 須田 洋之
(87) 国際公開日	令和2年1月2日 (2020. 1. 2)	(74) 代理人	100119013 弁理士 山崎 一夫
(31) 優先権主張番号	18180705. 8	(74) 代理人	100123777 弁理士 市川 さつき
(32) 優先日	平成30年6月29日 (2018. 6. 29)		
(33) 優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁 (EP)		
(31) 優先権主張番号	19155123. 3		
(32) 優先日	平成31年2月1日 (2019. 2. 1)		
(33) 優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁 (EP)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺有害生物活性アゾールーアミド化合物

(57) 【要約】

式 (I)



(式中、置換基は、請求項 1 に定義されるとおりである)

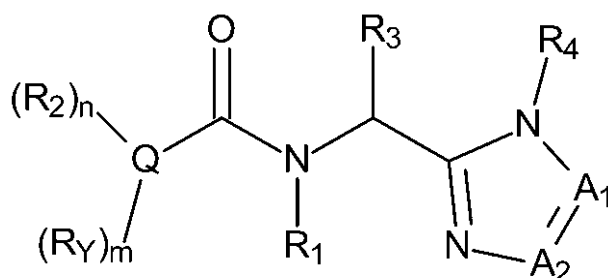
の化合物並びにそれらの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN-オキシドは、殺虫剤として使用され得る。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



I

(式中、

A₁及びA₂は、独立して、C R₅又はNであり；

R₁は、水素、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルキル、アミノカルボニルC₁～C₆アルキル、ヒドロキシカルボニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ニトロアルキル、トリメチルシランC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル；C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₄シクロアルキルーC₁～C₂アルキルー（ここで、前記C₃～C₄シクロアルキルは、1又は2個のハロ原子で任意選択により置換されている）、オキセタンー3－イルーCH₂－又はハロ若しくはC₁～C₃ハロアルキルで任意選択により置換されているベンジルであり；

Qは、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンであり、前記フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンは、R₂（ここで、nは、1又は2である）によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、R_Y（ここで、mは、0、1又は2であり得る）で任意選択により置換されており；

R₂は、それぞれが相互に独立して、R_xから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換されているC₃～C₆シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリール；OR₆；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているピペリジンー2－オンー1－イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているピリジンー2－オンー1－イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているアゼチジンー1－イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているピロリジンー1－イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているC₃～C₆シクロアルキルC₁～C₄アルキル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているC₃～C₆シクロアルキルC₁～C₃アルコキシ；C₁～C₅シアノアルキル；C₁～C₅シアノアルコキシ；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているC₁～C₄アルキルスルホニル；又はR_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているC₁～C₄アルキルスルフィニルであり；

R_Yは、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルチオ、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ、ハロ、NO₂、SF₅、CN、C(O)NH₂、C(O)OH及びC(S)NH₂から選択され；

R₃は、C₁～C₃アルキル又はC₁～C₃ハロアルキルであり；

R₄は、ピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンであり、前記ピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンは、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃アルコキシ、C₃～C₄シクロアルキル、ハロゲン又はヒドロキシから選択される1個の置換基で任意選択により置換されており；

10

20

30

40

50

R_5 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又はジ ($C_1 \sim C_6$ アルコキシ) メチンであり；

R_6 は、それぞれが相互に独立して、 R_x から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換されているフェニル、ベンジル、ヘテロアリール又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；及び

R_x は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 NO_2 、 SF_5 、 CN 、 $CONH_2$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル及び $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルから独立して選択される)

の化合物又は前記式 I の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN-オキシド。

【請求項 2】

R^3 は、前記化合物中においてメチルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

A_1 は、Nであり、 A_2 は、 CR_5 であり、及び R_5 は、H、メチル又は(CH_2CH_2O)₂CH-であり；好ましくは、 R_5 は、Hである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R_4 は、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基から選択される1個の置換基によって任意選択により置換されている2-ピリジン又は2-ピリミジンであり、前記任意選択の置換基は、前記2-ピリジン及び2-ピリミジンについて同一であるか又は異なり得る、請求項 1～3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

R_4 は、2-ピリミジンである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

R_1 は、シクロプロピル- CH_2 -、n-プロピル、 $CH \equiv CCH_2$ -、 $CF_3CH_2CH_2$ -、 FCH_2CH_2 -、 $FCH_2CH_2CH_2$ -、2, 2-ジフルオロシクロプロピル- CH_2 -、2, 2-ジクロロシクロプロピル- CH_2 -、H、Me、 $(Me)_3SiCH_2$ -、 $MeCH_2$ -又は $CNCH_2$ -である、請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R_1 は、シクロプロピル- CH_2 -、 $CH \equiv CCH_2$ -、H又はMeである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

Qは、フェニル、ピリジン又はピリミジンから選択され、前記フェニル、ピリジン又はピリミジンは、 R_2 (ここで、nは、1又は2である) によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、 R_Y (ここで、mは、0、1又は2であり得る) で任意選択により置換されている、請求項 1～7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

Qは、フェニルから選択され、前記フェニル、ピリジン又はピリミジンは、 R_2 (ここで、nは、1又は2である) によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、 R_Y (ここで、mは、0、1又は2であり得る) で任意選択により置換されている、請求項 1～7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

R_2 は、 OR_6 であり、 R_6 は、それぞれが相互に独立して1個の置換基 R_x で任意選択により置換されているフェニル、ベンジル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから選択される、請求項 1～9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

R_x は、異なる R_2 及び R_6 基とは独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 NO_2 、 SF_5 、 CN 、 CO

10

20

30

40

50

NH₂、C(S)NH₂から独立して選択される、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項12】

R_Yは、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ、ハロ、NO₂、SF₅及びCNである、請求項1～11のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項13】

R₂は、それぞれが相互に独立して、R_xから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換されているC₃～C₆シクロアルキル、フェニル及びピラゾリル；OR₆；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているピペリジン-2-オン-1-イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているピリジン-2-オン-1-イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているC₃～C₆シクロアルキルC₁～C₄アルキル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているC₃～C₆シクロアルキルC₁～C₃アルコキシ；C₁～C₅シアノアルキル；又はR_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているC₁～C₄アルキルスルホニルから選択され；及びR_Yは、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルチオ、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ又はハロであり；R₆は、それぞれが相互に独立して、R_xから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換されているフェニル、ベンジル、C₃～C₆シクロアルキルであり；R_xは、異なるR₂及びR₆基とは独立して、ハロゲン、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ及びCNから独立して選択される、請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項14】

請求項1～13のいずれか一項に記載の化合物、1種以上の助剤及び希釈剤並びに任意選択により1種以上の他の有効成分を含む組成物。

【請求項15】

昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、請求項1～13のいずれか一項に記載の化合物又は請求項14に記載の組成物を適用するステップを含み、ただし、手術又は治療によるヒト又は動物の身体の処置の方法及びヒト又は動物の身体に対して実施される診断方法を除く、方法。

【請求項16】

昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃からの植物繁殖材料の保護の方法であって、前記繁殖材料又は前記繁殖材料が植えられている場所を、有効量の、請求項1～13のいずれか一項に記載の化合物又は請求項14に記載の組成物で処理するステップを含む方法。

【請求項17】

請求項1～13のいずれか一項に記載の化合物又は請求項14に記載の組成物を含むか、又はそれで処理されているか若しくはそれに付着されている、種子などの植物繁殖材料。

【請求項18】

寄生生物の防除を、それを必要としている動物内又は上で行うことにおいて使用するための、請求項1～13のいずれか一項に記載の化合物又は請求項14に記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、殺有害生物的に有効である、特に殺虫的に有効なアゾールアミド化合物、

その調製プロセス、これらの化合物を含む組成物及び節足動物、特に昆虫又はダニ目（Acarina）の代表的なものを含む動物有害生物を防除するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

国際公開第2017192385号は、動物（哺乳類及び非哺乳類動物など）において外寄生生物を防除するために用いられる特定のヘテロアリール-1, 2, 4-トリアゾール及びヘテロアリール-テトラゾール化合物を記載している。ここで、新規の殺有害生物活性アゾール-アミド化合物が見出された。

【発明の概要】

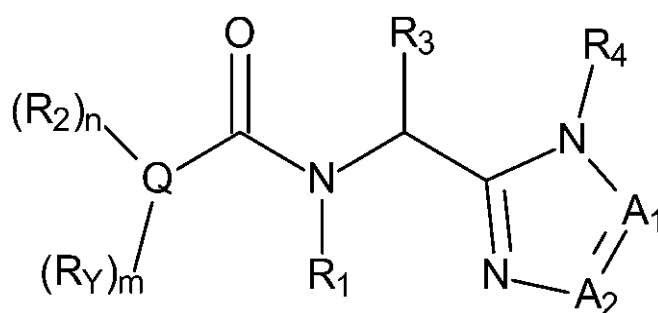
10

【課題を解決するための手段】

【0003】

従って、本発明は、第1の態様において、式I

【化1】



20

（式中、

A₁及びA₂は、独立して、CR₅又はNであり；

R₁は、水素、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルキル、アミノカルボニルC₁～C₆アルキル、ヒドロキシカルボニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ニトロアルキル、トリメチルシランC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル；C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₄シクロアルキル-C₁～C₂アルキル（ここで、C₃～C₄シクロアルキルは、1又は2個のハロ原子で任意選択により置換されている）、オキセタン-3-イル-CH₂-又はハロ若しくはC₁～C₃ハロアルキルで任意選択により置換されているベンジルであり；

30

Qは、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンであり、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンは、R₂（ここで、nは、1又は2である）によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、R_Y（ここで、mは、0、1又は2であり得る）で任意選択により置換されており；

R₂は、それぞれが相互に独立して、R_xから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換されているC₃～C₆シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリール；OR₆；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているピペリジン-2-オン-1-イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているピリジン-2-オン-1-イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているピロリジン-1-イル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているC₃～C₆シクロアルキルC₁～C₄アルキル；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で任意選択により置換されているC₃～C₆シクロアルキルC₁～C₃アルコキシ；C₁～C₅シアノアルキル；C₁～C₅シアノアルコキシ；R_xから独立して選択される1～2個の置換基で

40

50

任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル；又は R_x から独立して選択される 1 ～ 2 個の置換基で任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニルであり；

R_Y は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、ハロ、 NO_2 、 SF_5 、 CN 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 及び $C(S)NH_2$ から選択され；

R_3 は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり；

R_4 は、ピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンであり、ピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンは、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、ハロゲン又はヒドロキシから選択される 1 個の置換基で任意選択により置換されており；

R_5 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又はジ ($C_1 \sim C_6$ アルコキシ) メチンであり；

R_6 は、それぞれが相互に独立して、 R_x から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で任意選択により置換されているフェニル、ベンジル、ヘテロアリール又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；及び

R_x は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 NO_2 、 SF_5 、 CN 、 $CONH_2$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル及び $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルから独立して選択される)

の化合物又は式 I の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及び N-オキシドに関する。

【発明を実施するための形態】

【0004】

少なくとも 1 つの塩基性中心 (basic centre) を有する式 I の化合物は、例えば、酸付加塩、例えば無機強酸、例えば鉱酸、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、亜硝酸、リン酸又はハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカンカルボン酸、例えば酢酸、例えば飽和又は不飽和ジカルボン酸、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸又はフタル酸、例えばヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸又はクエン酸、又は例えば安息香酸との酸付加塩、又は有機スルホン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカン-又はアリールスルホン酸、例えばメタン-又は p-トルエンスルホン酸との酸付加塩を形成することができる。少なくとも 1 つの酸性基を有する式 I の化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩又はマグネシウム塩、又はアンモニア又は有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-又はトリ-低級アルキルアミン、例えばエチル-、ジエチル-、トリエチル-又はジメチルプロピルアミン、又はモノ-、ジ-又はトリヒドロキシー低級アルキルアミン、例えばモノ-、ジ-又はトリエタノールアミンを形成することができる。

【0005】

各事例において、本発明に係る式 (I) の化合物は、遊離形態、N-オキシドとして酸化型又は塩形態であり、例えば農業経済学的に使用可能な塩形態である。

【0006】

N-オキシドは、第三級アミンの酸化型又は窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍 “Heterocyclic N-oxides”, A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991 に記載されている。

10

20

30

40

50

【0007】

本発明に係る式 I の化合物は、塩形成中に形成され得る水和物も含む。

【0008】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合している、1～n個の炭素原子を有する飽和直鎖又は分岐炭化水素ラジカルを指し、例えばラジカルであるメチル、エチル、n-プロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、n-ヘキシル、n-ペンチル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル又は1-エチル-2-メチルプロピルのいずれか1つである。

10

【0009】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合している、1～n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキルラジカルを指し（上記のとおり）、ここで、これらのラジカル中の水素原子のいくつか又はすべては、フッ素、塩素、臭素及び／又はヨウ素によって置換され得、すなわち例えばクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、2, 2-ジフルオロプロピル、2, 3-ジフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、2-ブロモプロピル、3-ブロモプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、3, 3, 3-トリクロロプロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエチル、4-フルオロブチル、4-クロロブチル、4-ブロモブチル又はノナフルオロブチルのいずれか1つである。「 $C_1 \sim C_2$ フルオロアルキル」という用語は、1, 2, 3, 4又は5個のフッ素原子を有する $C_1 \sim C_2$ アルキルラジカルを指し、例えばジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルのいずれか1つであろう。

20

30

【0010】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、1～n個の炭素原子（上記のとおり）を有する直鎖又は分岐飽和アルキルラジカルを指し、すなわち例えばメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、n-ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ又は1, 1-ジメチルエトキシラジカルのいずれか1つである。本明細書において用いられる場合、「ハロ $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」という用語は、アルキルラジカル上の1個以上の水素原子が、同一の又は異なるハロ原子によって置換された $C_1 \sim C_n$ アルコキシラジカル（例としては、トリフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、3-フルオロプロポキシ、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ、4-クロロブトキシが挙げられる）を指す。

40

【0011】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ シアノアルキル」という用語は、1～n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和 $C_1 \sim C_n$ アルキルラジカル（上記のとおり）を指

50

し、ここで、これらのラジカル中の水素原子の 1 個がシアノ基によって置換されており、例えばシアノメチル、2-シアノエチル、2-シアノプロピル、3-シアノプロピル、1-(シアノメチル)-2-エチル、1-(メチル)-2-シアノエチル、4-シアノブチル等である。

【0012】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ シアノアルコキシ」という用語は、1～n 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和 $C_1 \sim C_n$ アルコキシラジカル（上記のとおり）を指し、ここで、これらのラジカル中の水素原子の 1 個がシアノ基によって置換されており、例えばシアノメトキシ、2-シアノエトキシ、2-シアノプロポキシ、3-シアノプロポキシ、1-(シアノメチル)-2-エトキシ、1-(メチル)-2-シアノエトキシ、4-シアノブトキシ等である。

10

【0013】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル」という用語は、シクロプロパン、シクロブタン、シクロプロパン、シクロペンタン及びシクロヘキサンなどの 3～n 員シクロアルキル基を指す。

【0014】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、メチレン又はエチレン基などの 1～n 個の炭素アルキレン基を有する 3～n 員シクロアルキル基を指し、このアルキレン基が分子の残部に結合している。例えば、 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_n$ アルキル基は、置換されており、置換基は、シクロアルキル基及び／又は $C_1 \sim C_n$ アルキル基上にあることが可能である。

20

【0015】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」という用語は、1～n 個の炭素アルコキシ基を有する 3～n 員シクロアルキル基を指し、このアルコキシ基が分子の残部に結合している。例えば、 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_n$ アルコキシ基は、置換されており、置換基は、シクロアルキル基上にある。

【0016】

本明細書において用いられる場合、「アミノカルボニル $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、アルキルラジカルを指し、ここで、ラジカル中の水素原子の 1 個は、CONH₂ 基によって置換されている。

30

【0017】

本明細書において用いられる場合、「ヒドロキシカルボニル $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、ラジカル中の水素原子の 1 個がCOOH基によって置換されているアルキルラジカルを指す。

【0018】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ニトロアルキル」という用語は、アルキルラジカルを指し、ここで、ラジカル中の水素原子の 1 個は、NO₂ 基によって置換されている。

【0019】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル部分を指す。

40

【0020】

本明細書において用いられる場合、「トリメチルシラン $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、アルキルラジカルを指し、ここで、ラジカル中の水素原子の 1 個は、-Si(CH₃)₃ 基によって置換されている。

【0021】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ アルケニル」という用語は、2～n 個の炭素原子及び 1 又は 2 つの二重結合を有する直鎖又は分岐アルケニル鎖を指し、例えばエテニル、プロプ-1-エニル、ブタ-2-エニルである。

【0022】

50

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ ハロアルケニル」という用語は、同一であるか又は異なり得る1個以上のハロ原子で置換されている $C_2 \sim C_n$ アルケニル部分を指す。

【0023】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ アルキニル」という用語は、2～n個の炭素原子及び1つの三重結合を有する直鎖又は分岐アルキニル鎖を指し、例えばエチニル、プロプ-2-イニル、ブタ-3-イニルである。

【0024】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ ハロアルキニル」という用語は、同一であるか又は異なり得る1個以上のハロ原子で置換されている $C_2 \sim C_n$ アルキニル部分を指す。

10

【0025】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルキルスルフィニル」という用語は、硫黄原子を介して結合しており、且つ硫黄が部分酸化型($-S(O)C_1 \sim C_n$ アルキル)である、1～n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキルラジカルを指す。すなわち、例えばメチル $S(O)-$ 、エチル $S(O)-$ 、n-プロピル $S(O)-$ 、1-メチルエチル $S(O)-$ 、ブチル $S(O)-$ 、1-メチルプロピル $S(O)-$ 、2-メチルプロピル $S(O)-$ 及び1, 1-ジメチルエチル $S(O)-$ のいずれか1つである。

【0026】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルキルスルホニル」という用語は、硫黄原子を介して結合しており、且つ硫黄が完全酸化型($-S(O)_2C_1 \sim C_n$ アルキル)である、1～n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキルラジカルを指す。すなわち、例えばメチル $S(O)_2-$ 、エチル $S(O)_2-$ 、n-プロピル $S(O)_2-$ 、1-メチルエチル $S(O)_2-$ 、ブチル $S(O)_2-$ 、1-メチルプロピル $S(O)_2-$ 、2-メチルプロピル $S(O)_2-$ 及び1, 1-ジメチルエチル $S(O)_2-$ のいずれか1つである。

20

【0027】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ シアノアルキル」という用語は、1～n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和 $C_1 \sim C_n$ アルキルラジカル(上記のとおり)を指し、ここで、これらのラジカル中の水素原子の1個は、シアノ基によって置換されており、例えばシアノメチル、2-シアノエチル、2-シアノプロピル、3-シアノプロピル、1-(シアノメチル)-2-エチル、1-(メチル)-2-シアノエチル、4-シアノブチル等である。

30

【0028】

ハロゲンは、一般に、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素である。これは、対応して、ハロアルキルなどの他の意味と組み合わせられたハロゲンにも適用される。

【0029】

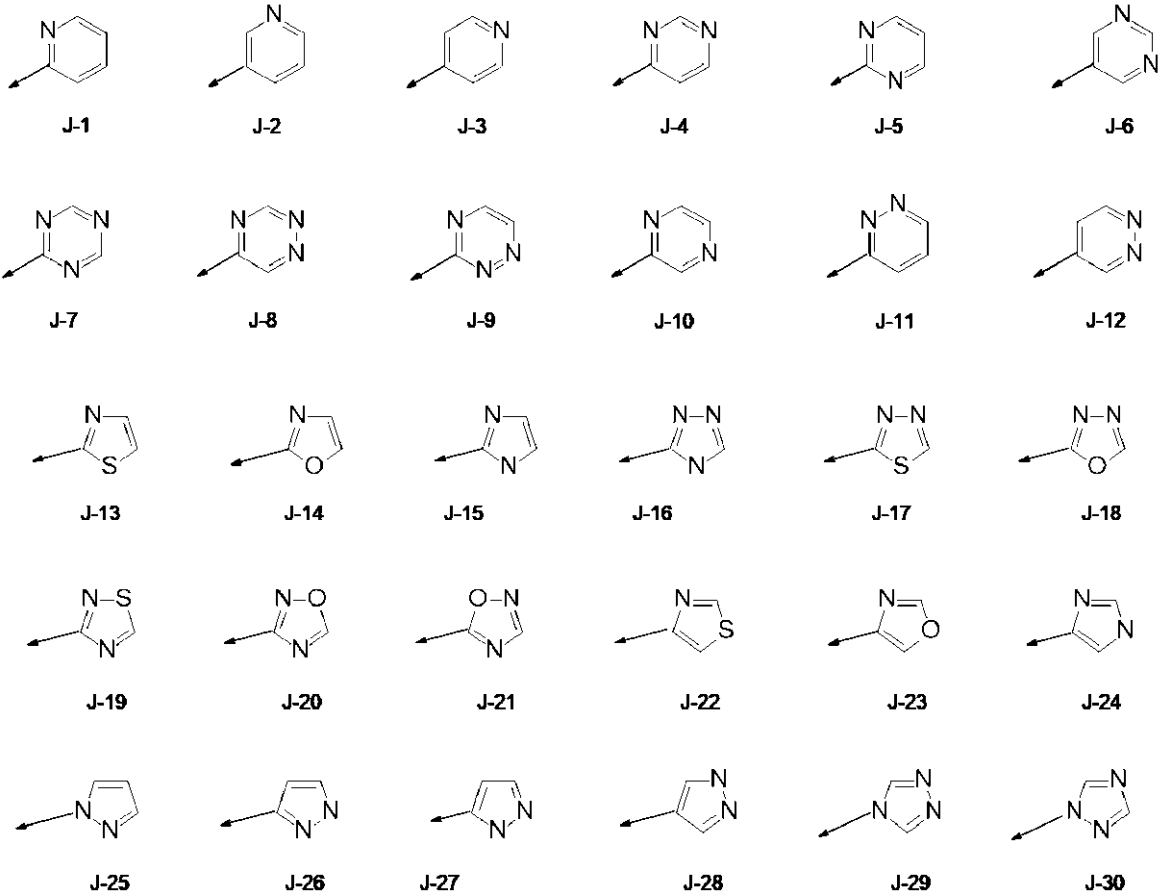
本明細書において用いられる場合、「ヘテロアリール」という用語は、N、O及びSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する5又は6員芳香族単環式環を指す。例は、以下のスキームAに示すヘテロアリールJ1～J30である。好ましいヘテロアリールは、ピリジル、ピリミジル及びピラゾリルである。

40

【0030】

スキームA：ヘテロアリールJ-1～J-30：

【化 2】



10

20

Q及びR₄に係るピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジン基（無置換又は置換されたもの）は、それぞれの環における炭素原子を介して化合物の残部に結合している。

【0031】

本明細書において用いられる場合、「防除する」という用語は、植物又は植物由来産物に対する被害が低減するように有害生物の数を低減させ、有害生物を駆除し、且つ／又はさらなる有害生物による被害を予防することを指す。

30

【0032】

本明細書において用いられる場合、「有害生物」という用語は、農業、園芸、林業、植物由来産物（果実、穀粒及びひき材など）の保管において見られる昆虫及び軟体動物；並びに人工構造物の被害に関連する有害生物を指す。有害生物という用語は、有害生物のライフサイクルにおけるすべてのステージを包含する。

【0033】

本明細書において用いられる場合、「有効量」という用語は、単一回又は複数回の適用で所望の効果がもたらされる化合物又はその塩の量を指す。

【0034】

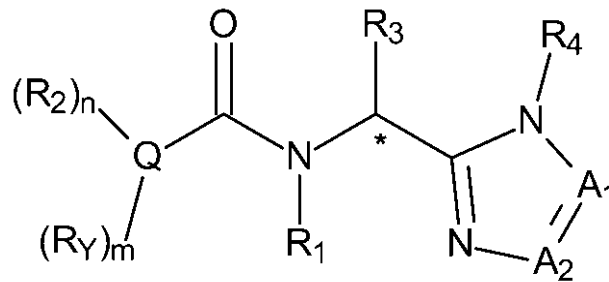
有効量は、公知の技術の使用により及び類似する状況下で得られる結果を観察することにより、当業者によって容易に判定される。有効量の判定では、特に、これらに限定されないが、適用される植物の種類又は植物に由来する産物の種類；防除される有害生物及びそのライフサイクル；適用される特定の化合物；適用の種類；並びに他の関連する状況を含む多数の要因が考慮される。

40

【0035】

当業者が理解するであろうとおり、式 I の化合物は、以下の構造中においてアスタリスクで示すステレオジェン中心を含む。

【化 3】



10

I*

式中、 R_1 、 Q 、 R_Y 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 A_1 、 A_2 、 m 及び n は、第1の態様において定義されているとおりである。

【0036】

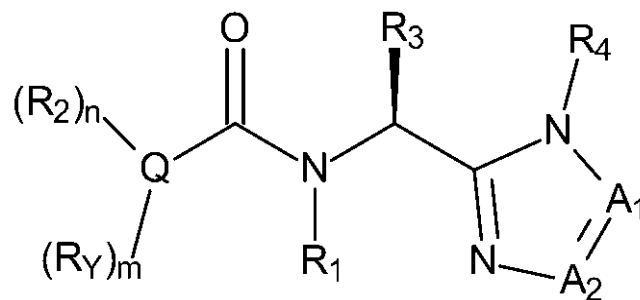
本発明は、ラセミ化合物及び個々の鏡像異性体の両方を包含する。好ましい立体化学を有する化合物を以下に示す。

20

【0037】

特に好ましい本発明の化合物は、式 I' a :

【化 4】



30

I'a

(式中、 R_1 、 Q 、 R_Y 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 A_1 、 A_2 、 m 及び n は、第1の態様において定義されているとおりである)

の化合物並びに式 (I' a) の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN-オキシドである。

【0038】

40

本明細書において用いられる場合、「任意選択により置換されている」という用語は、言及されている基が無置換であるか、又は記載されている置換基によって置換されていることを意味し、例えば、「 R_x で任意選択により置換されているピリジン-2-オン-1-イル」は、ピリジン-2-オン-1-イル及び R_x で置換されているピリジン-2-オン-1-イルを意味する。

【0039】

本発明に係る実施形態を以下に記載のとおり提供する。

【0040】

本発明の各態様の一実施形態において、 Q 上の置換基 R_2 及び R_Y (存在する場合)は、カルボニル($C=O$)基に結合している炭素に隣接する炭素に結合していない。

50

【0041】

本発明の各態様の一実施形態において、Qは、

A. フェニル、ピリジン又はピリミジンであり、フェニル、ピリジン又はピリミジンは、1又は2個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、1又は2個の R_Y で任意選択によりさらに置換され得るか；又は

B. フェニル又はピリジンであり、フェニル又はピリジンは、1又は2個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、1又は2個の R_Y で任意選択によりさらに置換され得るか；又は

C. フェニル又はピリジンであり、フェニル又はピリジンは、1又は2個の R_2 によって置換されているか；又は

D. フェニルであり、フェニルは、1又は2個の R_2 によって置換されているか；又は

E. ピリジンであり、ピリジンは、1又は2個の R_2 によって置換されているか；又は

F. フェニル又はピリジンであり、フェニル又はピリジンは、1又は2個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、1又は2個の R_Y で任意選択によりさらに置換され得るか；又は

G. フェニル、ピリジン-2-イル、ピリジン-4-イル、ピリジン-3-イル又はピリミジン-5-イルであり、フェニル、ピリジン-2-イル、ピリジン-4-イル、ピリジン-3-イル又はピリミジン-5-イルは、1又は2個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、1又は2個の R_Y で任意選択によりさらに置換され得るか；又は

H. フェニル、ピリジン-2-イル又はピリジン-4-イルであり、フェニル、ピリジン-2-イル又はピリジン-4-イルは、1又は2個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、1又は2個の R_Y で任意選択によりさらに置換され得るか；又は

I. フェニル、ピリジン-2-イル又はピリジン-4-イルであり、フェニル、ピリジン-2-イル又はピリジン-4-イルは、1個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、1個の R_Y で任意選択によりさらに置換され得る。

【0042】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_2 は、

A. J-1~J-30から選択される $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリアルであって、これらのそれぞれは、相互に独立して、1~3個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリアル； OR_6 ；ピペリジン-2-オン-1-イル；ピリジン-2-オン-1-イル； R_x で任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル；ピロリジン-1-イル； R_x で任意選択により置換されている $C_3\sim C_6$ シクロアルキル $C_1\sim C_4$ アルキル； R_x で任意選択により置換されている $C_3\sim C_6$ シクロアルキル $C_1\sim C_3$ アルコキシ； $C_1\sim C_5$ シアノアルキル； $C_1\sim C_5$ シアノアルコキシ； R_x によって任意選択により置換されている $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル；又は R_x によって任意選択により置換されている $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニルであるか；又は

B. J-1及びJ-25から選択される $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリアルであって、これらのそれぞれは、相互に独立して、1~3個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリアル； OR_6 ；ピペリジン-2-オン-1-イル；ピリジン-2-オン-1-イル； R_x で任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル；ピロリジン-1-イル； R_x で任意選択により置換されている $C_3\sim C_6$ シクロアルキル $C_1\sim C_4$ アルキル； R_x で任意選択により置換されている $C_3\sim C_6$ シクロアルキル $C_1\sim C_3$ アルコキシ； $C_1\sim C_5$ シアノアルキル； $C_1\sim C_5$ シアノアルコキシ； R_x によって任意選択により置換されている $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル；又は R_x によって任意選択により置換されている $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニルであるか；又は

C. それぞれが相互に独立して1~3個の置換基 R_x で任意選択により置換されている

$C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、フェニル又はピラゾリル； OR_6 ；ピペリジン-2-オン-1-イル；ピリジン-2-オン-1-イル； R_x で任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル；ピロリジン-1-イル； R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキル； R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_3$ アルコキシ； $C_1 \sim C_5$ シアノアルキル； $C_1 \sim C_5$ シアノアルコキシ； R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル；又は R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニルであるか；又は

D. それぞれが相互に独立して1～2個の置換基 R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、フェニル又はピラゾリル； OR_6 ； R_x で任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル； R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキル； R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_3$ アルコキシ； R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル；又は R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニルであるか；又は

E. 1～2個の置換基 R_x で置換されている $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル； OR_6 ； R_x で置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ 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； $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル； R_x により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル；又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル；又は R_x により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニルであるか；又は

F. $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は1若しくは2個のハロゲンで置換されている $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルメチル、1又は2個のハロゲンで置換されている $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルメチル、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル；1～3個のハロゲンで置換されている $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニルであるか；又は

G. シクロプロピル、1又は2個のハロゲン、メチル、トリフルオロメチルで置換されているシクロプロピル、1又は2個のハロゲン、トリフルオロメチルで置換されているシクロプロピルメチル、1～3個のハロゲンで置換されている $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニルであるか；又は

H. 1又は2個のフッ素、メチル、トリフルオロメチル、シアノで置換されているシクロプロピル；1又は2個のフッ素で置換されているシクロプロピルメチル；トリフルオロメチルスルホニルであり；及び

R_2 に係る各実施形態A～Hにおいて、 n は、1若しくは2であるか、又は n は、1である。

【0043】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_6 は、

A. J-1～J-12から選択されるヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルであって、これらのそれぞれは、相互に独立して1個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、ヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルであるか；又は

B. $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又は1個の置換基 R_x で置換されている $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルである。

【0044】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_y は、

A. $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、ハロ、 NO_2 、 SF_5 及びCNであるか；又は

B. $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ及びハロであるか；又は

C. $C_1 \sim C_3$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ フルオロアルコキシ、塩素及びフッ素であり；及び

上記の各実施形態A～Cにおいて、 m は、0、1若しくは2であるか；又は m は、0若しくは1であるか；又は m は、1である。

【0045】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_x は、

A. ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 NO_2 、 SF_5 、 CN 、 $CONH_2$ 、 $C(S)NH_2$ から独立して選択されるか；又は

B. ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ及び CN から独立して選択されるか；又は

C. フルオロ、 $C_1 \sim C_3$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ フルオロアルコキシ及び CN から独立して選択される。

【0046】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_1 は、

A. H ； CN 、 $CONH_2$ 、 $COOH$ 、 NO_2 及び $-Si(CH_3)_3$ から選択される1個の置換基で任意選択により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル； $C_2 \sim C_6$ アルケニル； $C_2 \sim C_6$ アルキニル； $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル； $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキル-（ここで、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル-は、1又は2個のハロ原子で任意選択により置換されている）；オキセタン-3-イル- CH_2- ；又はハロ若しくは $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルで任意選択により置換されているベンジルであるか；又は

B. H ； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル； CN 若しくは $-Si(CH_3)_3$ で任意選択により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル； $C_3 \sim C_6$ アルキニル； $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキル（ここで、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル-は、1又は2個のハロ原子で任意選択により置換されている）；オキセタン-3-イル- CH_2- ；又はハロで任意選択により置換されているベンジルであるか；又は

C. H 、 $C_1 \sim C_6$ 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-（ここで、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル-は、1又は2個のハロ原子で任意選択により置換されている）又はオキセタン-3-イル- CH_2- であるか；又は

D. H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキルであるか；

E. H ； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル； CN 又は $-Si(CH_3)_3$ で任意選択により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキル； $C_3 \sim C_6$ アルキニル； $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキル（ここで、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル-は、1又は2個のハロ原子で任意選択により置換されている）であるか；又は

F. H ； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル； $C_1 \sim C_6$ アルキル； $C_3 \sim C_6$ アルキニル； $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキル（ここで、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル-は、1又は2個のハロ原子で任意選択により置換されている）であるか；又は

G. シクロプロピル- CH_2- 、 n -プロピル、 $CH \equiv CCH_2-$ 、 $CF_3CH_2CH_2-$ 、 FCH_2CH_2- 、 $FCH_2CH_2CH_2-$ 、2, 2-ジフルオロシクロプロピル- CH_2- 、2, 2-ジクロロシクロプロピル- CH_2- 、 H 、 CH_3 、 $(CH_3)_3SiCH_2-$ 、 CH_3CH_2- 又は $CNCH_2-$ であるか；又は

H. シクロプロピル- CH_2- 、 n -プロピル、 $CH \equiv CCH_2-$ 、 $CF_3CH_2CH_2-$ 、 FCH_2CH_2- 、 $FCH_2CH_2CH_2-$ 、2, 2-ジフルオロシクロプロピル- CH_2- 又は2, 2-ジクロロシクロプロピル- CH_2- であるか；又は

I. シクロプロピル- CH_2- 、 n -プロピル、 $CH \equiv CCH_2-$ 、 $CF_3CH_2CH_2-$ 、 FCH_2CH_2- 、 $FCH_2CH_2CH_2-$ 、2, 2-ジフルオロシクロプロピル- CH_2- 、 H 、 CH_3 、 $(CH_3)_3SiCH_2-$ 又は CH_3CH_2- であるか；又は

J. シクロプロピル- CH_2- 、 n -プロピル、 $CH \equiv CCH_2-$ 、 $CF_3CH_2CH_2-$ 、 FCH_2CH_2- 、 $FCH_2CH_2CH_2-$ 、2, 2-ジフルオロシクロプロピル- CH_2- であるか；又は

K. シクロプロピル- CH_2- 、 n -プロピル、 $CH \equiv CCH_2-$ 、 $CF_3CH_2CH_2-$ 、 FCH_2CH_2- 又は $FCH_2CH_2CH_2-$ であるか；又は

L. シクロプロピル- CH_2- 、 $CH \equiv CCH_2-$ 、 H 又は CH_3 であるか；又は

M. $CH=C-CH_2-$ 又はシクロプロピル- CH_2- であるか；又は

10

20

30

40

50

N. シクロプロピル-CH₂-である。

【0047】

本発明の各態様の一実施形態において、R₃は、

A. C₁~C₃アルキル又はC₁~C₃ハロアルキルであるか；又は

B. メチルである。

【0048】

本発明の各態様の一実施形態において、A₁及びA₂は、以下のとおりである。

A. A₁は、Nであり、及びA₂は、CR₅であり、R₅は、H、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₃~C₄シクロアルキル、C₁~C₃アルコキシ、C₃~C₄アルコキシC(O)-又は(C₁~C₃アルコキシ)₂CHであるか；又は

B. A₁は、Nであり、及びA₂は、CR₅であり、R₅は、H、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃アルコキシC(O)-又は(C₁~C₃アルコキシ)₂CH-であるか；又は

C. A₁は、Nであり、及びA₂は、CR₅であり、R₅は、H、C₁~C₃アルキル又は(C₁~C₃アルコキシ)₂CH-であるか；又は

D. A₁は、Nであり、及びA₂は、CR₅であり、R₅は、H又はメチルであるか；又は

E. A₁は、Nであり、及びA₂は、CR₅であり、R₅は、Hである。

【0049】

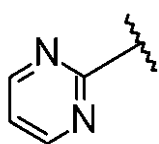
本発明の各態様の一実施形態において、R₄は、

A. それぞれがC₁~C₃アルコキシ又はハロで任意選択により置換されている2-ピリジン、2-ピリミジン、2-ピラジン又は2-ピリダジンであるか；

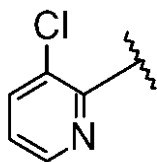
B. それぞれがC₁~C₃アルコキシ又はハロで任意選択により置換されている2-ピリジン又は2-ピリミジンであるか；又は

C. Y₁~Y₃

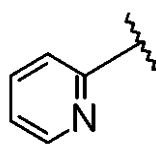
【化5】



Y₁



Y₂



Y₃

であるか；

D. 2-ピリジン（すなわちY₃）又は2-ピリミジン（すなわちY₁）から選択されるか；又は

E. 2-ピリミジンである。

【0050】

本発明の各態様の一実施形態において、R₅は、

A. 水素、ハロゲン、CN、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₃~C₄シクロアルキル、C₁~C₃アルコキシ又はC₁~C₃ハロアルコキシであるか；又は

B. 水素、ハロゲン、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₃~C₄シクロアルキル、C₁~C₃アルコキシ又はC₁~C₃ハロアルコキシであるか；又は

C. 水素、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃ハロアルコキシ、C₁~C₃アルコキシ又はC₃~C₄シクロアルキルであるか；又は

D. 水素、ハロゲン、C₁~C₃ハロアルキル又はC₁~C₃アルコキシであるか；又は

E. 水素、C₁~C₃ハロアルキル又はC₁~C₃アルコキシであるか；又は

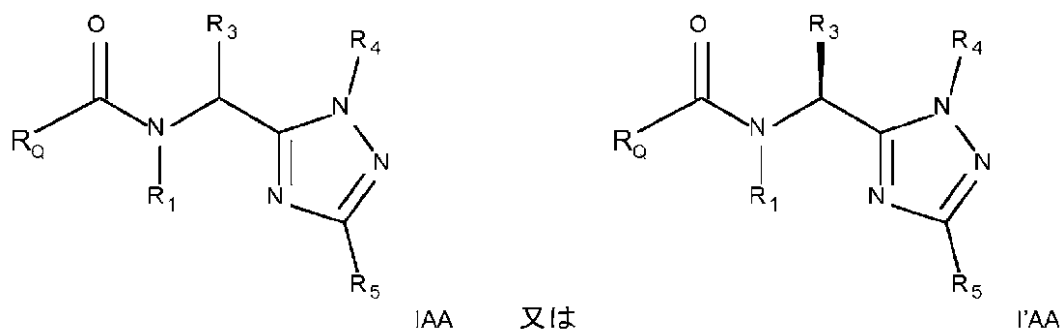
F. 水素、メチル又は(CH₂CH₂O)₂CH-であるか；又は

G. 水素又はメチルであるか；

H. 水素である。

【0051】

一実施形態において、式 I の化合物は、
【化 6】



10

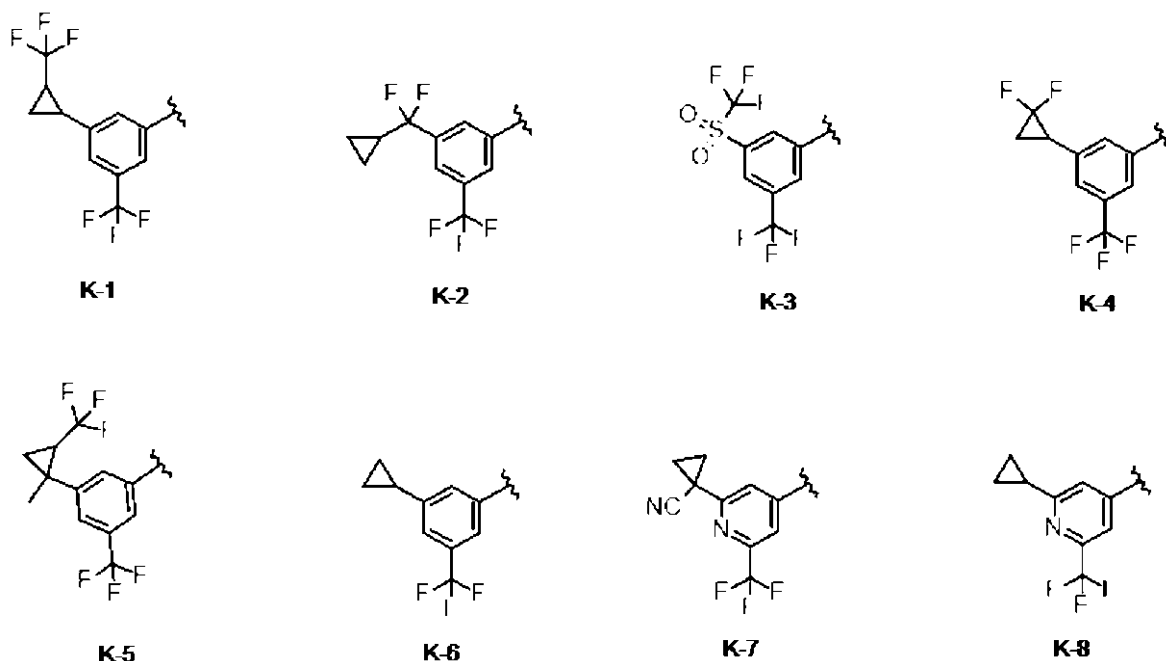
として表すことが可能であり、式中、 R_1 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は、第 1 の態様において定義されているとおりであり、 R_Q は、1 又は 2 個の置換基 R_2 を含有し、且つ 1 又は 2 個の置換基 R_Y を任意選択により含有する（第 1 の態様に定義されているとおり）基 Q に対応する。

【0052】

本発明の各態様の一実施形態において、 R_Q は、K-1～K-8 から選択される（式中、波線は、化合物の残部に対する接続点／結合点を表す）。

【化 7】

20



30

【0053】

従って、本発明は、すべての組み合わせ／各順列において、上記に定義されているとおり、置換基 R_1 、Q、 R_Y 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 を有する式 I 又は式 I' a の化合物を利用可能にする。従って、例えば、 R_1 が実施形態 F（すなわち H； $C_1\sim C_6$ ハロアルキル； $C_1\sim C_6$ アルキル； $C_3\sim C_6$ アルキニル； $C_3\sim C_4$ シクロアルキル- $C_1\sim C_2$ アルキル（ここで、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキルは、1 又は 2 個のハロ原子で任意選択により置換されている））であり、 R_3 が実施形態 B（すなわちメチル）であり、 R_4 が実施形態の第 1 の態様（すなわちピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンであり、ここで、ピリジン、ピリミジン、ピラジン又はピリダジンは、 $C_1\sim C_3$ アルキル、 $C_1\sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_3$ アルコキシ、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、ハロゲン又はヒドロキシルから選択される 1 個の置換基で任意選択により置換されている）であり、 A_1 及び A_2 が実施形態 D（すなわち、 A_1 は、N であり、及び A_2 は、 CR_5 であり、 R_5 は、H 又はメチルであ

40

50

る)であり; Qが実施形態B(すなわちフェニル又はピリジンであり、フェニル又はピリジンは、1又は2個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、1又は2個の R_Y で任意選択によりさらに置換され得る)であり、 R_2 が実施形態D(すなわち、 R_2 は、それぞれが相互に独立して1~2個の置換基 R_x で任意選択により置換されている $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはピラゾリル; OR_6 ; R_x で任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル; R_x で任意選択により置換されている $C_3\sim C_6$ シクロアルキル $C_1\sim C_4$ アルキル; R_x で任意選択により置換されている $C_3\sim C_6$ シクロアルキル $C_1\sim C_3$ アルコキシ; R_x によって任意選択により置換されている $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル;又は R_x によって任意選択により置換されている $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニルであり;及びnは、1又は2である)であり、 R_6 が実施形態A(すなわちJ-1~J-12から選択されるヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキルであって、これらのそれぞれは、相互に独立して1個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、ヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル)であり、 R_x が実施形態B(すなわちハロゲン、 $C_1\sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_3$ ハロアルコキシ及びCNから独立して選択される)であり、及び R_Y が第1の態様の実施形態(すなわち $C_1\sim C_3$ アルキル、 $C_1\sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_3$ アルコキシ、 $C_1\sim C_3$ ハロアルコキシ、ハロ、 NO_2 、 SF_5 、CN、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)OH$ 及び $C(S)NH_2$ であり;及びmは、0、1又は2である)である、式Iの化合物が利用可能になる。

10

【0054】

20

さらなる実施形態において、式I又は式I' aの化合物は、水素、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル- $C_1\sim C_2$ アルキル-としての R_1 ; $C_1\sim C_3$ アルキルとしての R_3 ; 環とは独立して、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル及びハロで任意選択により置換されているフェニル、ピリジン又はピリミジンとしての R_4 ; 環の種類とは独立して、1又は2個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、1又は2個の R_Y によって任意選択によりさらに置換され得るフェニル又はピリジンとしてのQ; J-1~J-30から選択される $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリールであって、これらのそれぞれは、相互に独立して、1~3個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリール; OR_6 ; ピペリジン-2-オン-1-イル; ピリジン-2-オン-1-イル; R_x で任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル; ピロリジン-1-イル; R_x で任意選択により置換されている $C_3\sim C_6$ シクロアルキル $C_1\sim C_4$ アルキル; R_x で任意選択により置換されている $C_3\sim C_6$ シクロアルキル $C_1\sim C_3$ アルコキシ; $C_1\sim C_5$ シアノアルキル; $C_1\sim C_5$ シアノアルコキシ; R_x によって任意選択により置換されている $C_1\sim C_4$ アルキルスルホニル;又は R_x によって任意選択により置換されている $C_1\sim C_4$ アルキルスルフィニルとしての R_2 ; J-1~J-12から選択されるヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキルであって、これらのそれぞれは、相互に独立して、1個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、ヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキルとしての R_6 ; ハロゲン、 $C_1\sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_3$ ハロアルコキシ及びCNから独立して選択されるものとしての R_x ; $C_1\sim C_3$ ハロアルキル及びハロとしての R_Y ; Nとしての A_1 ; CR_5 (ここで、 R^5 は、Hである)としての A_2 を有する。

30

40

【0055】

さらなる実施形態において、式I又は式I' aの化合物は、水素、 $C_1\sim C_3$ アルキル、 $C_2\sim C_3$ アルキニル、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル- $C_1\sim C_2$ アルキル-としての R_1 ; $C_1\sim C_3$ アルキルとしての R_3 ; フェニル、ピリジン又はピリミジンとしての R_4 ; 環の種類とは独立して、1又は2個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、ハロゲン及びトリフルオロメチルから独立して選択される1又は2個で任意選択によりさらに置換され得るフェニル又はピリジンとしてのQ; J-1~J-30から選択される $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリールであって、これらのそれぞれは

50

、相互に独立して、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ及びCNから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換されている、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリール； OR_6 ；ピペリジン-2-オン-1-イル；ピリジン-2-オン-1-イル；ハロゲン及びトリフルオロメチルで任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル； $C_1 \sim C_5$ シアノアルキル；ハロゲン、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ及びCNで任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキル；ハロゲン、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ及びCNで任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_3$ アルコキシ； $C_1 \sim C_5$ シアノアルキル； $C_1 \sim C_5$ シアノアルコキシ；ハロゲン及びトリフルオロメチルにより任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル；又はハロゲン及びトリフルオロメチルにより任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニルとしての R_2 ； $J-1 \sim J-12$ から選択されるヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルであって、これらのそれぞれは、相互に独立して、1個の置換基ハロゲン及びトリフルオロメチルで任意選択により置換されている、ヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルとしての R_6 ；Nとしての A_1 ；及び CR_5 （ここで、 R_5 は、Hである）としての A_2 を有する。

10

【0056】

さらなる実施形態において、式I又は式I' aの化合物は、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキル-としての R_1 ； $C_1 \sim C_3$ アルキルとしての R_3 ；フェニル、ピリジン又はピリミジンとしての R_4 ；環の種類とは独立して、1又は2個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、ハロゲン及びトリフルオロメチルから独立して選択される1又は2個によって置換されているフェニル又はピリジンとしてのQ； $J-1$ 及び $J-25$ から選択される $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリールであって、これらのそれぞれは、相互に独立して、1～3個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、フェニル若しくはヘテロアリール； OR_6 ；ピペリジン-2-オン-1-イル；ピリジン-2-オン-1-イル； R_x で任意選択により置換されているアゼチジン-1-イル；ピロリジン-1-イル； R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキル； R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_3$ アルコキシ； $C_1 \sim C_5$ シアノアルキル； $C_1 \sim C_5$ シアノアルコキシ； R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル；又は R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニルとしての R_2 ； $J-1 \sim J-12$ から選択されるヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルであって、これらのそれぞれは、相互に独立して、1個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、ヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルとしての R_6 ；ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ及びCNから独立して選択されるものとしての R_x ；Nとしての A_1 ；及び CR_5 （ここで、 R_5 は、Hである）としての A_2 を有する。

20

30

【0057】

さらなる実施形態において、式I又は式I' aの化合物は、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキル-としての R_1 ； $C_1 \sim C_3$ アルキルとしての R_3 ；フェニル、ピリジン又はピリミジンとしての R_4 ；1個の R_2 によって置換されており、且つ環の種類とは独立して、ハロゲン又はトリフルオロメチルからの1個により置換されているフェニル又はピリジンとしてのQ； $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又はフェニルであって、これらのそれぞれは、相互に独立して、1～3個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル又はフェニル； OR_6 ； R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキル； R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_3$ アルコキシ； $C_1 \sim C_5$ シアノアルキル； $C_1 \sim C_5$ シアノアルコキシ； R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル；又は R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキル

40

50

スルフィニルとしての R_2 ; $J-1 \sim J-12$ から選択されるヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルであって、これらのそれぞれは、相互に独立して、1個の置換基 R_x で任意選択により置換されている、ヘテロアリール、フェニル、ベンジル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルとしての R_6 ; ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ及びCNから独立して選択されるものとしての R_x ; Nとしての A_1 ; 及び CR_5 (ここで、 R_5 は、Hである) としての A_2 を有する。

【0058】

さらなる実施形態において、式 I 又は式 I' a の化合物は、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキル-としての R_1 ; $C_1 \sim C_3$ アルキルとしての R_3 ; フェニル、ピリジン又はピリミジンとしての R_4 ; 1個の R_2 によって置換されており、且つ1個のトリフルオロメチル基によって置換されているフェニル又はピリジンとしての Q ; 1~3個の置換基 R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル ; R_x で任意選択により置換されている $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $C_1 \sim C_4$ アルキル ; $C_1 \sim C_5$ シアノアルキル ; R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル ; 又は R_x によって任意選択により置換されている $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニルとしての R_2 ; ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ及びCNから独立して選択されるものとしての R_x ; Nとしての A_1 ; 及び CR_5 (ここで、 R_5 は、Hである) としての A_2 を有する。

【0059】

さらなる実施形態において、式 IAA 又は I' AA の化合物は、水素、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_2$ アルキル-としての R_1 ; $C_1 \sim C_3$ アルキルとしての R_3 ; フェニル、ピリジン又はピリミジンとしての R_4 ; Nとしての A_1 ; CR_5 (ここで、 R_5 は、Hである) としての A_2 ; 及び $K-1 \sim K-8$ から選択されるものとしての R_Q を有する。

【0060】

第2の態様では、本発明は、第1の態様において定義されている化合物、1種以上の助剤及び希釈剤並びに任意選択により1種以上の他の有効成分を含む組成物を利用可能にする。

【0061】

第3の態様では、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法を利用可能にし、これは、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、第1の態様において定義されている化合物又は第2の態様において定義されている組成物を適用するステップを含む。一実施形態において、この方法は、手術又は治療によるヒト又は動物の身体の処置の方法及びヒト又は動物の身体に対して実施される診断方法を除く。

【0062】

第4の態様では、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃からの植物繁殖材料の保護の方法を利用可能にし、これは、繁殖材料又は繁殖材料が植えられている場所を、有効量の、第1の態様において定義されている化合物又は第2の態様において定義されている組成物で処理するステップを含む。

【0063】

第5の態様では、本発明は、第1の態様において定義されている化合物又は第2の態様において定義されている組成物を含むか、又はそれで処理されているか若しくはそれに付着されている、種子などの植物繁殖材料を利用可能にする。

【0064】

さらなる態様において、本発明は、寄生生物の防除を、それを必要としている動物内又は上で行う方法であって、有効量の、第1の態様の化合物を投与するステップを含む方法を提供する。本発明は、外寄生生物の防除を、それを必要としている動物上で行う方法であって、有効量の、第1の態様の化合物を投与するステップを含む方法をさらに提供する。本発明は、外寄生生物によって感染する病害を予防及び／又は処置する方法であって、

それを必要としている動物に、有効量の、第 1 の態様の化合物を投与するステップを含む方法をさらに提供する。

【0065】

さらなる態様において、本発明は、

・寄生生物の防除を、それを必要としている動物内又は上で行うことにおける使用；又は

・外寄生生物の防除を、それを必要としている動物上で行うことにおける使用；又は

・外寄生生物によって感染する病害の予防及び／又は処置

のための、第 1 の態様において定義されている化合物又は第 2 の態様において定義されている組成物を提供する。

10

【0066】

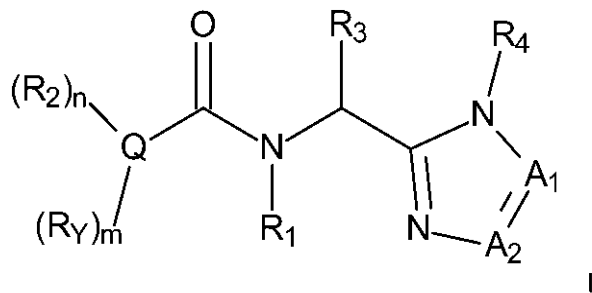
式 I の化合物は、公知の方法に従うことにより、当業者によって調製可能である。より具体的には、式 I 及び I ' a の化合物及び中間体は、従って、スキーム及び実施例において以下に記載のとおり調製可能である。特定のステレオジェン中心は、簡潔さのために不特定のままとされており、決してスキームによる教示を限定することを意図されていない。

【0067】

式 I の化合物を調製するためのプロセスは、当業者に公知の方法によって実施可能である。式 I

【化 8】

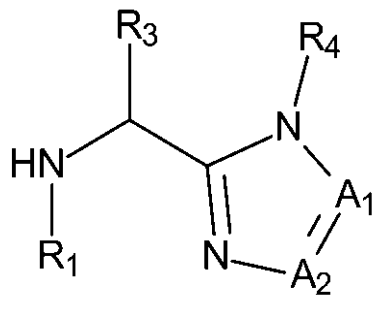
20



の化合物は、式 I I

30

【化 9】

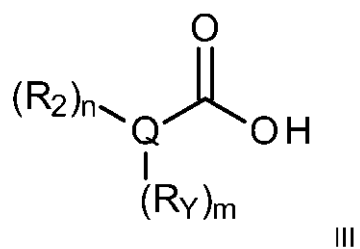


40

(式中、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、式 I の化合物について定義されているとおりである)

のアミンと、式 I I I

【化 10】

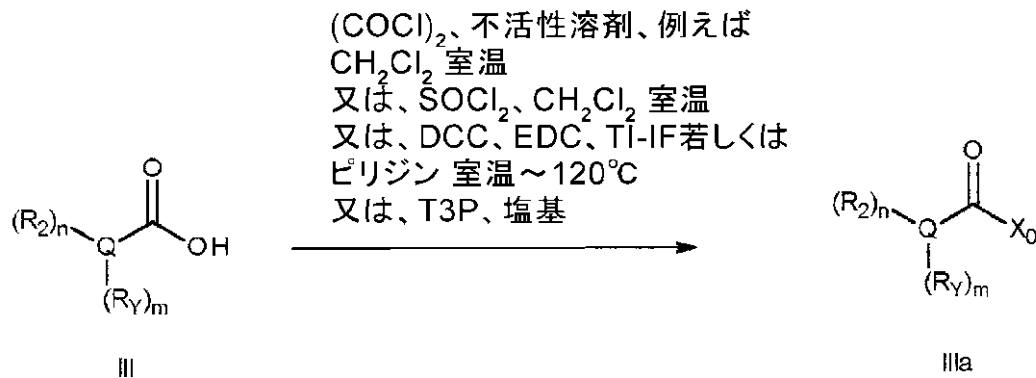


(式中、Q、 R_2 、 R_Y 、m及びnは、式 I の化合物について定義されているとおりである 10
)

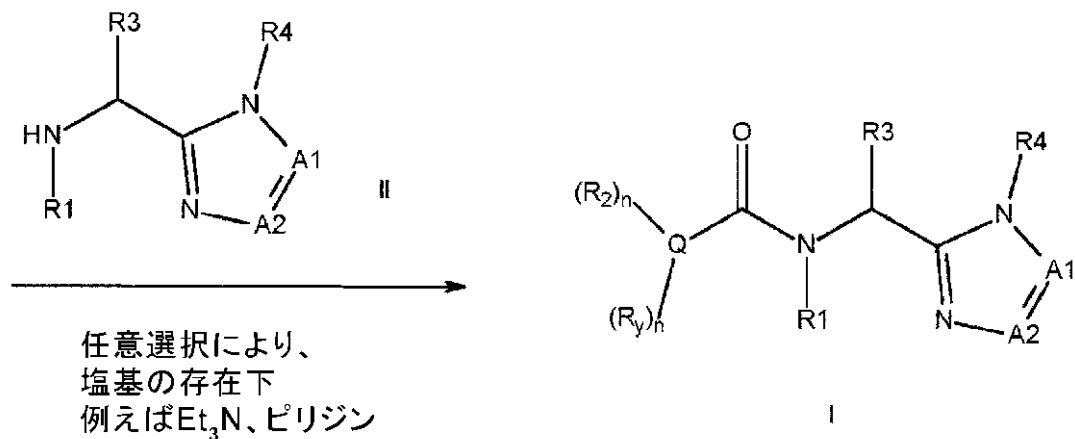
のカルボン酸誘導体との反応により調製可能である。化学は、スキーム 1 においてより詳細に記載されている。

スキーム 1 :

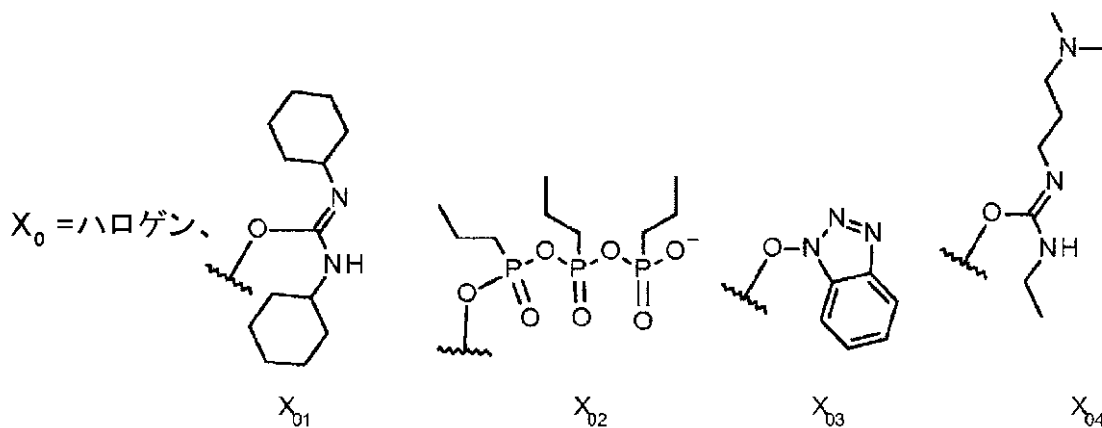
【化 1 1】



10



20



30

【0068】

40

スキーム1において、式IIIの化合物（ここで、 R_2 、 R_Y 、 m 及び n は、式Iにおいて定義されているとおりである）は、当業者に公知であると共に、例えばTetrahedron, 61 (46), 10827-10852, 2005に記載されている方法により、式IIIaの化合物に活性化される。例えば、 X_0 がハロゲンである化合物は、例えば、塩化オキサリル又は塩化チオニルによる、触媒量のDMFの存在下における、2塩化メチレン又はTHFなどの不活性溶剤中、20℃～100℃、好ましくは25℃の温度での式IIIの化合物の処理によって形成される。式Iの化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、上記のとおりである）による、任意選択により例えばトリエチルアミン又はピリジンといった塩基の存在下におけるIIIaの処理で式Iの化合物がもたらされる。代わりに、式Iの化合物は、活性化種IIIa（ここで、 X_0 は、それぞれ X_{01} 、

50

X_{02} 及び X_{03} である) がもたらされる、ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド (EDC) 又は 1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロリン酸 (HATU) による、例えばピリジン、DMF、アセトニトリル、 CH_2Cl_2 又は THF といった不活性溶剤中、任意選択により例えばトリエチルアミンといった塩基の存在下における、50~180℃の温度での式 III の化合物の処理によって調製可能である。最後に、式 III の酸は、例えば、Synthesis 2013, 45, 1569に記載されている、式 IIIa の化合物(ここで、 X_0 は、 X_{04} である) がもたらされる、プロパンホスホン酸無水物 (T3P (登録商標)) などのカップリング試薬との反応によっても活性化可能である。式 II のアミンとのさらなる反応で式 I の化合物がもたらされる。

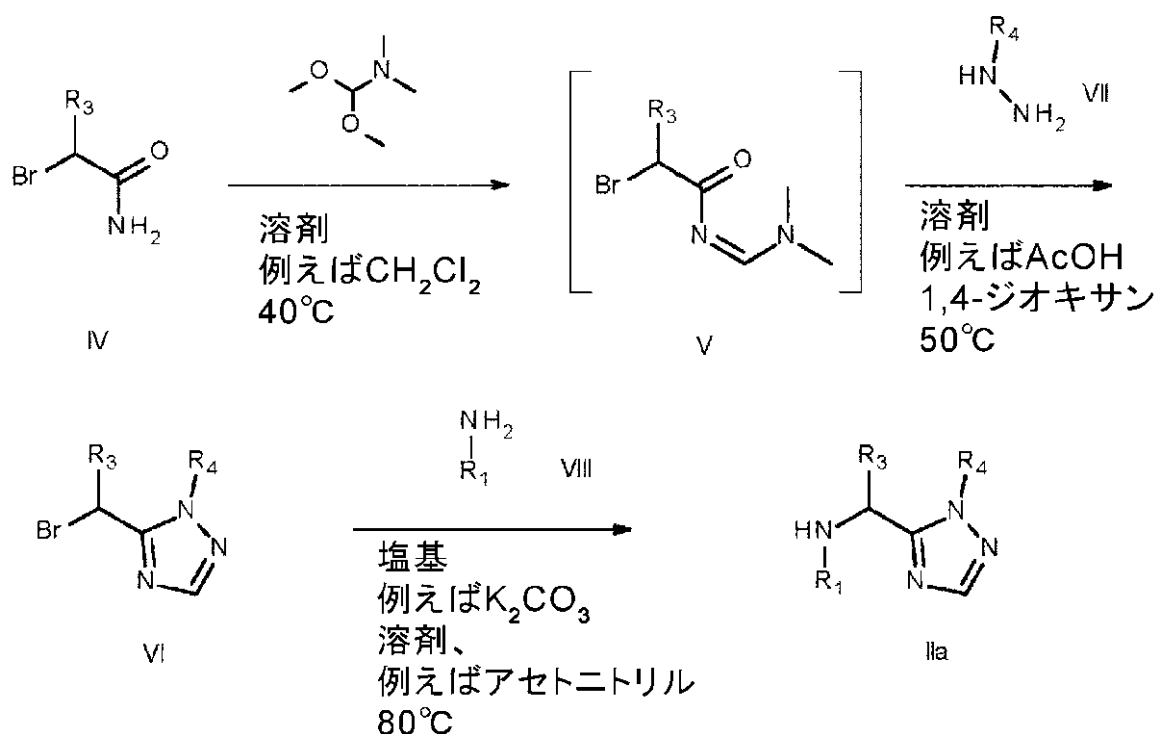
10

【0069】

式 IIIa の化合物(ここで、 R_1 、 R_3 及び R_4 は、式 I において定義されているとおりである) を形成するためのプロセスは、一般に公知であるか、又は当業者によって容易に調製可能である。このような合成の典型的な例をスキーム 2 に示す。

スキーム 2.

【化 12】



20

30

【0070】

例えば、式 IIa の化合物は、例えば、アセトニトリル又はジオキサンを含み得る好適な溶剤中、ナトリウム、カリウム又は炭酸セシウム(又は炭酸水素ナトリウム若しくはカリウム)などの好適な塩基の存在下、通常、室温~200℃、好ましくは40℃~反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、式 VI の化合物(ここで、 R_3 及び R_4 は、式 I に定義されているとおりである)と、式 VII の化合物(ここで、 R_1 は、式 I において定義されているとおりである)との反応により調製され得る。

40

【0071】

式 VI の化合物(ここで、 R_3 及び R_4 は、式 I に定義されているとおりである)は、例えば、酢酸と 1,4-ジオキサンとの混合物を含み得る好適な溶剤中における、通常、室温~200℃、好ましくは40℃~反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、式 V の化合物(ここで、 R_4 は、式 I において定義

50

されているとおりである)と、式V I Iの化合物(ここで、 R_4 は、式Iにおいて定義されているとおりである)との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、*Tetrahedron* 2017, 73, 750において既に記載されている。

【0072】

式Vの化合物(ここで、 R_3 は、上記に定義されているとおりである)は、例えば、ジクロロメタンを含み得る好適な溶剤中、通常、室温 $\sim$ 200 $^{\circ}$ C、好ましくは40 $^{\circ}$ C $\sim$ 反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、式I Vの化合物(ここで、 R_3 は、式Iにおいて定義されているとおりである)と、N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール(DMF-DMA)との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、*Tetrahedron* 2017, 73, 750において既に記載されている。

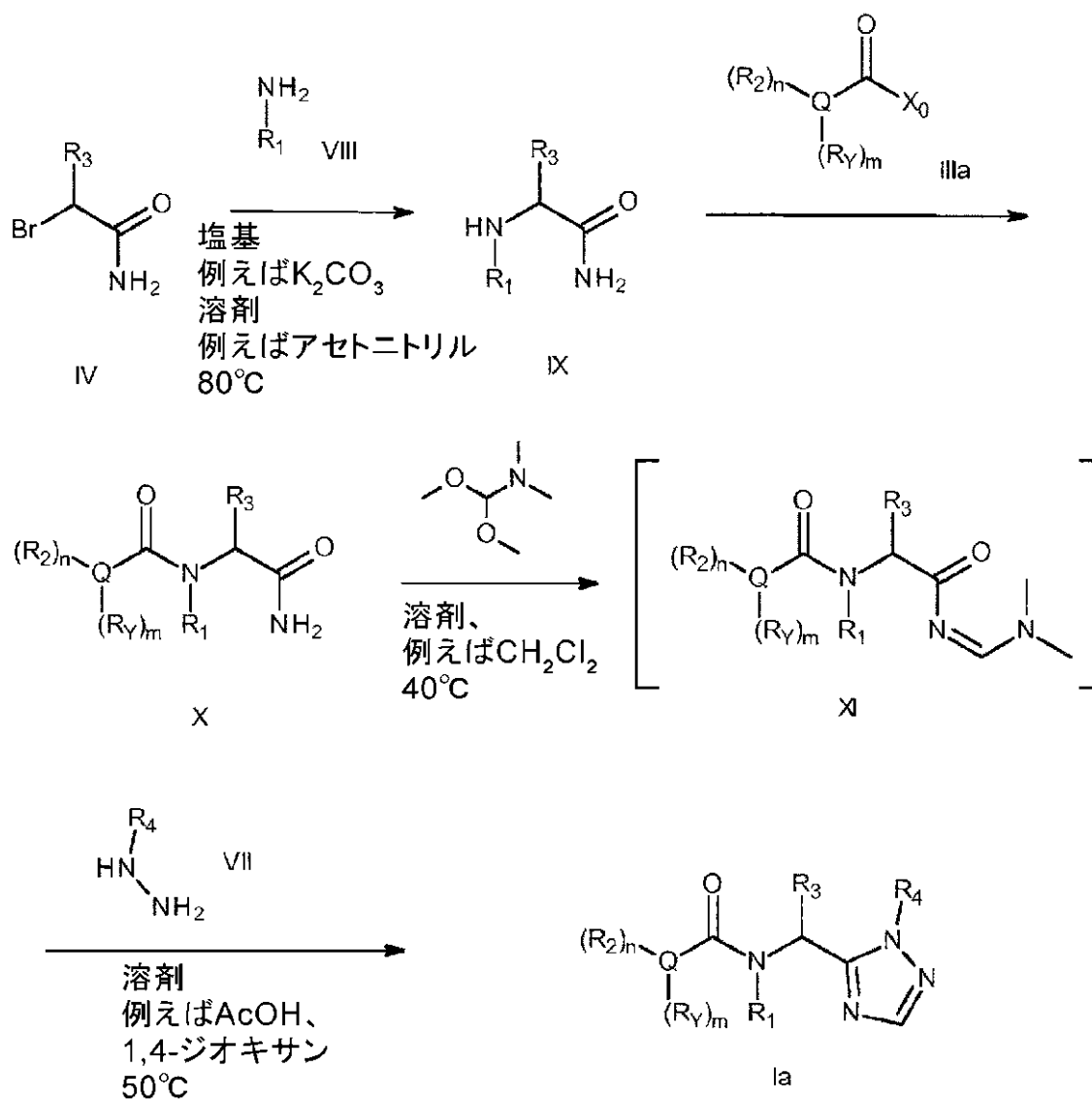
10

【0073】

式I aの化合物(ここで、 Q 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_Y 、 m 及び n は、式Iに定義されているとおりである)を形成するためのプロセスは、一般に公知であるか、又は当業者によって容易に調製可能である。このような合成の典型的な例をスキーム3に示す。

スキーム3.

【化13】



20

30

40

【0074】

例えば、式I aの化合物(ここで、 Q 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_Y 、 m 及び n は、式Iについて定義されているとおりである)は、例えば、酢酸と1,4-ジオキサンとの混合物を含み得る好適な溶剤中、通常、室温 $\sim$ 200 $^{\circ}$ C、好ましくは40 $^{\circ}$ C $\sim$ 反応混合物の沸

50

点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、式 X I の化合物（ここで、 Q 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_Y 、 m 及び n は、式 I について定義されているとおりである）と、式 V I I の化合物（ここで、 R_4 は、式 I において定義されているとおりである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750 において既に記載されている。

【0075】

式 X I の化合物（ここで、 Q 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_Y 、 m 及び n は、式 I について定義されているとおりである）は、例えば、ジクロロメタンを含み得る好適な溶剤中における、通常、室温～200℃、好ましくは40℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、式 X の化合物（ここで、 Q 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_Y 、 m 及び n は、式 I について定義されているとおりである）と、N, N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール（DMF-DM A）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750 及び米国特許出願公開第2016296501号明細書、調製7、第29ページにおいて既に記載されている。

10

【0076】

式 X の化合物（ここで、 Q 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_Y 、 m 及び n は、式 I について定義されているとおりである）は、例えば、ピリジン、DMF、アセトニトリル、 CH_2Cl_2 又はTHFを含み得る好適な不活性溶剤中、任意選択により例えばトリエチルアミン又はピリジンといった塩基の存在下における、通常、室温～200℃の温度での加熱を伴う、式 I X の化合物（ここで、 R_1 及び R_3 は、式 I について定義されているとおりである）と、式 I I I a の化合物（ここで、 R_2 、 R_Y 及び Xo は、スキーム1において定義されているとおりである）との反応により調製され得る。

20

【0077】

式 I X の化合物（ここで、 R_1 及び R_3 は、式 I について定義されているとおりである）は、例えば、アセトニトリル又はジオキサンを含み得る好適な溶剤中、ナトリウム、カリウム又は炭酸セシウム（又は炭酸水素ナトリウム若しくはカリウム）などの好適な塩基の存在下における、通常、室温～200℃、好ましくは40℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、式 I V の化合物（ここで、 R_3 は、式 I において定義されているとおりである）と、式 V I I I の化合物（ここで、 R_1 は、式 I において定義されているとおりである）との反応により調製され得る。

30

【0078】

式 I ' a の所望の鏡像異性体（ここで、 Q 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_Y 、 m 及び n は、式 I について定義されているとおりである）は、市販されている鏡像異性的に純粋な化合物 I V ' 又は I X ' が関与する、スキーム3に示されているものと同一のシーケンスによって調製され得る（スキーム3'を参照されたい）。

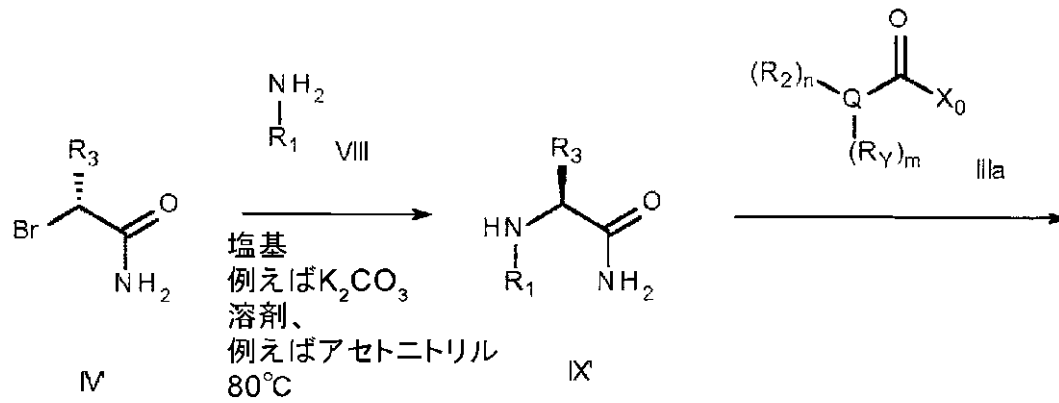
【0079】

代わりに、式 I ' a の所望の鏡像異性体（ここで、 Q 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_Y 、 m 及び n は、式 I について定義されているとおりである）は、化合物 I a のキラルクロマトグラフィによって入手され得る。

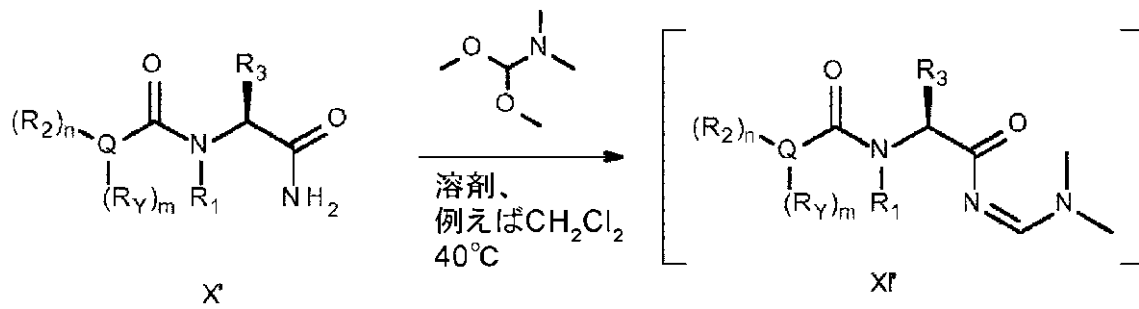
スキーム3'.

40

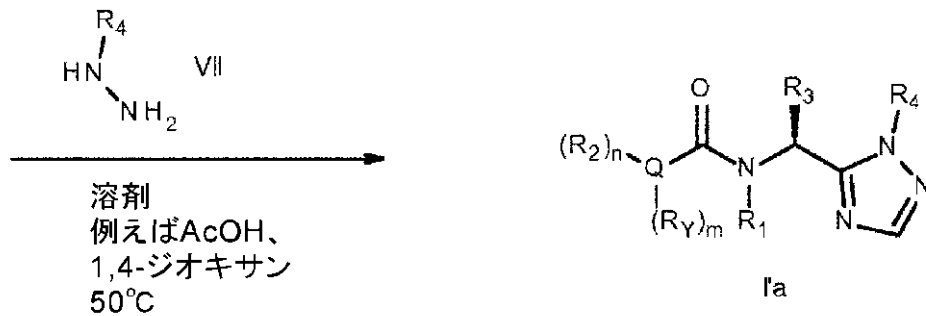
【化 1 4】



10



20



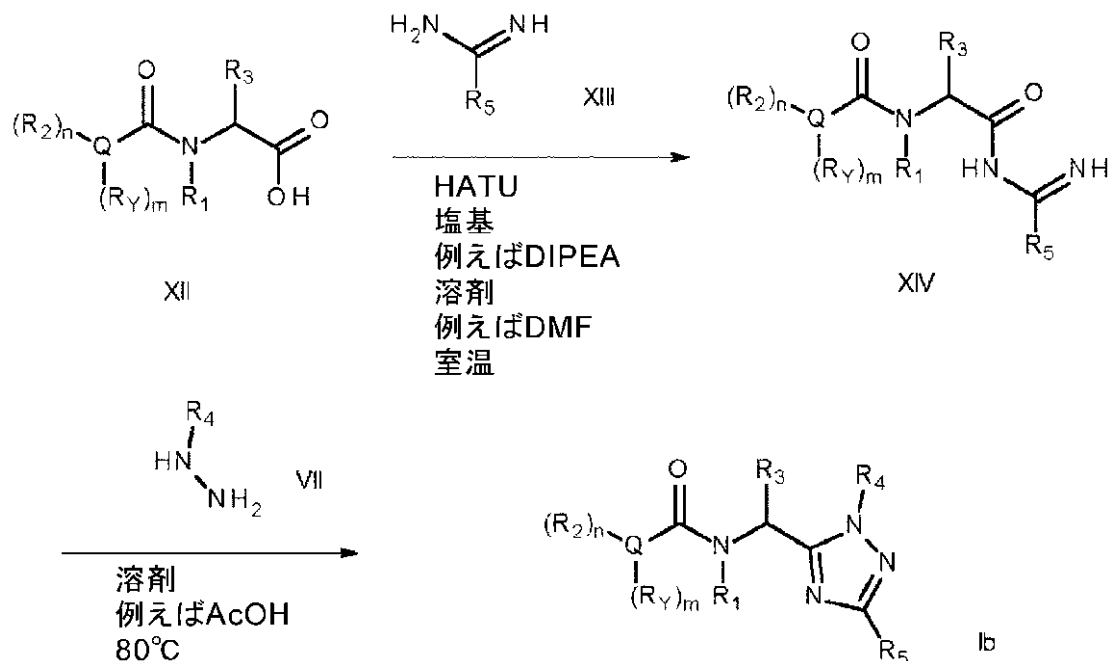
30

【0080】

式 I b の化合物（ここで、Q、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_Y 、 m 及び n は、式 I について定義されているとおりである）は、一般に公知であるか、又は当業者によって容易に調製可能である。このような合成の典型的な例をスキーム 4 に示す。

スキーム 4.

【化 1 5】



10

20

【0081】

式Ibの化合物（ここで、Q、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R_Y、m及びnは、式Iについて定義されているとおりである）は、例えば、酢酸を含み得る好適な溶剤中における、通常、室温～200℃、好ましくは40℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、式XIVの化合物（ここで、Q、R₁、R₂、R₃、R₅、R_Y、m及びnは、式Iについて定義されているとおりである）と、式VIIの化合物（ここで、R₄は、式Iにおいて定義されているとおりである）との反応によって調製され得る。このようなプロセスは、例えば、J. Org. Chem. 2011, 76, 1177において既に記載されている。

30

【0082】

式XIVの化合物（ここで、Q、R₁、R₂、R₃、R₅、R_Y、m及びnは、式Iについて定義されているとおりである）は、例えば、HATUを含み得るカップリング剤の存在下、例えばDMFを含み得る好適な溶剤中における、通常、室温～200℃、好ましくは20℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、式XIIの化合物（ここで、Q、R₁、R₂、R₃、R_Y、m及びnは、式Iについて定義されているとおりである）と、式VIIの化合物（ここで、R₅は、上記に定義されているとおりである）との反応によって調製され得る。このようなプロセスは、例えば、J. Org. Chem. 2011, 76, 1177において既に記載されている。

【0083】

代わりに、式I' bの所望の鏡像異性体（ここで、Q、R₁、R₂、R₃、R₄、R_Y、m及びnは、式Iについて定義されているとおりである）は、化合物Ibのキラルクロマトグラフィにより入手され得る。

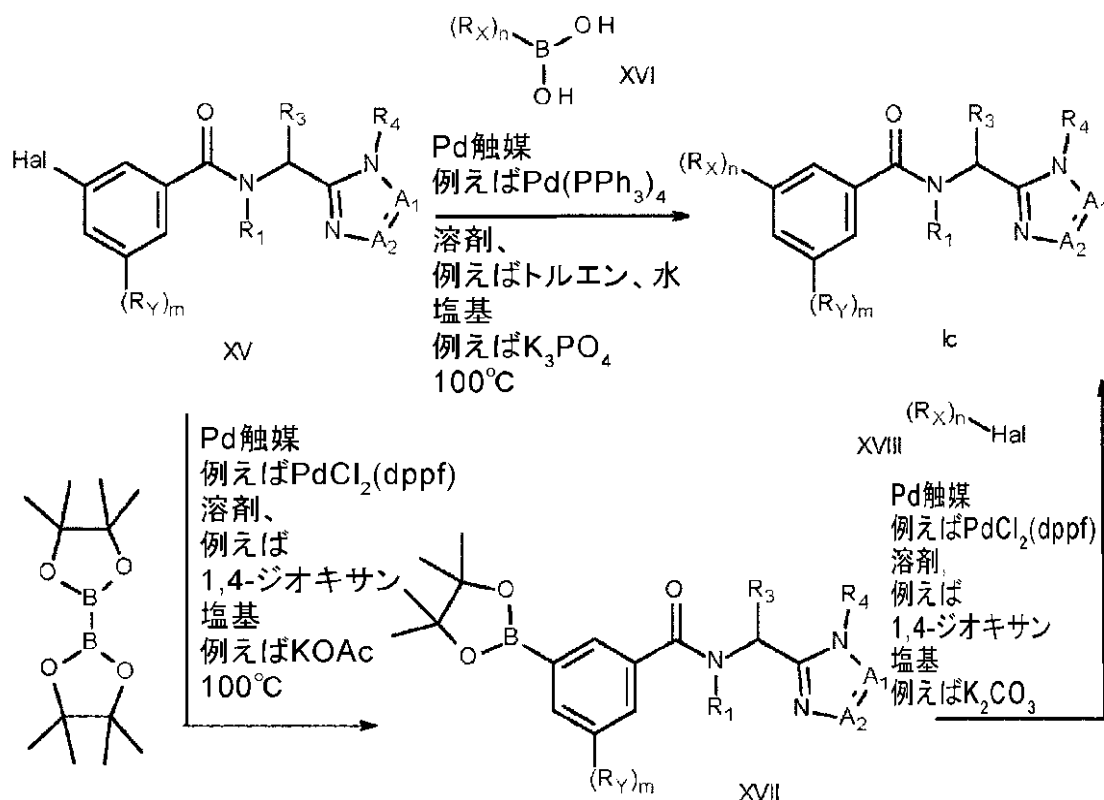
40

【0084】

式Icの化合物（ここで、R₁、R₂、R₃、R_x、R_Y、A₁及びA₂は、上記のとおりである）は、一般に公知であるか、又は当業者によって容易に調製可能である。このような合成の典型的な例をスキーム5に示す。

スキーム5.

【化 16】



10

20

【0085】

例えば、式Icの化合物（ここで、R₁、R₃、R₄、R_x、R_y、A₁及びA₂は、上記のとおりである）は、パラジウム触媒、例えばPd(PPh₃)₄の存在下、例えばトルエン／水、1,4-ジオキサン／水を含み得る好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム又はリン酸三カリウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温～200℃、好ましくは20℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、式XVの化合物（ここで、R₁、R₃、R₄、R_y、A₁及びA₂は、上記のとおりである）と、式XVIの化合物（ここで、R_xは、上記に定義されているであり、及びHalは、例えば、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）との反応によって調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron Letters 2002, 43, 6987-6990において既に記載されている。

30

【0086】

式Icの化合物（ここで、R₁、R₃、R₄、R_x、R_y、A₁及びA₂は、上記のとおりである）は、パラジウム触媒、例えばPdCl₂(dppf)の存在下、例えばトルエン／水、1,4-ジオキサン／水を含み得る好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム又はリン酸三カリウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温～200℃、好ましくは20℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、式XVIIの化合物（ここで、R₁、R₃、R₄、R_y、A₁及びA₂は、上記のとおりである）と、式XVIIIの化合物（ここで、R_xは、上記に定義されているとおりであり、及びHalは例えば臭素又はヨウ素などのハロゲンである）との反応によっても調製され得る。このようなプロセスは、例えば、国際公開第12139775号（第73ページを参照されたい）において既に記載されている。

40

【0087】

式XVIIの化合物（ここで、R₁、R₃、R₄、R_y、A₁及びA₂は、上記のとおりである）は、パラジウム触媒、例えばPdCl₂(dppf)の存在下、例えばトルエン／水、1,4-ジオキサン／水を含み得る好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム若しくは炭酸セシウム又は酢酸カリウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温～200℃、

50

好ましくは20℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、式XVの化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_Y 、 A_1 及び A_2 は、上記に定義されているとおりであり、及びHalは、例えば、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）と、ビス（ピナコラート）ジボロン（ B_2pin_2 ）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Bioorg. Med. Chem. Lett. 2015, 25, 1730及び国際公開第12139775号（調製例42、ステップ2、第67ページを参照されたい）において既に記載されている。

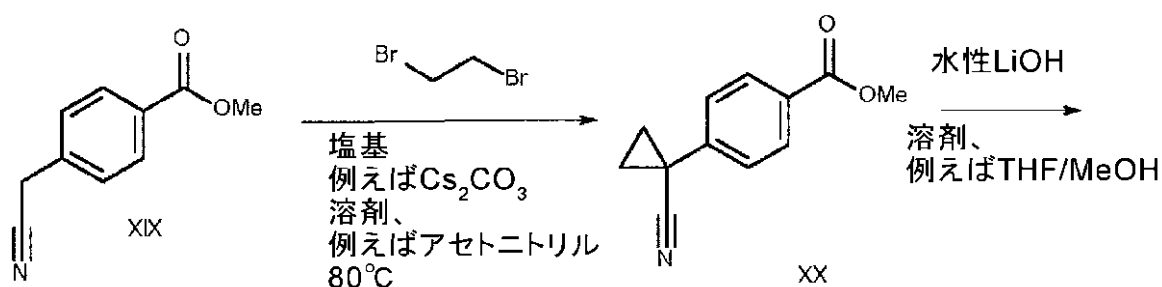
【0088】

式Idの化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、上記のとおりである）は、一般に公知であるか、又は当業者によって容易に調製可能である。このような合成の典型的な例をスキーム6に示す。

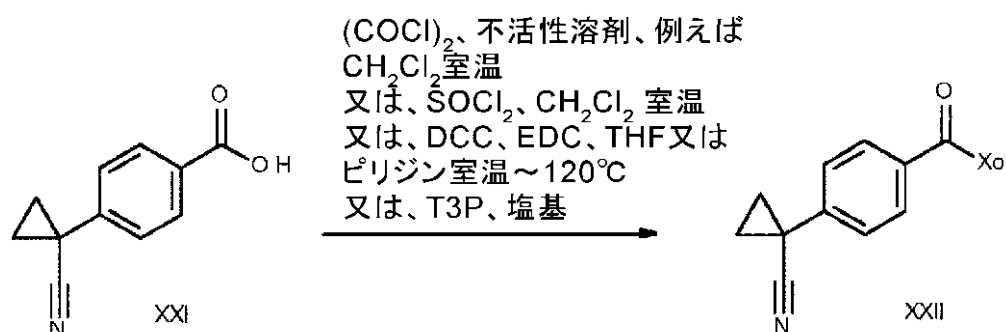
10

スキーム6.

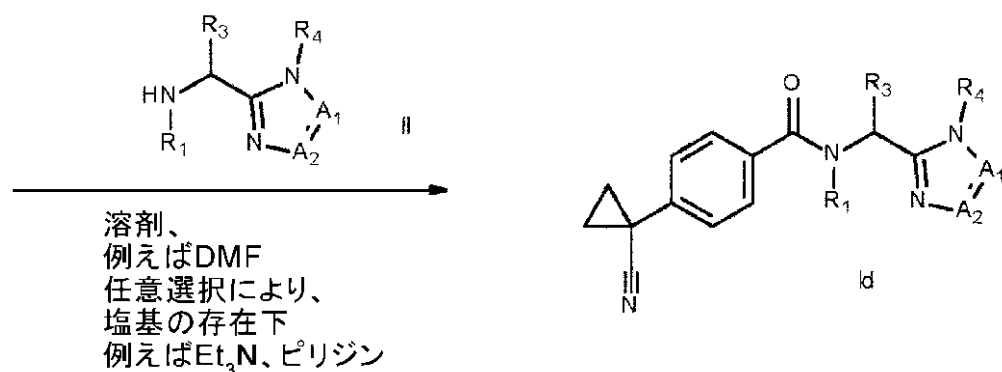
【化17】



20



30



40

【0089】

式Idの化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、上記のとおりである）は、スキーム1に記載されているとおり、式XXIIの化合物（ここで、 X_0 は、スキーム1に定義されているとおりである）と、式IIの化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、式Iにおいて定義されているとおりである）との反応により調製され得る。

【0090】

式XXIIの化合物（ここで、 X_0 は、スキーム1に定義されているとおりである）は、IIIaの調製についてスキーム1に記載されているとおり、式XXIの化合物から調

50

製され得る。

【0091】

式XXIの化合物は、例えば、THF／MeOH混合物を含み得る好適な溶剤中における、通常、室温～200℃、好ましくは20℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、水性LiOHによる処理によって式XXの化合物から調製され得る。

【0092】

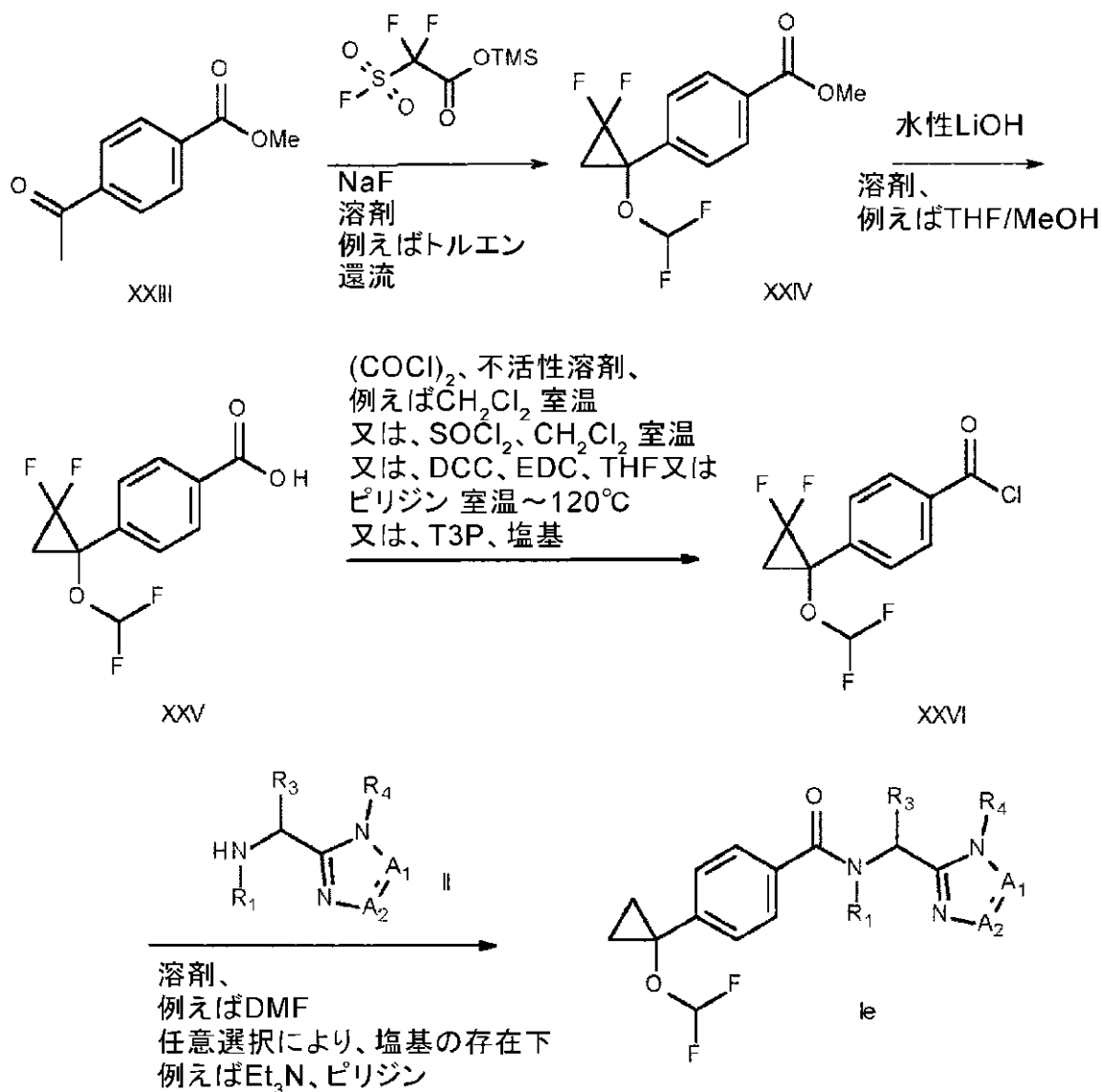
式XXの化合物は、例えば、アセトニトリルを含み得る好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温～200℃、好ましくは20℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、例えば1,2-ジブロモエタンとの反応により、市販されている式XIXの化合物から調製され得る。

【0093】

式Ieの化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、上記のとおりである）は、一般に公知であるか、又は当業者によって容易に調製可能である。このような合成の典型的な例をスキーム7に示す。

スキーム7.

【化18】



【0094】

式 I e の化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、上記のとおりである）は、スキーム 1 に記載されているとおり、式 XXVI の化合物（ここで、 X_0 は、スキーム 1 に定義されているとおりである）と、式 II の化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、式 I において定義されているとおりである）との反応により調製され得る。

【0095】

式 XXVI の化合物（ここで、 X_0 は、スキーム 1 に定義されているとおりである）は、II Ia の調製についてスキーム 1 に記載されているとおり、式 XXV の化合物から調製され得る。

【0096】

10

式 XXV の化合物は、例えば、THF/MeOH 混合物を含み得る好適な溶剤中、通常、室温～200℃、好ましくは20℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、例えば水性 LiOH、NaOH 又は KOH による処理により、式 XXI V の化合物から調製され得る。

【0097】

式 XXI V の化合物は、例えば、トルエンを含み得る好適な溶剤中、フッ化ナトリウム、フッ化カリウム又はフッ化セシウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温～200℃、好ましくは20℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意選択によりマイクロ波加熱条件下における、例えばトリメチルシリルフルオロスルホニルジフルオロアセテート (TFDA) との反応により、市販されている式 XXI I の化合物から調製され得る。このようなプロセスは、例えば、J. Org. Chem. 2004, 69, 4210 において既に記載されている。

20

【0098】

式 I f の化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_Y 、 R_X 、 A_1 及び A_2 は、上記のとおりである）は、スキーム 1 に記載されているとおり、例えば式 XXX の化合物（ここで、 X_0 は、スキーム 1 に定義されているとおりである）と、式 II の化合物（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、式 I において定義されているとおりである）との反応によって調製され得る（スキーム 8）。

【0099】

式 XXX の化合物（ここで、 X_0 は、スキーム 1 に定義されているとおりである）は、式 XXI X の化合物から、スキーム 1 において II Ia の調製について既に記載されているとおり調製され得る。

30

【0100】

式 XXI X の化合物は、スキーム 7. に記載されているものと同様に、例えば THF/MeOH 混合物を含み得る好適な溶剤中における、通常、室温～100℃、好ましくは20℃～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、例えば水性 LiOH、NaOH 又は KOH による処理により、式 XXVII I の化合物から調製され得る（スキーム 8）。

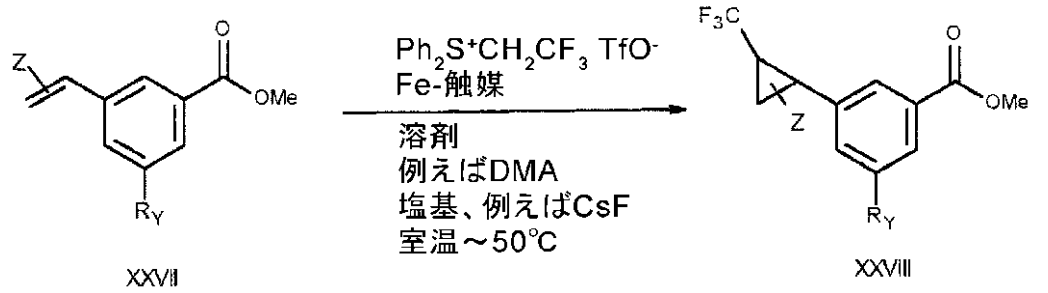
【0101】

最後に、式 XXVII I の化合物（ここで、 R_Y は、上記に定義されているとおりである）は、Fe-触媒及び好ましくは CsF といった塩基の存在下、0～50度、好ましくは20℃の温度で、溶剤として DMA 中における、市販されているか、又は当業者に公知の方法（例えば、Angew. Chem. Int. Ed. 2004, 43, 1132 及び Pure Appl. Chem. 1985, 57, 1771 を参照されたい）によって調製可能である式 XXVII I の化合物の（トリフルオロエチル）ージフェニルスルホニウムトリフレート ($Ph_2S^+CH_2CF_3^-OTf$) による処理によって調製され得る（Org. Lett. 2016, 18, 2471 と同様）（スキーム 8）。

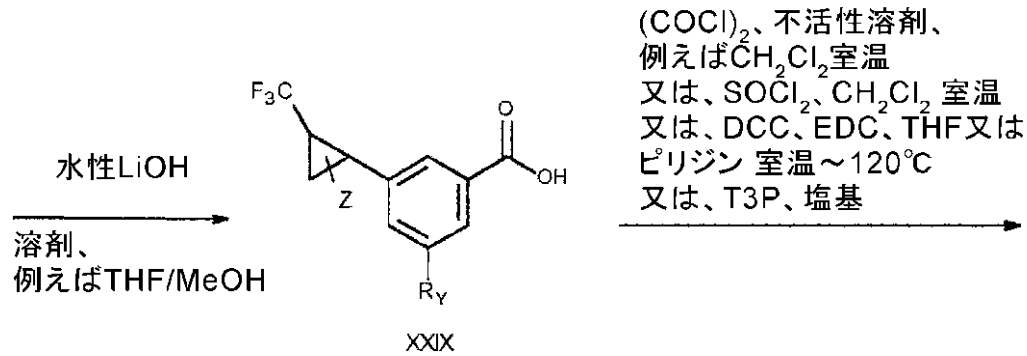
40

スキーム 8.

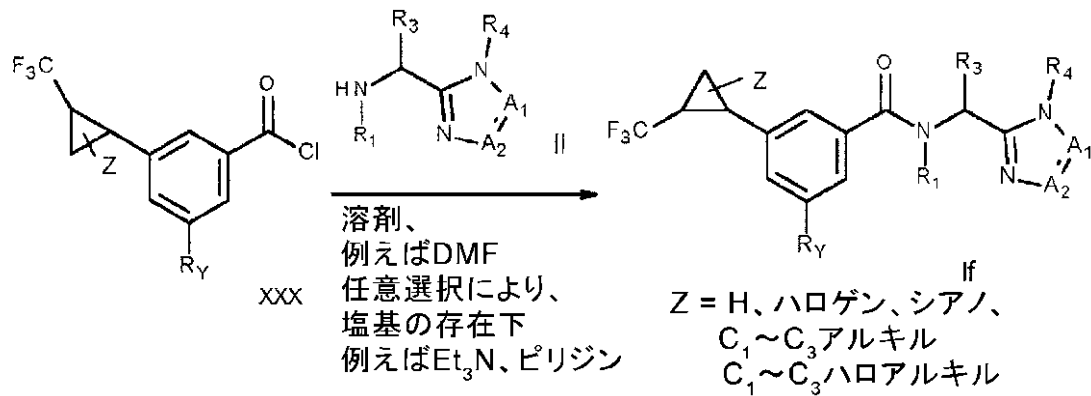
【化 1 9】



10



20



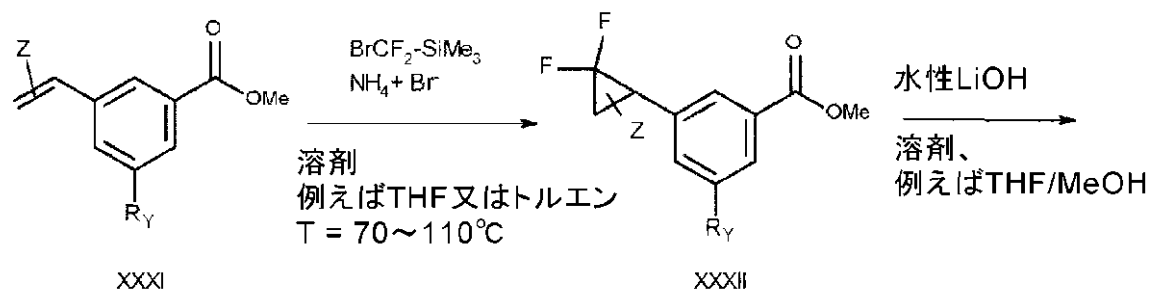
30

【0102】

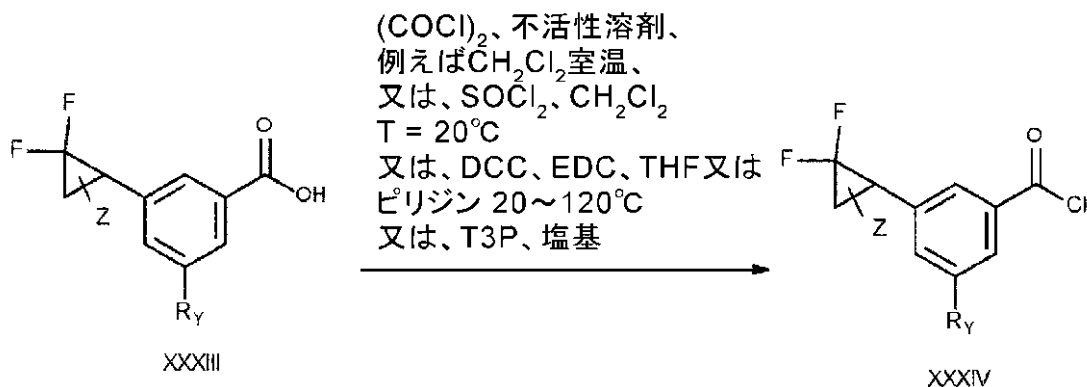
式 I g の化合物（ここで、R₁、R₃、R₄、R_Y、A₁及びA₂は、上記に定義されているとおりであり、及びZは、H、ハロゲン、シアノ、C₁~C₃アルキル及びC₁~C₃ハロアルキルである）は、スキーム9に示すとおりきわめて近似する様式で調製され得る。

スキーム9.

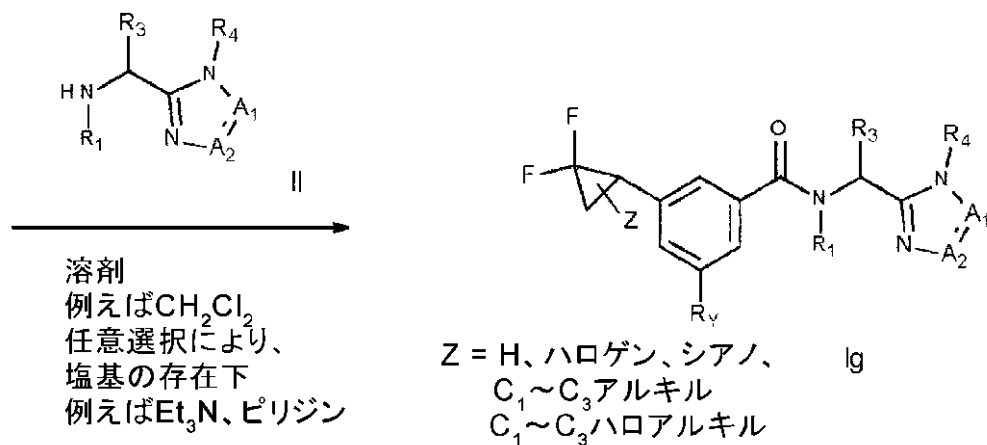
【化 20】



10



20



30

【0103】

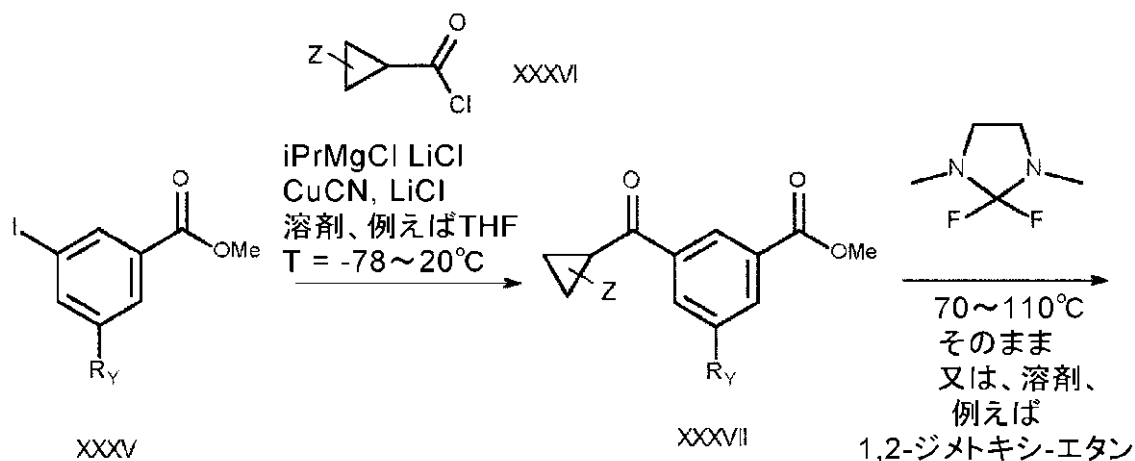
そのため、式XXXIIの化合物（ここで、R_Y及びZは、H、ハロゲン、シアノ、C₁~C₃アルキル及びC₁~C₃ハロアルキルであり、上記に定義されているとおりである）は、NH₄⁺Br⁻の存在下、好ましくはTHF又はトルエンといった好適な溶剤中、70~110°Cの温度における、式XXXIの化合物（ACS Med. Chem. Lett. 2013, 4, 514又はTetrahedron Lett. 2001, 42, 4083と同様に合成した）と、（プロモジフルオロメチル）ートリメチルシランとの反応により調製される。その後のメチルエステルの鹸化、カルボン酸の活性化及び最終的なアミドカップリングにより、スキーム9に例示されているとおり、式Igの化合物がもたらされる。

40

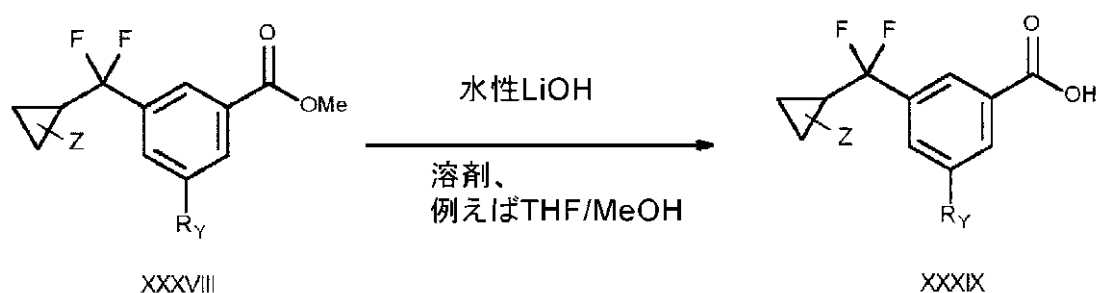
【0104】

スキーム10.

【化 2 1】

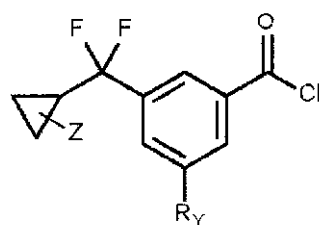


10

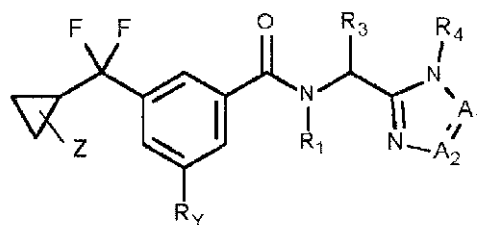
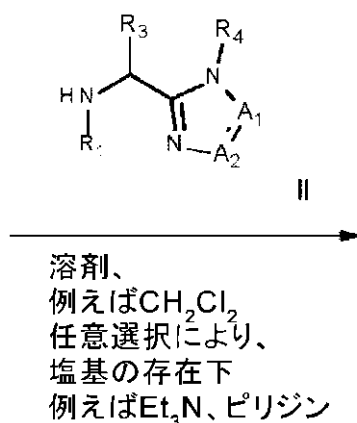


20

(COCl)₂、不活性溶剤、
 例えばCH₂Cl₂室温、
 又は、SOCl₂、CH₂Cl₂
 T = 20°C
 又は、DCC、EDC、THF又は
 ピリジン 20~120°C
 又は、T3P、塩基



30



40

Z = H、ハロゲン、シアノ、
 C₁~C₃アルキル
 C₁~C₃ハロアルキル

Ih

式 XXXIX のカルボン酸（ここで、Z は、H、ハロゲン、シアノ、C₁~C₃アルキル
 及び C₁~C₃ハロアルキルであり、及び R_y は、上記に定義されているとおりである）は
 、反応スキーム 10 に従って調製可能である。そのため、式 XXXV の化合物（ここで、
 R_y は、上記に定義されているとおりである）を iPrMgCl / LiCl 錯体で処理し
 ；その後、CuCN との反応及び式 XXXVI のシクロプロパン塩化カルボニル（ここで
 、R_x は、式 I において定義されているとおりである）による失活で式 XXXVII の化

50

化合物がもたらされる（国際公開第2006/067445号、第148ページと同様）。その後における、例えば1, 2-ジメトキシエタンといった溶剤中又はそのままで（Chem. Commun. 2002, (15), 1618を参照されたい）2, 2-ジフルオロ-1, 3-ジメチルイミダゾリンによるフッ素化により、式XXXXVIIの化合物が得られる。既述のとおり、LiOHによる加水分解で式XXXXIXのカルボン酸がもたらされる。スキーム10に例示するとおり、その後における、式XXXXIXのカルボン酸の活性化及び最終的な式IIのアミンによるアミドカップリングで式Ihの化合物がもたらされる。

【0105】

手法又は反応条件に応じて、反応体を塩基の存在下で反応させることが可能である。好適な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属ジアルキルアミド又はアルカリ金属又はアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミド、アルキレンジアミド、遊離又はN-アルキル化飽和又は不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウム及び炭素環式アミンである。挙げられる例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムtert-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス（トリメチルシリル）アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N-シクロヘキシル-N, N-ジメチルアミン、N, N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-（N, N-ジメチルアミノ）ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウム及び1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデカー7-エン（DBU）である。

【0106】

反応剤は、そのままで、すなわち溶媒又は希釈剤を加えずに互いに反応され得る。しながら、ほとんどの場合、不活性溶媒又は希釈剤又はこれらの混合物を加えることが有利である。反応が塩基の存在下で行われる場合、トリエチルアミン、ピリジン、N-メチルモルホリン又はN, N-ジエチルアニリンなどの過剰に用いられる塩基は、溶媒又は希釈剤としても働き得る。

【0107】

反応は、約-80℃～約+140℃、好ましくは約-30℃～約+100℃の温度範囲、多くの場合、周囲温度から約+80℃の範囲で行われるのが有利である。

【0108】

それぞれ好適な反応条件及び出発材料の選択に応じて、例えば1つの反応工程において、1つの置換基を本発明に係る別の置換基で単に置換することが可能であるか、又は複数の置換基は、同じ反応工程において、本発明に係る他の置換基で置換され得る。

【0109】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製され得る。従って、例えば、式Iの化合物の酸付加塩は、好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られ、塩基による塩は、好適な塩基又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られる。

【0110】

式Iの化合物の塩は、例えば、好適な塩基性化合物又は好適なイオン交換試薬による処理によって遊離化合物Iの酸付加塩に、且つ例えば好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって塩基による塩に慣例的な方法で転化され得る。

【0111】

式Iの化合物の塩は、例えば、塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、従って反応混合物から沈殿する好適な溶媒中において、例えば塩酸塩などの無機酸塩を酸のナトリウム塩、バリウム塩又は銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀で処理することにより、式I

10

20

30

40

50

の化合物の他の塩、酸付加塩、例えば他の酸付加塩にそれ自体公知の方法で転化され得る。

【0112】

手順又は反応条件に応じて、塩形成特性を有する式 I の化合物が、遊離形態又は塩の形態で得られる。

【0113】

式 I の化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態若しくは塩形態において、分子中に現れる不斉炭素原子の数、絶対及び相対配置に応じて、且つ／又は分子中に現れる非芳香族二重結合の配置に応じて、例えば対掌体及び／若しくはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態において、或いは鏡像異性体混合物、例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物又はラセミ体混合物などの異性体混合物として、可能な異性体の 1 つの形態で又はこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、可能なすべての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記及び下記においてこの意味でそれぞれ理解されるべきである。

10

【0114】

式 I の化合物のジアステレオマー混合物又はラセミ混合物は、いずれの出発材料及び手順が選択されたかに応じて得られる遊離形態又は塩形態において、例えば分別結晶化、蒸留及び／又はクロマトグラフィーにより、成分の物理化学的差異に基づいて純粋なジアステレオマー又はラセミ体に公知の方法で分離され得る。

【0115】

同様の方法で得られるラセミ体などの鏡像異性体混合物は、公知の方法により、例えば光学活性溶媒からの再結晶化により、キラル吸着剤におけるクロマトグラフィー、例えば好適な微生物を用いたアセチルセルロースにおける高速液体クロマトグラフィー（HPLC）により、例えば 1 つのみの鏡像異性体が複合されるキラルクラウンエーテルを用いた、包接化合物の形成を介した特定の固定化酵素による開裂により、又はジアステレオマー塩への転化により、例えば塩基性最終生成物ラセミ体をカルボン酸、例えばショウノウ酸、酒石酸又はリンゴ酸又はスルホン酸、例えばカンファースルホン酸などの光学活性酸と反応させ、このように得られるジアステレオマー混合物を例えば異なる溶解度に基づく分別結晶によって分離して、好適な物質、例えば塩基性物質の作用により、所望の鏡像異性体がそれから放出され得るジアステレオマーを得ることにより、光学対掌体に分解され得る。

20

30

【0116】

純粋なジアステレオマー又は鏡像異性体は、本発明に従い、好適な異性体混合物を分離することによるだけでなく、ジアステレオ選択的又はエナンチオ選択的合成の一般に知られている方法、例えば立体化学特性を有する出発材料を用いて、本発明に係る方法を行うことによって得られる。

【0117】

N-オキシドは、酸無水物、例えば無水トリフルオロ酢酸の存在下で式 I の化合物を好適な酸化剤、例えば H_2O_2 / 尿素付加物と反応させることによって調製され得る。このような酸化は、例えば、J. Med. Chem., 32 (12), 2561-73, 1989 又は国際公開第 2000/15615 号といった文献から公知である。

40

【0118】

個々の成分が異なる生物学的活性を有する場合、それぞれ生物学的により有効な異性体、例えば鏡像異性体又はジアステレオマー又は異性体混合物、例えば鏡像異性体混合物又はジアステレオマー混合物を単離又は合成することが有利である。

【0119】

式 I の化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態又は塩形態において、必要に応じて水和物の形態において得ることもでき、且つ／又は他の溶媒、例えば固体形態で存在する化合物の結晶化に使用され得た溶媒を含む。

【0120】

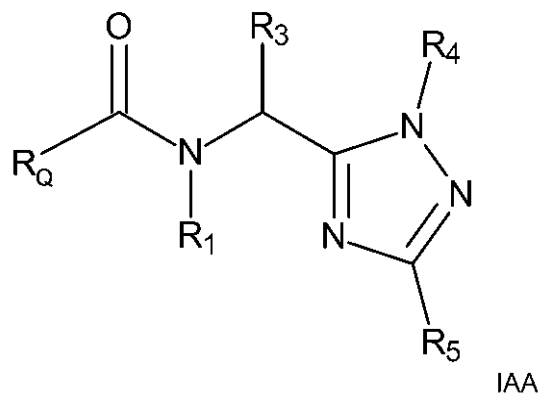
50

以下の表 A-1 ~ A-64 に表される式 I の化合物は、上述される方法に従って調製され得る。以下に続く例は、本発明を例示し、式 I の好ましい化合物を示すことが意図される。

【0121】

以下の表 A-1 ~ A-64 に係る化合物は、上記の方法に従って調製可能である。以下に続く例は、本発明を例示することが意図されており、式 I A A の化合物の形態の好ましい式 I の化合物を示す。

【化 2 2】



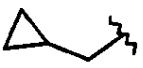
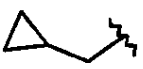
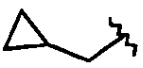
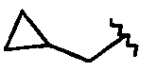
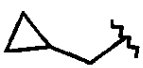
10

20

【0122】

【表 1 - 1】

表 X: 式 IAA の化合物における R₁、R₃、R₄、A₁ 及び A₂ の置換基の定義

指数	R ₁	R ₃	R ₄	A ₁	A ₂
1	H	Me	2-ピリミジル	N	CH
2	Me	Me	2-ピリミジル	N	CH
3	Et	Me	2-ピリミジル	N	CH
4	プロパルギル	Me	2-ピリミジル	N	CH
5		Me	2-ピリミジル	N	CH
6	H	Me	2-ピリジル	N	CH
7	Me	Me	2-ピリジル	N	CH
8	Et	Me	2-ピリジル	N	CH
9	プロパルギル	Me	2-ピリジル	N	CH
10		Me	2-ピリジル	N	CH
11	H	Me	2-ピラジニル	N	CH
12	Me	Me	2-ピラジニル	N	CH
13	Et	Me	2-ピラジニル	N	CH
14	プロパルギル	Me	2-ピラジニル	N	CH
15		Me	2-ピラジニル	N	CH
16	H	Me	3-ピリダジニル	N	CH
17	Me	Me	3-ピリダジニル	N	CH
18	Et	Me	3-ピリダジニル	N	CH
19	プロパルギル	Me	3-ピリダジニル	N	CH
20		Me	3-ピリダジニル	N	CH
21	H	Me	2-ピリミジル	N	N
22	Me	Me	2-ピリミジル	N	N
23	Et	Me	2-ピリミジル	N	N
24	プロパルギル	Me	2-ピリミジル	N	N
25		Me	2-ピリミジル	N	N
26	H	Me	2-ピリジル	N	N
27	Me	Me	2-ピリジル	N	N
28	Et	Me	2-ピリジル	N	N
29	プロパルギル	Me	2-ピリジル	N	N

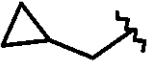
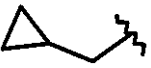
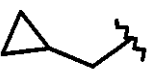
10

20

30

40

【表 1 - 2】

30		Me	2-ピリジル	N	N
31	H	Me	2-ピラジニル	N	N
32	Me	Me	2-ピラジニル	N	N
33	Et	Me	2-ピラジニル	N	N
34	プロパルギル	Me	2-ピラジニル	N	N
35		Me	2-ピラジニル	N	N
36	H	Me	3-ピリダジニル	N	N
37	Me	Me	3-ピリダジニル	N	N
38	Et	Me	3-ピリダジニル	N	N
39	プロパルギル	Me	3-ピリダジニル	N	N
40		Me	3-ピリダジニル	N	N
41	H	Me	5-ブロモピリミジン -2-イル	N	CH
42	H	Me	5-ブロモ-2-ピリジ ル	N	CH
43	H	Me	5-ブロモピリミジン -2-イル	N	CMe
44	H	Me	5-ブロモ-2-ピリジ ル	N	CMe
45	H	Me	2-ピリミジル	N	CMe
46	H	Me	2-ピリジル	N	CMe

10

20

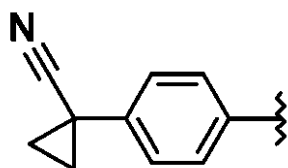
30

【0123】

表 A-1 は、46 種の式 I A A の化合物 A-1. 001 ~ A-1. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_0 は、

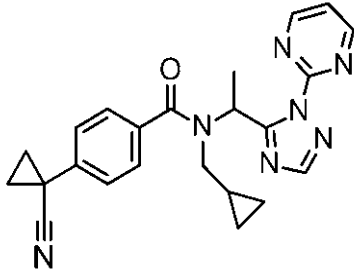
【化 23】

40



であり、式中、波線は、 R_0 の分子の残部への結合点を示し、可変要素 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X の対応する行に記載されている特定の意味を有する。例えば、化合物 1. 005 は、以下の構造：

【化 2 4】



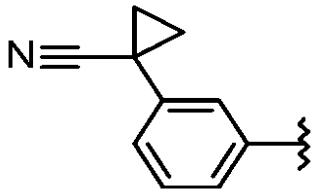
を有する。

10

【0 1 2 4】

表 A-2 は、46 種の式 I A A の化合物 A-2. 001 ~ A-2. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 2 5】



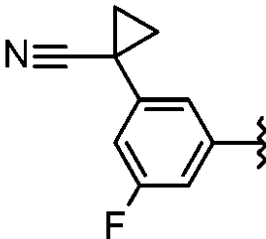
20

である。

【0 1 2 5】

表 A-3 は、46 種の式 I A A の化合物 A-3. 001 ~ A-3. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 2 6】



30

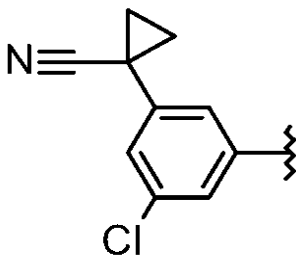
である。

【0 1 2 6】

表 A-4 は、46 種の式 I A A の化合物 A-4. 001 ~ A-4. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

40

【化 2 7】



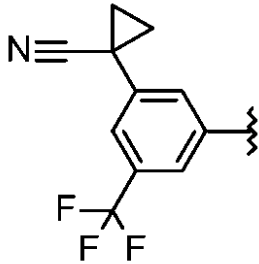
である。

50

【0127】

表A-5は、46種の式IAAの化合物A-5. 001~A-5. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化28】



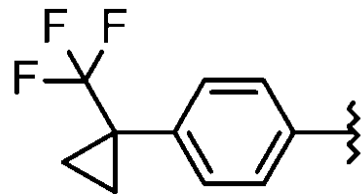
10

である。

【0128】

表A-6は、46種の式IAAの化合物A-6. 001~A-6. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化29】



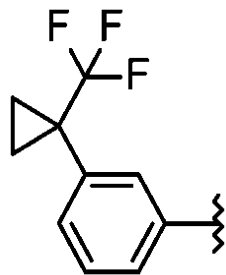
20

である。

【0129】

表A-7は、46種の式IAAの化合物A-7. 001~A-7. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化30】



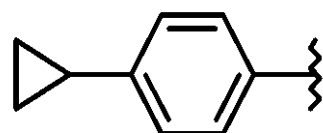
30

である。

【0130】

表A-8は、46種の式IAAの化合物A-8. 001~A-8. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化31】



40

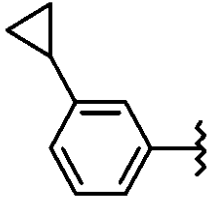
50

である。

【0131】

表A-9は、46種の式IAAの化合物A-9. 001~A-9. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化32】



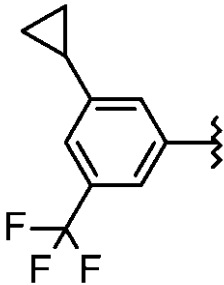
10

である。

【0132】

表A-10は、46種の式IAAの化合物A-10. 001~A-10. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化33】



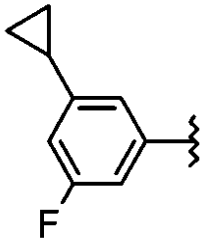
20

である。

【0133】

表A-11は、46種の式IAAの化合物A-11. 001~A-11. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化34】



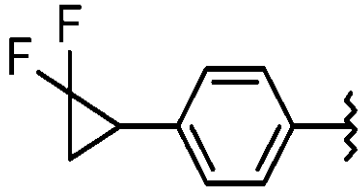
40

である。

【0134】

表A-12は、46種の式IAAの化合物A-12. 001~A-12. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 3 5】

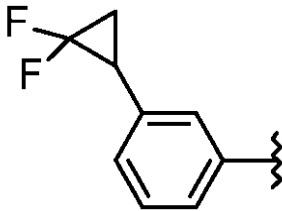


である。

【0 1 3 5】

表 A-13 は、46 種の式 I A A の化合物 A-13. 001 ~ A-13. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 3 6】

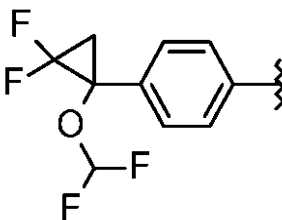


である。

【0 1 3 6】

表 A-14 は、46 種の式 I A A の化合物 A-14. 001 ~ A-14. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 3 7】

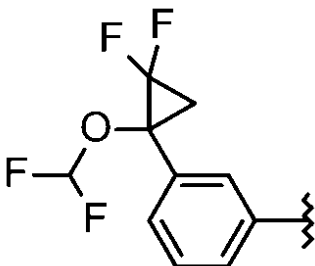


である。

【0 1 3 7】

表 A-15 は、46 種の式 I A A の化合物 A-15. 001 ~ A-15. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 3 8】



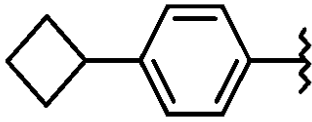
である。

【0 1 3 8】

表 A-16 は、46 種の式 I A A の化合物 A-16. 001 ~ A-16. 046 を提供

するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されている
とおりであり、及び R_Q は、

【化39】

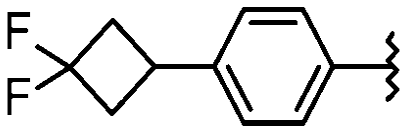


である。

【0139】

表A-17は、46種の式IAAの化合物A-17. 001~A-17. 046を提供
するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されている
とおりであり、及び R_Q は、

【化40】

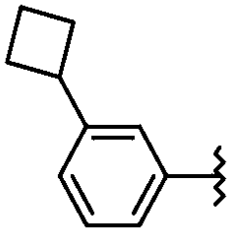


である。

【0140】

表A-18は、46種の式IAAの化合物A-18. 001~A-18. 046を提供
するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されている
とおりであり、及び R_Q は、

【化41】

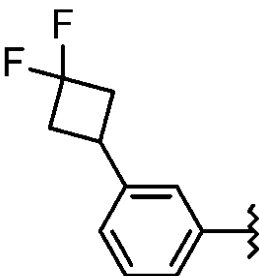


である。

【0141】

表A-19は、46種の式IAAの化合物A-19. 001~A-19. 046を提供
するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されている
とおりであり、及び R_Q は、

【化42】



である。

【0142】

表A-20は、46種の式IAAの化合物A-20. 001~A-20. 046を提供
するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されている

10

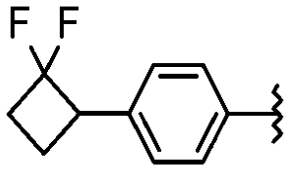
20

30

40

50

とおりであり、及び R_Q は、
【化 4 3】

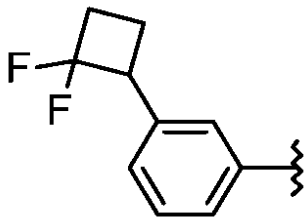


である。

【0 1 4 3】

表 A-2 1 は、4 6 種の式 I A A の化合物 A-2 1. 0 0 1 ~ A-2 1. 0 4 6 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 4 4】

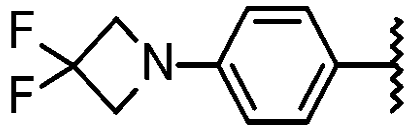


である。

【0 1 4 4】

表 A-2 2 は、4 6 種の式 I A A の化合物 A-2 2. 0 0 1 ~ A-2 2. 0 4 6 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 4 5】

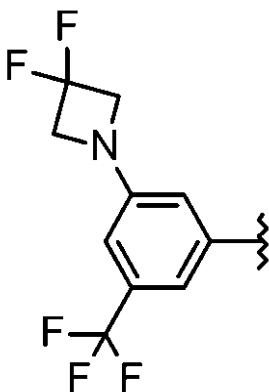


である。

【0 1 4 5】

表 A-2 3 は、4 6 種の式 I A A の化合物 A-2 3. 0 0 1 ~ A-2 3. 0 4 6 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 4 6】

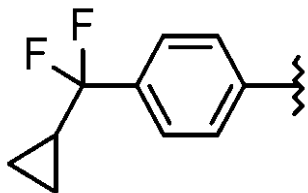


である。

【0146】

表A-24は、46種の式IAAの化合物A-24. 001~A-24. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化47】



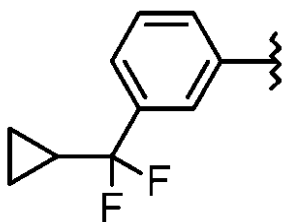
10

である。

【0147】

表A-25は、46種の式IAAの化合物A-25. 001~A-25. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化48】



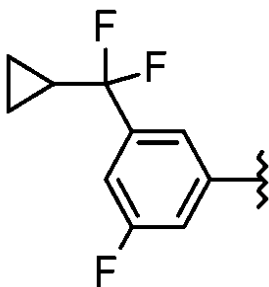
20

である。

【0148】

表A-26は、46種の式IAAの化合物A-26. 001~A-26. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化49】



30

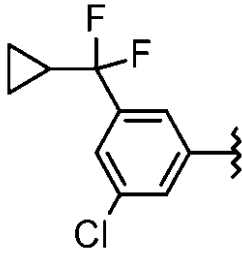
である。

【0149】

表A-27は、46種の式IAAの化合物A-27. 001~A-27. 046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

40

【化 5 0】



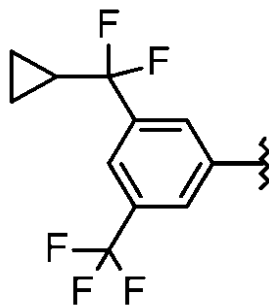
である。

10

【0 1 5 0】

表 A-28 は、46 種の式 I A A の化合物 A-28. 001 ~ A-28. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 5 1】



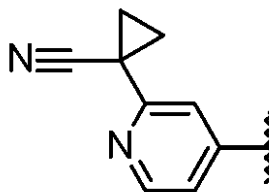
20

である。

【0 1 5 1】

表 A-29 は、46 種の式 I A A の化合物 A-29. 001 ~ A-29. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 5 2】



30

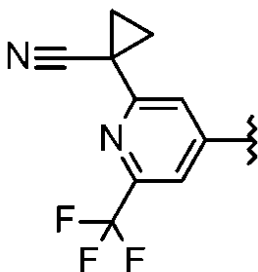
である。

【0 1 5 2】

表 A-30 は、46 種の式 I A A の化合物 A-30. 001 ~ A-30. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

40

【化 5 3】



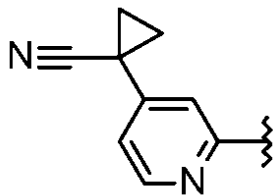
50

である。

【0153】

表A-31は、46種の式IAAの化合物A-31.001～A-31.046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化54】



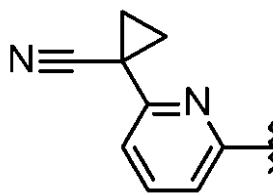
10

である。

【0154】

表A-32は、46種の式IAAの化合物A-32.001～A-32.046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化55】



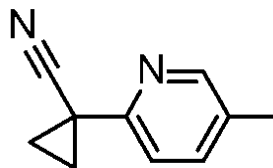
20

である。

【0155】

表A-33は、46種の式IAAの化合物A-33.001～A-33.046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化56】



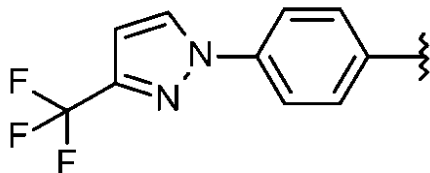
30

である。

【0156】

表A-34は、46種の式IAAの化合物A-34.001～A-34.046を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表Xにおいて定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化57】



40

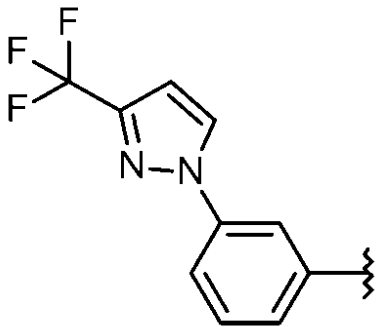
である。

【0157】

50

表 A-35 は、46 種の式 I A A の化合物 A-35.001 ~ A-35.046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 58】



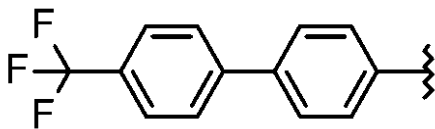
10

である。

【0158】

表 A-36 は、46 種の式 I A A の化合物 A-36.001 ~ A-36.046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 59】



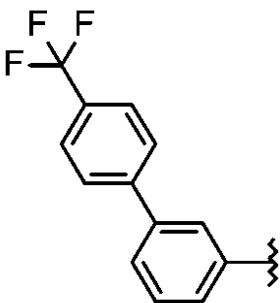
20

である。

【0159】

表 A-37 は、46 種の式 I A A の化合物 A-37.001 ~ A-37.046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 60】



30

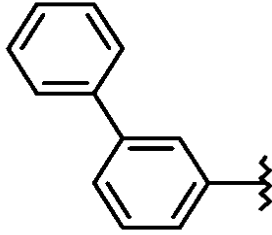
である。

【0160】

表 A-38 は、46 種の式 I A A の化合物 A-38.001 ~ A-38.046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

40

【化 6 1】



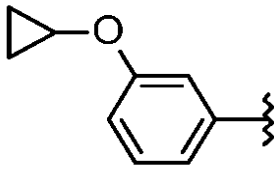
である。

【0 1 6 1】

10

表 A-39 は、46 種の式 I A A の化合物 A-39. 001 ~ A-39. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 6 2】



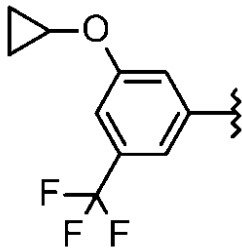
20

である。

【0 1 6 2】

表 A-40 は、46 種の式 I A A の化合物 A-40. 001 ~ A-40. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 6 3】



30

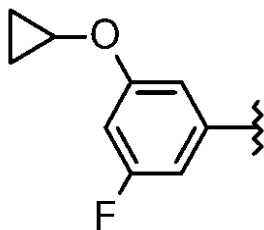
である。

【0 1 6 3】

表 A-41 は、46 種の式 I A A の化合物 A-41. 001 ~ A-41. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 6 4】

40



である。

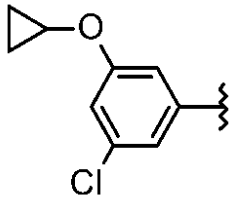
【0 1 6 4】

表 A-42 は、46 種の式 I A A の化合物 A-42. 001 ~ A-42. 046 を提供

50

するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されている
とおりであり、及び R_Q は、

【化 6 5】



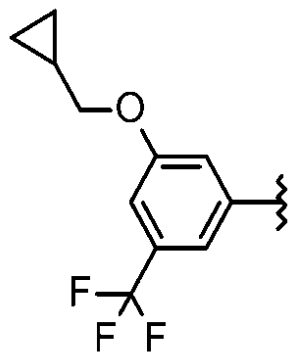
である。

10

【0 1 6 5】

表 A-43 は、46 種の式 I A A の化合物 A-43. 001 ~ A-43. 046 を提供
するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されている
とおりであり、及び R_Q は、

【化 6 6】



である。

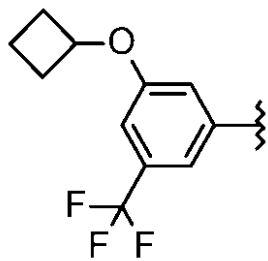
20

【0 1 6 6】

表 A-44 は、46 種の式 I A A の化合物 A-44. 001 ~ A-44. 046 を提供
するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されている
とおりであり、及び R_Q は、

30

【化 6 7】



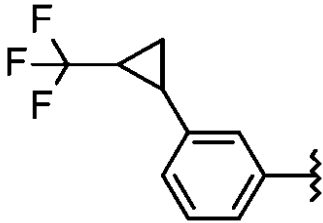
である。

40

【0 1 6 7】

表 A-45 は、46 種の式 I A A の化合物 A-45. 001 ~ A-45. 046 を提供
するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されている
とおりであり、及び R_Q は、

【化 6 8】

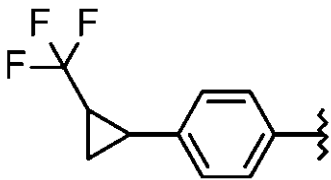


である。

【0 1 6 8】

表 A-46 は、46 種の式 I A A の化合物 A-46. 001 ~ A-46. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 6 9】

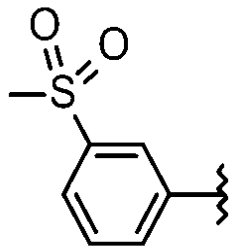


である。

【0 1 6 9】

表 A-47 は、46 種の式 I A A の化合物 A-47. 001 ~ A-47. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 7 0】

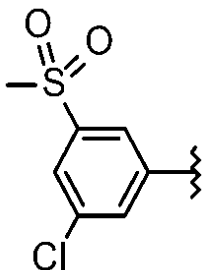


である。

【0 1 7 0】

表 A-48 は、46 種の式 I A A の化合物 A-48. 001 ~ A-48. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 7 1】

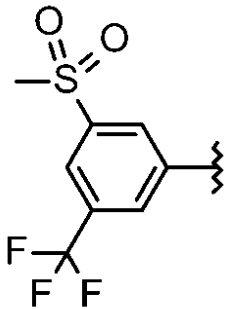


である。

【0 1 7 1】

表 A-49 は、46 種の式 I A A の化合物 A-49.001 ~ A-49.046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 7 2】



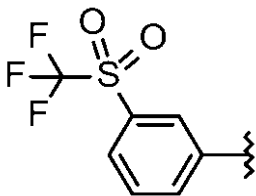
10

である。

【0172】

表 A-50 は、46 種の式 I A A の化合物 A-50.001 ~ A-50.046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 7 3】



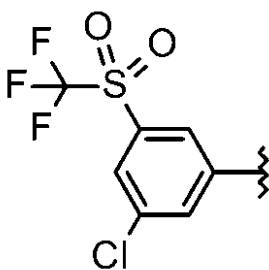
20

である。

【0173】

表 A-51 は、46 種の式 I A A の化合物 A-51.001 ~ A-51.046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 7 4】



30

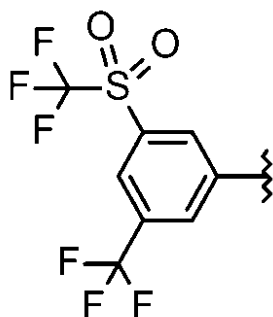
である。

【0174】

表 A-52 は、46 種の式 I A A の化合物 A-52.001 ~ A-52.046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

40

【化 7 5】



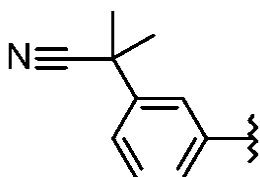
10

である。

【0 1 7 5】

表 A-53 は、46 種の式 I A A の化合物 A-53. 001 ~ A-53. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 7 6】



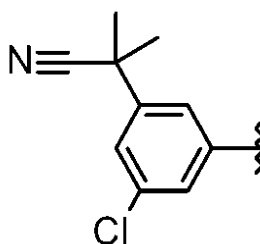
20

である。

【0 1 7 6】

表 A-54 は、46 種の式 I A A の化合物 A-54. 001 ~ A-54. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 7 7】



30

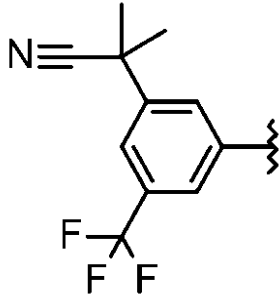
である。

【0 1 7 7】

表 A-55 は、46 種の式 I A A の化合物 A-55. 001 ~ A-55. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

40

【化 7 8】



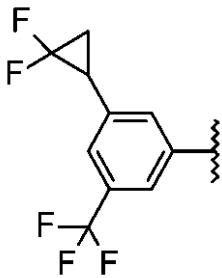
10

である。

【0 1 7 8】

表 A-56 は、46 種の式 I A A の化合物 A-56. 001 ~ A-56. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_0 は、

【化 7 9】



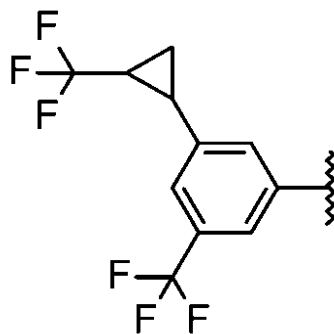
20

である。

【0 1 7 9】

表 A-57 は、46 種の式 I A A の化合物 A-57. 001 ~ A-57. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_0 は、

【化 8 0】



30

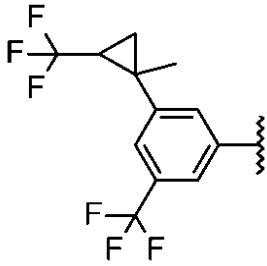
である。

【0 1 8 0】

表 A-58 は、46 種の式 I A A の化合物 A-58. 001 ~ A-58. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_0 は、

40

【化 8 1】



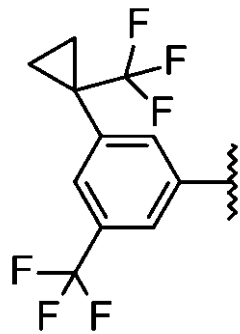
である。

10

【0181】

表 A-59 は、46 種の式 I A A の化合物 A-59. 001 ~ A-59. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 8 2】



20

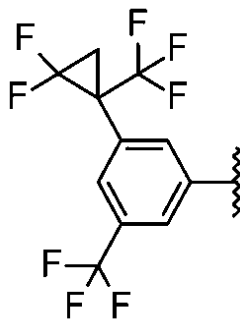
である。

【0182】

表 A-60 は、46 種の式 I A A の化合物 A-60. 001 ~ A-60. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

30

【化 8 3】



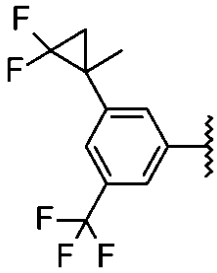
40

である。

【0183】

表 A-61 は、46 種の式 I A A の化合物 A-61. 001 ~ A-61. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 8 4】



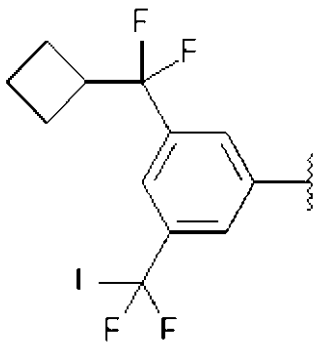
である。

10

【0184】

表 A-62 は、46 種の式 I A A の化合物 A-62. 001 ~ A-62. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 8 5】



20

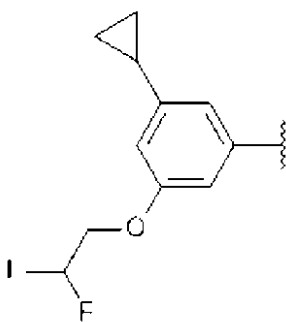
である。

【0185】

表 A-63 は、46 種の式 I A A の化合物 A-63. 001 ~ A-63. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

30

【化 8 6】



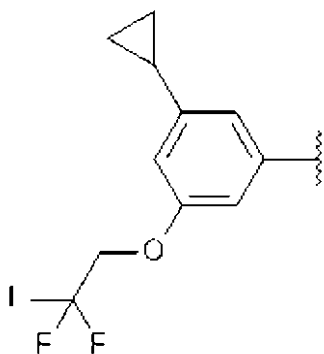
40

である。

【0186】

表 A-64 は、46 種の式 I A A の化合物 A-64. 001 ~ A-64. 046 を提供するものであり、ここで、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 A_1 及び A_2 は、表 X において定義されているとおりであり、及び R_Q は、

【化 8 7】



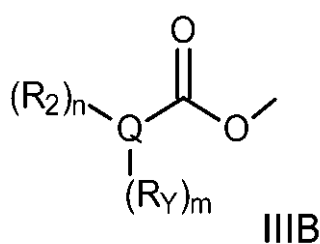
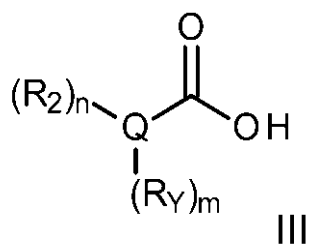
10

である。

【0187】

特定の式 I I I 及び I I I B

【化 8 8】



20

(式中、Q、 R_2 、 R_Y 、m及びnは、式 I に定義されているとおりである)
 の化合物は、新規であり、上記の方法によって調製可能である。。従って、64種の式 I I I の化合物及び64種の式 I I I B の化合物が利用可能になり、ここで、置換基 R_2 及び任意選択により R_Y を含有する基Qは、表A-1～A-64において定義されている R_Q に対応する。

【0188】

本発明に係る式 I の化合物は、低い施用量でも有害生物防除の分野で予防的に及び／又は治療的に有益な有効成分であり、これは、非常に好ましい殺生物スペクトルを有し、温血動物種、魚類及び植物によって良好な耐容性を示される。本発明に係る有効成分は、昆虫又はダニ目 (Acarina) の代表例などの通常感受性の動物有害生物だけでなく、耐性がある動物有害生物のすべて又は個々の发育段階に対しても作用する。本発明に係る有効成分の殺虫又は殺ダニ活性は、直接、すなわち直ちに又はいくらかの時間が経過してから初めて、例えば脱皮中に起こる有害生物の破壊として又は間接的に、例えば減少した産卵及び／又は孵化率として現れることがある。

30

【0189】

上記の動物有害生物の例は以下のとおりである：

ダニ目 (Acarina) から、例えばアカリツス属 (Acalitus spp)、アカルス属 (Aculus spp)、アカリカルス属 (Acaricalus spp)、アセリア属 (Aceria spp)、アシプトコナダニ (Acarus siro)、キララマダニ属 (Amblyomma spp.)、ナガヒメダニ属 (Argas spp.)、ウシマダニ属 (Boophilus spp.)、ブレビパルパス属 (Brevipalpus spp.)、ブリオビア属 (Bryobia spp)、カリピトリメルス属 (Calipitrimerus spp.)、ショクヒヒゼンダニ属 (Choriotptes spp.)、ワクモ (Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス属 (Dermatophagoides spp)、エオテトラニカス属 (Eotetranychus spp)、エリオフィエス属 (Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス属 (Hemitarsonemus spp)、イ

40

50

ボマダニ属 (*Hyalomma* spp.)、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)、オリゴニクス属 (*Olygonychus* spp.)、カズキダニ属 (*Ornithodoros* spp.)、ポリファゴタルソネ・ラタス (*Polyphagotarsonus latus*)、パロニクス属 (*Panonychus* spp.)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptiruta oleivora*)、フィトネムス属 (*Phytonemus* spp.)、ポリファゴタロソネムス属 (*Polyphagotarsonemus* spp.)、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属 (*Sarcoptes* spp.)、ステネオタルソネムス属 (*Steneotarsonemus* spp.)、ホコリダニ属 (*Tarsonemus* spp.) 及びテトラニクス属 (*Tetranychus* spp.) ;

シラミ目 (*Anoplura*) から、例えばブタジラミ属 (*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属 (*Linognathus* spp.)、ペディクルス属 (*Pediculus* spp.)、ペムフィグス属 (*Pemphigus* spp.) 及びフィロキセラ属 (*Phylloxera* spp.) ;

鞘翅目 (*Coleoptera*) から、例えばアグリオテス属 (*Agrion* spp.)、アンフィマロン・マジャレ (*Amphimallon majale*)、セマダラコガネ (*Anomala orientalis*)、アントノムス属 (*Anthonomus* spp.)、マグソコガネ属 (*Aphodius* spp.)、アスチラス・アトロマクラタス (*Astylus atromaculatus*)、アテニウス属 (*Ataenius* spp.)、アトマリア・リネアリス (*Atomaria linearis*)、カエトクネマ・チビアリス (*Chaetocnema tibialis*)、セロトマ属 (*Cerotoma* spp.)、コノデルス属 (*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属 (*Cosmopolites* spp.)、コチニス・ニチダ (*Cotinis nitida*)、クルクリオ属 (*Curculio* spp.)、シクロセファラ属 (*Cyclocephala* spp.)、デルメステス属 (*Dermestes* spp.)、ジアブロチカ属 (*Diabrotica* spp.)、アブデルスツノカブトムシ (*Diloboderus abderus*)、エピラクナ属 (*Epilachna* spp.)、エレムヌス属 (*Eremnus* spp.)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、コーヒーノミキクイムシ (*Hypothenemus hampei*)、ラグリア・フイロサ (*Lagria villosa*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、リッソルホプトルス属 (*Lissorhopterus* spp.)、リオゲニス属 (*Liogenys* spp.)、マエコラスピス属 (*Maecolaspis* spp.)、アカビロウドコガネ (*Maladera castanea*)、メガセリス属 (*Megascelis* spp.)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属 (*Melolontha* spp.)、マイオクロウス・アルマツス (*Myochrous armatus*)、オリカエフィルス属 (*Orycaephilus* spp.)、オチオリンクス属 (*Otiorynchus* spp.)、フィロファガ属 (*Phyllophaga* spp.)、フリクチヌス属 (*Phlyctinus* spp.)、ポピリア属 (*Popillia* spp.)、プシリオデス属 (*Psylliodes* spp.)、リソマツス・アウブチリス (*Rhyssomatus aubtilis*)、リゾペルタ属 (*Rhizopertha* spp.)、コガネムシ科 (*Scarabaeidae*)、シトフィルス属 (*Sitophilus* spp.)、シトトルガ属 (*Sitotroga* spp.)、ソマチカス属 (*Somaticus* spp.)、スフェノフォラス属 (*Sphenophorus* spp.)、ステルネクススプ・シグナツス (*Sternechus subsignatus*)、ゴミムシダマシ属 (*Tenebrio* spp.)、トリボリウム属 (*Tribolium* spp.) 及びトロゴデルマ属 (*Trogoderma* spp.) ;

10

20

30

40

50

双翅目 (Diptera) から、例えばヤブカ属 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ属 (*Anopheles* spp.)、アンテリゴナ・ソカタ (*Antherigona soccata*)、オリーブミバエ (*Bactrocea oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、ブラジシア属 (*Bradysia* spp.)、クロバエ (*Calliphora erythrocephala*)、セラチチス属 (*Ceratitis* spp.)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp.)、イエカ属 (*Culex* spp.)、クテレブラ属 (*Cuterebra* spp.)、ダクス属 (*Dacus* spp.)、デリア属 (*Delia* spp.)、キイロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、ヒメイエバエ属 (*Fannia* spp.)、ガストロフィラス属 (*Gastrophilus* spp.)、ゲオミザ・トリプンクタタ (*Geomyza tripunctata*)、ツエツエバエ属 (*Glossina* spp.)、ヒフバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ヒッポボスカ属 (*Hyppobosca* spp.)、リリオミザ属 (*Liriomyza* spp.)、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、メラナグロミザ属 (*Melanagromyza* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、オルセオリア属 (*Orseolia* spp.)、キモグリバエ (*Oscinella frit*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、ホルビア属 (*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属 (*Rhagoletis* spp.)、リベリア・クアドリファシアタ (*Rivellia quadrifasciata*)、スカテラ属 (*Scatella* spp.)、キノコバエ属 (*Sciara* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、タニア属 (*Tannia* spp.) 及びガガンボ属 (*Tipula* spp.) ;

半翅目 (Hemiptera) から、例えばアカントコリス・スカブラトル (*Acanthocoris scabrator*)、アクロステルナム属 (*Acrosternum* spp.)、ウススジカスミカメムシ (*Adelphocoris lineolatus*)、アンブリペルタ・ニチダ (*Amblypelta nitida*)、パチコエリア・タラシナ (*Bathycoelia thalassina*)、ブリサス属 (*Blissus* spp.)、トコジラミ属 (*Cimex* spp.)、クラビグララ・トメントシコリス (*Clavigralla tomentosicollis*)、クレオンチアデス属 (*Creontiades* spp.)、ジスタンチエラ・テオブロマ (*Distantiella theobroma*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジスデルクス属 (*Dysdercus* spp.)、エデッサ属 (*Edessa* spp.)、ユーキスツス属 (*Euchistus* spp.)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、エウリガステル属 (*Eurygaster* spp.)、クサギカメムシ (*Halyomorpha halys*)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリスア属 (*Leptocoris* spp.)、メクラカメムシ属 (*Lygus* spp.)、マルガロデス属 (*Margarodes* spp.)、ムルガンチア・ヒストリオニク (*Murgantia histrionica*)、ネオメガロトムス属 (*Neomegalotomus* spp.)、タバコカスミカメムシ (*Nesidiocoris tenuis*)、ネザラ属 (*Nezara* spp.)、ニシウス・シムランス (*Nysius simulans*)、オエバルス・インスラリス (*Oebalus insularis*)、ピエスマ属 (*Piesma* spp.)、ピエゾドルス属 (*Piezodorus* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノファラ属 (*Scotinophara* spp.)、チアントア属 (*Thyanta* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ヴァチガ・イルデンス (*Vatiga illudens*) ;

アシルトシウム・ピスム (*Acyrtosium pisum*)、アダルゲス属 (*Ad*

alges spp)、アガリアナ・エンシゲラ (*Agalliana ensigera*)、アゴノセナ・タルギオニイ (*Agonoscena targionii*)、アレウロジクス属 (*Aleurodicus* spp)、アレウロカンツス属 (*Aleurocanthus* spp)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロックス (*Aleurothrixus floccosus*)、アレイロデス・ブラシカエ (*Aleyrodes brassicae*)、フタテンミドリヨコバイ (*Amarasca biguttula*)、アムリトズス・アトキンソニ (*Amritodus atkinsoni*)、アノニジエラ属 (*Aonidiella* spp.)、アリマキ科 (*Aphididae*)、ワタアブラムシ属 (*Aphis* spp.)、アスピジオツス属 (*Aspidiotus* spp.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、バクテリセラ・コッケレリ (*Bactericera cockerelli*)、ベミシア属 (*Bemisia* spp)、ブラキカウズス属 (*Brachycaudus* spp)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属 (*Cacopsylla* spp)、ニンジンフタオアブラムシ (*Cavariella aegopodii* Scop.)、セロプラスタ属 (*Ceroplaster* spp.)、クリソムファルス・アオニジウム (*Chrysomphalus aonidium*)、オンシツマルカイガラムシ (*Chrysomphalus dictyospermum*)、シカデラ属 (*Cicadella* spp)、シロオオヨコバイ (*Cofana spectra*)、クリプトミズス属 (*Cryptomyzus* spp)、シカデュリナ属 (*Cicadulina* spp)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、ジアレウロデス属 (*Dialeurodes* spp)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジサフィス属 (*Dysaphis* spp)、エンポアスカ属 (*Empoasca* spp.)、リンゴワタムシ (*Eriosoma larigerum*)、エリスロネウラ属 (*Erythroneura* spp.)、ガスカルジア属 (*Gascardia* spp.)、グリカスピス・ブリンブレコンベイ (*Glycaspis brimblecumbi*)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (*Hyadaphis pseudo brassicae*)、ヒアロプテルス属 (*Hyalopterus* spp)、ヒペロミズス・パリズス (*Hyperomyzus pallidus*)、リュウガンズキンヨコバイ (*Idioscopus clypealis*)、ヤコビアスカ・リビカ (*Jacobiasca lybica*)、ラオデルファクス属 (*Laodelphax* spp.)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、レピドサフェス属 (*Lepidosaphes* spp.)、ニセダイコンアブラムシ (*Lopaphis erysimi*)、リオゲニス・マイジス (*Lyogenys maidis*)、マクロシフム属 (*Macrosiphum* spp.)、マハナルヴァ属 (*Mahanarva* spp)、メタカルファ・プルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、ムギウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、ミンズス・クルズス (*Myndus crudus*)、ミズス属 (*Myzus* spp.)、ネオトキシプテラ属 (*Neotoxoptera* sp)、ツマグロヨコバイ属 (*Nephoteutix* spp.)、ニラバルバタ属 (*Nilaparvata* spp.)、ナシミドリオオアブラムシ (*Nippolachnus piri* Mats)、オドナスピス・ルタエ (*Odonaspis ruthae*)、オレグマ・ラニゲラ・ゼンター (*Oregma lanigera* Zehnter)、ヤマモモコナジラミ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ・コッケレリ (*Paratrionza cockerelli*)、パルラトリア属 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属 (*Pemphigus* spp.)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエラ属 (*Perkinsiella* spp)、ホップイボアブラムシ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属 (*Phylloxera*

- a spp)、プラノコッカス属 (*Planococcus* spp.)、シューダウラカスピス属 (*Pseudaulacaspis* spp.)、シュードコッカス属 (*Pseudococcus* spp.)、ワタノミハムシ (*Pseudatomoscelis seriatus*)、プシラ属 (*Psylla* spp.)、プルビナリア・エチオピカ (*Pulvinaria aethiopica*)、クアドラズピジオツス属 (*Quadrastidiotus* spp.)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、ロパロシフム属 (*Rhopalosiphum* spp.)、サイセチア属 (*Saissetia* spp.)、スカホイデウス属 (*Scaphoideus* spp.)、スチザフィス属 (*Schizaphis* spp.)、シトビオン属 (*Sitobion* spp.)、セジロウ 10
ンカ (*Sogatella furcifera*)、スピシスチルス・フェスチヌス (*Spissistilus festinus*)、タロファガス・プロセルピナ (*Tarophagus Proserpina*)、トキソプテラ属 (*Toxoptera* spp.)、トリアレウロデス属 (*Trialeurodes* spp.)、トリジスカス・スポロ 20
ボリ (*Tridiscus sporoboli*)、トリオニムス属 (*Trionymus* spp.)、ミカントガリキジラミ (*Trioza erytreae*)、ニセヤノネ
カイガラムシ (*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ (*Zygina flammigera*)、ジギニジア・スクテラリス (*Zyginidia scutellaris*) ;
- 膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えばヒメハキリアリ属 (*Acromyrmex*)、アルゲ属 (*Arge* spp)、ハキリアリ属 (*Atta* spp.)、セフス 20
属 (*Cephus* spp.)、ジプリオン属 (*Diprion* spp.)、マツハバ
チ科 (*Diprionidae*)、シマトウヒハバチ (*Gilpinia polytoma*)、ホプロカンパ属 (*Hoplocampa* spp.)、ケアリ属 (*Lasius* spp.)、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、ネオジプ 30
リオン属 (*Neodiprion* spp.)、シュウカクアリ属 (*Pogonomyrmex* spp)、スレノプシス・インビクタ (*Slenopsis invicta*)、ソレノプシス属 (*Solenopsis* spp.) 及びベスパ属 (*Vespa* spp.) ;
- 等翅目 (*Isoptera*) から、例えばコプトテルメス属 (*Coptotermes* spp) 、コルニテルネス・クムランス (*Cornitermes cumulans*) 、インシシテルメス属 (*Incisitermes* spp) 、マクロテルメス属 (*Macrotermes* spp) 、マストテルメス属 (*Mastotermes* spp) 、ミクロテルメス属 (*Microtermes* spp) 、ヤマトシロアリ属 (*Reticulitermes* spp.) ;ソレノプシス・ゲミナテ (*Solenopsis geminate*) 30
- 鱗翅目 (*Lepidoptera*) から、例えばアクレリス属 (*Accleris* spp.)、アドキソフィエス属 (*Adoxophyes* spp.)、アエゲリア属 (*Aegeria* spp.)、アグロティス属 (*Agrotis* spp.)、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillaceae*)、アミロイス属 (*Amylois* spp.)、アンチカルシア・ゲマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルチップス属 (*Archips* spp.)、アルギレスチア属 (*Argyresthia* spp) 、アルギロタエニア属 (*Argyrotaenia* spp.)、アウトグラファ属 (*Autographa* spp.)、ブクラトリクス・ツルベ 40
リエラ (*Bucculatrix thurberiella*)、アフリカズイム (*Busseola fusca*)、スジマラダメイガ (*Cadra cautella*)、モ
モシンクイガ (*Carposina nipponensis*)、チロ属 (*Chilo* spp.)、コリストネウラ属 (*Choristoneura* spp.)、クリソテウ
チア・トピアリア (*Chrysoteuchia topiaria*)、ブドウホソハマ 50
キ (*Clysia ambiguella*)、クナファクロシス属 (*Cnaphalo*

crocis spp.)、クネファシア属 (*Cnephasia* spp.)、コチリス属 (*Cochylis* spp.)、コレオフォラ属 (*Coleophora* spp.)、コリアス・レスビア (*Colias lesbia*)、ワタアカキリバ (*Cosmophila flava*)、クラムバス属 (*Crambus* spp.)、ケブカノメイガ (*Crocidolomia binotalis*)、クリプトフレビア・ロイコトレタ (*Cryptophlebia leucotreta*)、シダリマ・ペルスペクタリス (*Cydalis perspectalis*)、シジア属 (*Cydia* spp.)、ジアファニア・ペルスペクタリス (*Diaphania perspectalis*)、ジアトラエア属 (*Diatraea* spp.)、ジパロプシス・カスタネア (*Diparopsis castanea*)、エアリアス属 (*Earias* spp.)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属 (*Ephestia* spp.)、エピノチア属 (*Epinotia* spp.)、エスチグメネ・アクレア (*Estigmene acrea*)、エチエラ・ジンキネラ (*Etiella zinckinella*)、ユーコスマ属 (*Eucosma* spp.)、ブドウホソハマキ (*Eupoecilia ambiguella*)、ユープロクチス属 (*Euproctis* spp.)、ユークソア属 (*Euxoa* spp.)、フェルチア・ジャクリフェリア (*Feltia jaculiferia*)、グラホリタ属 (*Grapholita* spp.)、ヘディア・ヌビフェラナ (*Hedya nubiferana*)、ヘリオティス属 (*Heliothis* spp.)、ハイマダラノメイガ (*Hellicia undalis*)、ヘルペトグラマ属 (*Herpetogramma* spp.)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、ケイフェリア・リコベルシセラ (*Keiferia lycopersicella*)、モロコシマダラメイガ (*Lasmeipala lignosella*)、レウコプテラ・シテラ (*Leucopoptera scitella*)、リトコレチス属 (*Lithocolletia* spp.)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana*)、ロキソステゲ・ビフィダリス (*Loxostege bifidalis*)、リマントリア属 (*Lymantria* spp.)、リオネチア属 (*Lyonetia* spp.)、マラコスマ属 (*Malacosoma* spp.)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ (*Manduca sexta*)、ミチムナ属 (*Mythimna* spp.)、ノクツア属 (*Noctua* spp.)、オペロフテラ属 (*Operophtera* spp.)、オルニオデス・インディカ (*Orniodes indica*)、アワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属 (*Pammene* spp.)、パンデミス属 (*Pandemis* spp.)、マツキリガ (*Panolis flammea*)、パパイペマ・ネブリス (*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ (*Perileucopoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ピエリス属 (*Pieris* spp.)、コナガ (*Plutella xylostella*)、プレイス属 (*Prays* spp.)、シュードブルシア属 (*Pseudoplusia* spp.)、ラキプルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、リチア・アルビコスタ (*Richia albicosta*)、シルポファガ属 (*Scirpophaga* spp.)、セサミア属 (*Sesamia* spp.)、スパルガノチス属 (*Sparganotheris* spp.)、スポドプテラ属 (*Spodoptera* spp.)、シレプタ・デロガテ (*Sylepta derogate*)、シナンテドン属 (*Synanthedon* spp.)、タウメトポエア属 (*Thaumetopoea* spp.)、トルトリックス属 (*Tortrix* spp.)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*) 及びスガ属 (*Yponomeuta* spp.) ;

食毛目 (*Mallorhaga*) から、例えばダマリネア属 (*Damalinea* s

pp.) 及びケモノハジラミ属 (*Trichodectes* spp.) ;

直翅目 (*Orthoptera*) から、例えばゴキブリ属 (*Blatta* spp.) 、チャバネゴキブリ属 (*Blattella* spp.) 、ケラ属 (*Gryllotalpa* spp.) 、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*) 、トノサマバッタ属 (*Locusta* spp.) 、ネオクルチラ・ヘキサダクチラ (*Neocurtilla hexadactyla*) 、ワモンゴキブリ属 (*Periplaneta* spp.) 、スカプテリスカス属 (*Scapteriscus* spp) 及びコオロギ属 (*Schistocerca* spp.) ;

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) から、例えばリポセリス属 (*Liposcelis* spp.) ;

ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えばナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp.) 、イヌノミ属 (*Ctenocephalides* spp.) 及びケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) ;

総翅目 (*Thysanoptera*) から、例えばカリオトリプス・ファセオリ (*Calliothrips phaseoli*) 、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella* spp.) 、ヘリオトリプス属 (*Heliothrips* spp) 、ヘルシノトリプス属 (*Hercinothrips* spp.) 、パルテノトリプス属 (*Parthenothrips* spp) 、シルトトリプス・アウランティ (*Scirtothrips aurantii*) 、ダイズアザミウマ (*Sericothrips variabilis*) 、タエニオトリプス属 (*Taeniothrips* spp.) 、アザミウマ属 (*Thrips* spp) ;

シミ目 (*Thysanura*) から、例えばセイヨウシミ (*Lepisma saccharina*) 。

【0190】

本発明に係る有効成分は、特に植物、特に有用な植物及び農業、園芸及び森林における観賞植物又はこのような植物の果実、花、葉、茎、塊茎又は根などの器官において発生する上記のタイプの有害生物を防除、すなわち抑制又は破壊するのに使用され得、場合によっては、後の時点で形成される植物器官でさえ、これらの有害生物から保護されたままである。

【0191】

好適な標的作物は、特に、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシ又はソルガムなどの穀物；テンサイ又は飼料用ビートなどのビート；果実、例えばリンゴ、セイヨウナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボ又は液果類、例えばイチゴ、ラズベリー又はブラックベリーなどの仁果類、核果類又は柔らかい果物；インゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメ又はダイズなどのマメ科作物；ナタネ、カラシナ、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ヤシ、ヒマ、カカオ又はアメリカホドイモ (*ground nut*) などの油脂作物；カボチャ、キュウリ又はメロンなどのウリ科植物；ワタ、アマ、麻又はジュートなどの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ又はタンジェリンなどの柑橘類の果物；ハウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ又はピーマンなどの野菜類；アボカド、シナモン又はショウノウなどのクスノキ科 (*Lauraceae*) の植物；及びさらにタバコ、堅果類、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、ブドウ、ホップ、オオバコ科の植物及びラテックス植物である。

【0192】

本発明の組成物及び／又は方法は、花、灌木、闊葉樹及び常緑樹を含むいずれかの観賞用及び／又は野菜作物でも用いられ得る。

【0193】

例えば、本発明は、以下の観賞用種：アゲラタム属の種 (*Ageratum* spp.) 、アロンソア属の種 (*Alonsoa* spp.) 、アネモネ属の種 (*Anemone* spp.) 、アニソドンテアカプセニシス (*Anisodonteia capseni*

10

20

30

40

50

sis)、アンテミス属の種 (Anthemis spp.)、アンチルリヌム属の種 (Antirrhinum spp.)、アステル属の種 (Aster spp.)、ベゴニア属の種 (Begonia spp.) (例えば、B. エラチオール (B. elatior)、B. セムペルフロレンス (B. semperflorens)、B. チュベレウクス (B. tubereux))、ブーゲンビレア属の種 (Bougainvillea spp.)、ブラキコメ属の種 (Brachycome spp.)、ブラシカ属の種 (Brassica spp.) (観賞用)、カルセオラリア属の種 (Calceolaria spp.)、トウガラシ (Capsicum annuum)、ニチニチソウ (Catharanthus roseus)、カンナ属の種 (Canna spp.)、ヤグルマギク属の種 (Centaurea spp.)、キク属の種 (Chrysanthemum spp.)、シネリア属の種 (Cineraria spp.) (C. マリチメ (C. maritima))、コレオプシス属の種 (Coreopsis spp.)、クラッスラコッキネア (Crassula coccinea)、タバコソウ (Cuphea ignea)、ダリア属の種 (Dahlia spp.)、デルフィニウム属の種 (Delphinium spp.)、ケマンソウ (Dicentra spectabilis)、ドロテアンツス属の種 (Dorotheantus spp.)、トルコギキョウ (Eustoma grandiflorum)、レンギョウ属の種 (Forsythia spp.)、フクシア属の種 (Fuchsia spp.)、ゼラニウムグナファリウム (Geranium gnaphalium)、ガーベラ属の種 (Gerbera spp.)、センニチコウ (Gomphrena globosa)、ヘリオトロピウム属の種 (Heliotropium spp.)、ヘリアンツス属の種 (Helianthus spp.)、ハイビスカス属の種 (Hibiscus spp.)、ホルテンシア属の種 (Hortensia spp.)、ハイドランジア属の種 (Hydrangea spp.)、ヒポエステスフィロスタシア (Hypoestes phyllostachya)、インパチエンス属の種 (Impatiens spp.) (アフリカハウセンカ (I. Walleriana))、イレシネス属の種 (Iresines spp.)、カランコエ属の種 (Kalanchoe spp.)、ランタナ (Lantana camara)、ハナアオイ (Lavatera trimestris)、カエンキセワタ (Leonotis leonurus)、ユリ属の種 (Lilium spp.)、メセンムリアンテマム属の種 (Mesembryanthemum spp.)、ミムラス属の種 (Mimulus spp.)、ヤグルマハッカ属の種 (Monarda spp.)、ネメシア属の種 (Nemesia spp.)、タゲテス属の種 (Tagetes spp.)、ダイアンサス属の種 (Dianthus spp.) (カーネーション)、カンナ属の種 (Canna spp.)、オキザリス属の種 (Oxalis spp.)、ベリス属の種 (Bellis spp.)、ペラルゴニウム属の種 (Pelargonium spp.) (アイビーゼラニウム (P. peltatum))、モンテンジクアオイ (P. Zonale)、スミレ属の種 (Viola spp.) (パンジー)、ペチュニア属の種 (Petunia spp.)、フロックス属の種 (Phlox spp.)、プレクトランツス属の種 (Plecthranthus spp.)、ポインセチア属の種 (Poinsettia spp.)、パルテノキスス属の種 (Parthenocissus spp.) (アメリカヅタ (P. quinquefolia))、ツタ (P. tricuspidata)、プリムラ属の種 (Primula spp.)、キンボウゲ属 (Ranunculus spp.)、ツツジ属の種 (Rhododendron spp.)、バラ属の種 (Rosa spp.) (バラ)、ルドベキア属の種 (Rudbeckia spp.)、アフリカスミレ属の種 (Saintpaulia spp.)、サルビア属の種 (Salvia spp.)、スカエボラアエモラ (Scaevola aemola)、シザンサスウィセトネンシス (Schizanthus wisetonensis)、セダム属の種 (Sedum spp.)、ナス属の種 (Solanum spp.)、スルフィニア属の種 (Surfinia spp.)、タゲテス属の種 (Tagetes spp.)、ニコチニア属の種 (Nico

10

20

30

40

50

t i n i a s p p .) 、バーベナ属の種 (V e r b e n a s p p .) 、ヒャクニチソウ属の種 (Z i n n i a s p p .) 及び他の花壇用植物のいずれかにおいて用いられ得る。

【0194】

例えば、本発明は、以下の野菜種：ネギ属の種 (A l l i u m s p p .) (ニンニク (A . s a t i v u m) 、タマネギ (A . c e p a) 、エシャロット (A . o s c h a n i n i i) 、リーキ (A . P o r r u m) 、ワケギ (A . a s c a l o n i c u m) 、ネギ (A . f i s t u l o s u m)) 、チャービル (A n t h r i s c u s c e r e f o l i u m) 、セロリ (A p i u m g r a v e o l u s) 、アスパラガス (A s p a r a g u s o f f i c i n a l i s) 、ビート (B e t a v u l g a r u s) 、ブラシカ属の種 (B r a s s i c a s p p .) (ヤセイカンラン (B . O l e r a c e a) 、ハクサイ (B . P e k i n e n s i s) 、カブ (B . r a p a)) 、トウガラシ (C a p s i c u m a n n u u m) 、ヒヨコマメ (C i c e r a r i e t i n u m) 、エンダイブ (C i c h o r i u m e n d i v i a) 、チコルム属の種 (C i c h o r u m s p p .) (チコリー (C . i n t y b u s) 、エンダイブ (C . e n d i v i a)) 、スイカ (C i t r i l l u s l a n a t u s) 、ククミス属の種 (C u c u m i s s p p .) (サフラン (C . s a t i v u s) 、メロン (C . m e l o)) 、ククルビタ属の種 (C u c u r b i t a s p p .) (ペポカボチャ (C . p e p o) 、西洋カボチャ (C . m a x i m a)) 、シアナラ属の種 (C y a n a r a s p p .) (アーティチョーク (C . s c o l y m u s) 、カルドン (C . c a r d u n c u l u s)) 、ニンジン (D a u c u s c a r o t a) 、フェンネル (F o e n i c u l u m v u l g a r e) 、オトギリソウ属の種 (H y p e r i c u m s p p .) 、レタス (L a c t u c a s a t i v a) 、トマト属の種 (L y c o p e r s i c o n s p p .) (トマト (L . e s c u l e n t u m) 、トマト (L . l y c o p e r s i c u m)) 、ハッカ属の種 (M e n t h a s p p .) 、バジル (O c i m u m b a s i l i c u m) 、パセリ (P e t r o s e l i n u m c r i s p u m) 、インゲンマメ属の種 (P h a s e o l u s s p p .) (ムシトリスミレ (P . v u l g a r i s) 、ベニバナインゲン (P . c o c c i n e u s)) 、エンドウ (P i s u m s a t i v u m) 、ダイコン (R a p h a n u s s a t i v u s) 、マルバダイオウ (R h e u m r h a p o n t i c u m) 、マンネンロウ属の種 (R o s e m a r i n u s s p p .) 、サルビア属の種 (S a l v i a s p p .) 、キバナバラモンジン (S c o r z o n e r a h i s p a n i c a) 、ナス (S o l a n u m m e l o n g e n a) 、ホウレンソウ (S p i n a c e a o l e r a c e a) 、バレリアネラ属の種 (V a l e r i a n e l l a s p p .) (ノヂシャ (V . l o c u s t a) 、 V . エリオカルパ (V . e r i o c a r p a)) 及びソラマメ (V i c i a f a b a) のいずれかにおいて用いられ得る。

【0195】

好ましい観賞用種としては、セントポーリア、ペゴニア、ダリア、ガーベラ、アジサイ、クマツヅラ、バラ属 (R o s a) 、カランコエ属 (K a l a n c h o e) 、ポインセチア、アスター、ヤグルマギク属 (C e n t a u r e a) 、キンケイギク属 (C o r e o p s i s) 、ヒエンソウ属 (D e l p h i n i u m) 、ヤグルマハッカ属 (M o n a r d a) 、フロックス属 (P h l o x) 、ルドベキア属 (R u d b e c k i a) 、セダム属 (S e d u m) 、ペチュニア、ビオラ属 (V i o l a) 、ホウセンカ、ゼラニウム、キク属 (C h r y s a n t h e m u m) 、キンボウゲ属 (R a n u n c u l u s) 、フクシア、サルビア、セイヨウアジサイ、ローズマリー、セージ、セイヨウオトギリソウ、ミント、シシトウガラシ、トマト及びキュウリが挙げられる。

【0196】

本発明に係る有効成分は、ワタ、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物におけるマメアブラムシ (A p h i s c r a c c i v o r a) 、ディアブロチカ・バルテアタ (D i a b r o t i c a b a l t e a t a) 、ニセアメリカタバコガ (H e l i o t h i s v i r e s c e n s) 、モモアカアブラムシ (M y z u s p e r s i c a e) 、コナ

10

20

30

40

50

ガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) を防除するのに特に好適である。本発明に係る有効成分は、マメストラ属 (*Mamestra*) (好ましくは、野菜中)、コドリंगा (*Cydia pomonella*) (好ましくは、リンゴ中)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは、野菜、ブドウ園中)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくは、ジャガイモ中) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくは、イネ中) を防除するのにさらに特に好適である。

【0197】

本発明に係る有効成分は、綿、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物における、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除に特に好適である。本発明に係る有効成分は、ヨトウガ (*Mamestra*) (好ましくは野菜におけるもの)、コドリinga (*Cydia pomonella*) (好ましくはリンゴにおけるもの)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは野菜、ブドウ園におけるもの)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくはジャガイモにおけるもの) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくはイネにおけるもの) の防除に特に好適である。

【0198】

さらなる態様において、本発明は、植物寄生性線虫 (内部寄生性、半内部寄生性及び外部寄生性線虫)、特にネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*) 及び他のメロイドギネ属 (*Meloidogyne*) 種; シスト形成センチュウ、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 及び他のグロボデラ属 (*Globodera*) 種; ムギシストセンチュウ (*Heterodera avenae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*) 及び他のヘテロデラ属 (*Heterodera*) 種; タネコブセンチュウ、アングナ属 (*Anguina*) 種; クキセンチュウ及びハセンチュウ、アフエレンコイデス属 (*Aphelenchoides*) 種; 刺毛センチュウ (*Sting nematode*)、ベロノライムス・ロングカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*) 及び他のベロノライムス属 (*Belonolaimus*) 種; マツセンチュウ、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 及び他のパーサフェレンカス属 (*Bursaphelenchus*) 種; ワセンチュウ (*Ring nematode*)、クリコネマ属 (*Criconema*) 種、クリコネメラ属 (*Criconemella*) 種、クリコネモイデス属 (*Criconemoides*) 種、メソクリコネマ属 (*Mesocriconema*) 種; クキ及びリンケイセンチュウ、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*) 及び他のジチレンクス属 (*Ditylenchus*) 種; キリセンチュウ (*Awl nematode*)、ドリコドルス属 (*Dolichodorus*) 種; ラセンセンチュウ (*Spiral nematode*)、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス (*Helicotylenchus multicinctus*) 及び他のヘリオコチレンクス属 (*Helicotylenchus*) 種; サヤセンチュウ及びサヤワセンチュウ (*Sheath and sheathoid nematode*)、ヘミシクリオホラ属 (*Hemicycliophora*) 種及びヘミクリコネモイデス属 (*Hemicriconemoides*) 種; ヒルスマンニエラ属 (*Hirshmanniella*

) 種；ヤリセンチュウ (*Lance nematode*)、ホプロライムス (*Hoploaimus*) 種；ニセネコブセンチュウ、ナコブス属 (*Nacobbus*) 種；ハリセンチュウ (*Needle nematode*)、ロンギドルス・エロンガツス (*Longidorus elongatus*) 及び他のロンギドルス属 (*Longidorus*) 種；ピンセンチュウ (*Pin nematode*)、プラチレンクス属 (*Pratylenchus*) 種；ネグサレセンチュウ (*Lesion nematode*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・カービタツス (*Pratylenchus curvatus*)、プラチレンクス・ゴオデイ (*Pratylenchus goodeyi*) 及び他のプラチレンクス属 (*Pratylenchus*) 種；ネモグリセンチュウ (*Burrowing nematode*)、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) 及び他のラドホルス属 (*Radopholus*) 種；ニセフクロセンチュウ (*Reniform nematode*)、ロチレンクス・ロブスタス (*Rotylenchus robustus*)、ロチレンクス・レニフォルミス (*Rotylenchus reniformis*) 及び他のロチレンクス属 (*Rotylenchus*) 種；スクテロネマ属 (*Scutellonema*) 種；ミハリセンチュウ (*Stubby root nematode*)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*) 及び他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) 種、パラトリコドルス属 (*Paratrichodorus*) 種；イシュクセンチュウ (*Stunt nematode*)、ナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・デュビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) 及び他のチレンコリンクス属 (*Tylenchorhynchus*) 種；ミカンセンチュウ (*Citrus nematode*)、チレンクルス属 (*Tylenchulus*) 種；オオハリセンチュウ (*Dagger nematode*)、キシフィネマ属 (*Xiphinema*) 種などの植物寄生性線虫；並びにスバンギナ属 (*Subanguina* spp.)、ヒブソペリン属 (*Hypsoperine* spp.)、マクロポストニア属 (*Macroposthonia* spp.)、メリニウス属 (*Melinius* spp.)、プンクトデラ属 (*Punctodera* spp.) 及びキニスルシウス属 (*Quinisulcius* spp.) などの他の植物寄生性線虫種による植物及び植物の部分への被害を防除する方法にも関する。

【0199】

本発明の化合物は、軟体動物に対しても活性を有し得る。軟体動物の例としては、例えば、スクミリングガイ科 (*Ampullariidae*)；アリオン属 (*Arion*) (*コウラクロナメクジ* (*A. ater*)、*A. サーカムスクリプツス* (*A. circumscriptus*)、*A. ホルテンシス* (*A. hortensis*)、*A. ルーフアス* (*A. rufus*))；オナジマイマイ科 (*Bradybaenidae*) (*ブラジバエナ・フルチウム* (*Bradybaena fruticum*))；オウシュウマイマイ属 (*Cepaea*) (*ニワノオウシュウマイマイ* (*C. hortensis*)、*モリマイマイ* (*C. Nemoralis*))；オクロジナ (*ochlodina*)；デロセラス属 (*Deroceras*) (*D. アグレスチス* (*D. agrestis*)、*D. エムピリコルム* (*D. empiricorum*)、*D. ラエヴェ* (*D. laeve*)、*D. レチクラツム* (*D. reticulatum*))；ディスクス属 (*Discus*) (*D. ロツンダツス* (*D. rotundatus*))；ユーオムファリア属 (*Euomphalia*)；ガルバ属 (*Galba*) (*G. トルンクラタ* (*G. trunculata*))；ヘリセリア属 (*Helicella*) (*H. イタラ* (*H. itala*)、*H. オブヴィア* (*H. obvia*))；マイマイ科 (*Helicidae*) *ヘリシゴナ・アルブストルム* (*Helicigona arbustorum*)；*ヘリコディスクス属* (*Helicodiscus*)；*ヘリクス属* (*Helix*) (*H. アペルタ* (*H. aperta*))；*リマックス属* (*Limax*) (*L. シネレオニゲル* (*L. cinereoniger*)、*キイロナメクジ*

(*L. flavus*)、チャコウラナメクジ (*L. marginatus*)、マダラコウラナメクジ (*L. maximus*)、*L. テネルス* (*L. tenellus*)；モノアライガイ属 (*Lymnaea*)；ミラックス属 (*Milax*) (ニワコウラナメクジ (*M. gagates*)、*M. マルギナツス* (*M. marginatus*)、*M. ソウエルビイ* (*M. sowerbyi*))；オペアス属 (*Opeas*)；リングガイ属 (*Pomacea*) (スクミリングガイ (*P. canaticulata*))；ミジンマイマイ属 (*Valonia*) 及びザニトイデス属 (*Zanitoidea*) が挙げられる。

【0200】

「作物」という用語は、例えば、毒素産生細菌、特にバチルス属 (*Bacillus*) の細菌に由来する公知のような1つ又は複数の選択的に作用する毒素を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。

【0201】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る毒素としては、例えば、セウス菌 (*Bacillus cereus*) 又はバチルス・ポピリエ (*Bacillus popilliae*) に由来する殺虫タンパク質；又は δ -エンドトキシン、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1又はCry9Cなど、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する殺虫タンパク質又は植物性殺虫タンパク質 (*Vip*)、例えばVip1、Vip2、Vip3又はVip3A；又は細菌コロニー形成線虫、例えばフォトラブダス・ルミネセンス (*Photobacterium luminescens*)、キセノラブダス・ネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などのフォトラブダス属 (*Photobacterium* spp. 又はキセノラブダス属 (*Xenorhabdus* spp.)) の殺虫タンパク質；サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素及び他の昆虫に特有の神経毒素など、動物によって産生される毒素；ストレプトマイセス属 (*Streptomyces*) 毒素など、真菌によって産生される毒素、エンドウレクチン、オオムギレクチン又はユキノハナレクチンなどの植物レクチン；凝集素；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤などのプロティナーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシーRIP、アブリン、ルフイン、サポリン又はブリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質 (RIP)；3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、HMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼが挙げられる。

【0202】

本発明に関して、 δ -エンドトキシンは、例えば、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1又はCry9C又は植物性殺虫タンパク質 (*Vip*)、例えばVip1、Vip2、Vip3又はVip3A、また、明確に、ハイブリッド毒素、切断毒素及び改変毒素によって理解される。ハイブリッド毒素は、それらのタンパク質の異なるドメインの新たな組合せによって組み換えにより産生される (例えば、国際公開第02/15701号を参照されたい)。切断毒素、例えば切断Cry1Abが公知である。改変毒素の場合、天然毒素の1つ又は複数のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換では、好ましくは、天然に存在しないプロテアーゼ認識配列が、毒素に挿入され、例えばCry3A055の場合、カテプシン-GR認識配列が、Cry3A毒素に挿入される (国際公開第03/018810号を参照されたい)。

【0203】

このような毒素又はこのような毒素を合成することが可能なトランスジェニック植物の

例は、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書及び国際公開第03/052073号に開示されている。

【0204】

このようなトランスジェニック植物の調製の方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。Cry I型のデオキシリボ核酸及びそれらの調製は、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0367474号明細書、欧州特許出願公開第0401979号明細書及び国際公開第90/13651号から公知である。

10

【0205】

トランスジェニック植物に含まれる毒素は、害虫に対する耐性を植物に与える。このような昆虫は、昆虫の分類群において見られるが、甲虫（鞘翅目（Coleoptera））、双翅昆虫（双翅目（Diptera））及び蛾（鱗翅目（Lepidoptera））において特に一般的に見られる。

【0206】

殺虫剤耐性（insecticidal resistance）をコードし、1つ又は複数の毒素を発現する1つ又は複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかが市販されている。このような植物の例は、YieldGard（登録商標）（Cry1Ab毒素を発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Rootworm（登録商標）（Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Plus（登録商標）（Cry1Ab及びCry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）；Starlink（登録商標）（Cry9C毒素を発現するトウモロコシ品種）；Herculex I（登録商標）（Cry1Fa2毒素及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るための酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ（PAT）を発現するトウモロコシ品種）；NuCOTN 33B（登録商標）（Cry1Ac毒素を発現するワタ品種）；Bollgard I（登録商標）（Cry1Ac毒素を発現するワタ品種）；Bollgard II（登録商標）（Cry1Ac及びCry2Ab毒素を発現するワタ品種）；VipCot（登録商標）（Vip3A及びCry1Ab毒素を発現するワタ品種）；NewLeaf（登録商標）（Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種）；NatureGard（登録商標）、AgriSure（登録商標）GT Advantage（GA21グリホサート耐性形質）、AgriSure（登録商標）CB Advantage（Bt11アワノメイガ（CB）形質）及びProtecta（登録商標）である。

20

30

【0207】

このようなトランスジェニック作物のさらなる例は以下のとおりである：

1. Syngenta Seeds SAS（Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France）製のBt11トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。切断Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ（アワノメイガ（Ostrinia nubilalis）及びセサミア・ノナグリオイデス（Sesamia nonagrioides））による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt11トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。

40

【0208】

2. Syngenta Seeds SAS（Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France）製のBt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ（アワノメイガ（Ostrinia nubilalis）及びセサミア・ノナグリオイデス（Sesamia nonagrioides））による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。

50

）による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt176トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。

【0209】

3. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製のMIR604トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。改変Cry3A毒素のトランスジェニック発現により、耐虫性にされたトウモロコシ。この毒素は、カテプシンーG-プロテアーゼ認識配列の挿入によって修飾されたCry3A055である。このようなトランスジェニックトウモロコシ植物の調製が、国際公開第03/018810号に記載されている。

10

【0210】

4. Monsanto Europe S. A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のMON 863トウモロコシ、登録番号C/DE/02/9。MON 863は、Cry3Bb1毒素を発現し、特定の鞘翅目 (Coleoptera) 昆虫に対する耐性を有する。

【0211】

5. Monsanto Europe S. A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のIPC 531ワタ、登録番号C/ES/96/02。

【0212】

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium) 製の1507トウモロコシ、登録番号C/NL/00/10。特定の鱗翅目 (Lepidoptera) 昆虫に対する耐性を得るためにタンパク質Cry1F及び除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るためにPATタンパク質の発現のための遺伝子組み換えトウモロコシ。

20

【0213】

7. Monsanto Europe S. A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のNK603×MON 810トウモロコシ、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子組み換え品種NK603及びMON 810を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ品種からなる。NK603×MON 810トウモロコシは、除草剤Roundup (登録商標) (グリホサートを含む) に対する耐性を与える、アグロバクテリウム属 (Agrobacterium sp.) 菌株CP4から得られるタンパク質CP4 EPSPS及びヨーロッパアワノメイガを含む特定の鱗翅目 (Lepidoptera) に対する耐性をもたらす、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスターキ (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) から得られるCry1Ab毒素も遺伝子組み換えにより発現する。

30

【0214】

昆虫耐性植物のトランスジェニック作物は、BATS (Zentrum fuer Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003, (<http://bats.ch>) にも記載されている。

40

【0215】

「作物」という用語は、例えば、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP、例えば欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照されたい) など、選択的作用を有する抗病原性物質を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。このような抗病原性物質及びこのような抗病原性物質を合成することが可能なトランスジェニック植物の例は、例えば、欧州特

50

許出願公開第0392225号明細書、国際公開第95/33818号及び欧州特許出願公開第0353191号明細書から公知である。このようなトランスジェニック植物を産生する方法は、当業者に一般に知られており、例えば上記の刊行物に記載されている。

【0216】

作物は、真菌（例えば、フザリウム属（*Fusarium*）、炭疽病又はフィトフトラ属（*Phytophthora*））、細菌（例えば、シュードモナス属（*Pseudomonas*））又はウイルス（例えば、ジャガイモ葉巻病ウイルス、トマト黄化壊疽ウイルス、キュウリモザイクウイルス）病原体に対する耐性を高めるためにも改良され得る。

【0217】

作物は、ダイズシスト線虫などの線虫に対する高い抵抗性を有するものも含む。

10

【0218】

非生物的ストレスに耐性である作物は、例えば、NF-YB又は当技術分野において公知である他のタンパク質の発現により、干ばつ、高塩分、高温、低温、霜又は光線に対する高い耐性を有するものを含む。

【0219】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る抗病原性物質としては、例えば、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、例えばウイルス性KP1、KP4又はKP6毒素；スチルベンシンターゼ；ビベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；いわゆる「病原性関連タンパク質」（PRP；例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照されたい）；微生物によって産生される抗病原性物質、例えばペプチド抗生物質又は複素環式抗生物質（例えば、国際公開第95/33818号を参照されたい）又は植物病原体防御に關与するタンパク質又はポリペプチド因子（国際公開第03/000906号に記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」）が挙げられる。

20

【0220】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、貯蔵品及び貯蔵室の保護及び原料（木材及び織物など）、床仕上げ材及び建築物の保護及び衛生分野において、特に上記のタイプの有害生物からのヒト、家畜及び生産性家畜の保護である。

【0221】

本発明は、治療において用いられる第1の態様の化合物を提供する。本発明は、動物内又は上の寄生生物の防除に用いられる第1の態様の化合物を提供する。本発明は、動物上の外寄生生物の防除に用いられる第1の態様の化合物をさらに提供する。本発明は、外寄生生物によって感染する病害の予防及び／又は処置において用いられる第1の態様の化合物をさらに提供する。

30

【0222】

本発明は、動物内又は上における寄生生物を防除するための医薬品を製造するための第1の態様の化合物の使用を提供する。本発明は、動物上における外寄生生物を防除するための医薬品を製造するための第1の態様の化合物の使用をさらに提供する。本発明は、外寄生生物によって感染する病害を予防及び／又は処置するための医薬品を製造するための第1の態様の化合物の使用をさらに提供する。

40

【0223】

本発明は、動物内又は上における寄生生物の防除における第1の態様の化合物の使用を提供する。本発明は、動物上における外寄生生物の防除における第1の態様の化合物の使用をさらに提供する。

【0224】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「防除する」という用語は、有害生物若しくは寄生生物の数の低減、有害生物若しくは寄生生物の駆除及び／又はさらなる有害生物若しくは寄生生物侵襲の予防を指す。

【0225】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「処置する」という用語は

50

、既存の症状又は病害の進行又は重症度の抑制、遅延、停止又は退行を指す。

【0226】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「予防する」という用語は、動物内において進展する症状又は病害の回避を指す。

【0227】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「動物」という用語は、哺乳類及び鳥又は魚などの非哺乳類を指し得る。哺乳類の場合、これは、ヒト又は非ヒト哺乳類であり得る。非ヒト哺乳類としては、これらに限定されないが、家畜動物及び伴侶動物が挙げられる。家畜動物としては、これらに限定されないが、ウシ、ラクダ科 (camelids)、ブタ、ヒツジ、ヤギ及びウマが挙げられる。伴侶動物としては、これらに限定されないが、イヌ、ネコ及びウサギが挙げられる。

【0228】

「寄生生物」は、宿主動物内又は上で生存し、宿主動物を犠牲にしてもたらされる栄養分によって利する有害生物である。「内寄生生物」は、宿主動物の体内に生存している寄生生物である。「外寄生生物」は、宿主動物上に生存している寄生生物である。外寄生生物としては、これらに限定されないが、コナダニ、昆虫及び甲殻類 (例えば、フナムシ) が挙げられる。ダニ目 (Acarari) (又はダニ目 (Acarina)) 亜綱は、マダニ類及びダニを含む。マダニ類としては、これらに限定されないが、以下の属の構成員：コイタマダニ属 (Rhipicaphalus)、例えばオウシマダニ (Rhipicaphalus (Boophilus) microplus) 及びクリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus)；キラマダニ属 (Amblyomerna)；カクマダニ属 (Dermacentor)；チマダニ属 (Haemaphysalis)；イボマダニ属 (Hyalomma)；マダニ属 (Ixodes)；リピセントール属 (Rhipicentor)；マルガロプス属 (Margaropus)；ナガヒメダニ属 (Argas)；オトビウス属 (Otobius)；及びカズキダニ属 (Ornithodoros) が挙げられる。ダニとしては、これらに限定されないが、以下の属の構成員：ショクヒゼンダニ属 (Chorioptes)、例えばウシショクヒゼンダニ (Chorioptes bovis)；キュウセンヒゼンダニ属 (Psoroptes)、例えばヒツジキュウセンヒゼンダニ (Psoroptes ovis)；ツメダニ属 (Cheyletiella)；デルマニッスス属 (Dermanyssus)；例えばワクモ (Dermanyssus gallinae)；イエダニ属 (Ornithonyssus)；ニキビダニ属 (Demodex)、例えばイヌニキビダニ (Demodex canis)；サルコプテス属 (Sarcoptes)、例えばヒゼンダニ (Sarcoptes scabiei)；及びヒツジツメダニ属 (Psorergates) が挙げられる。昆虫としては、これらに限定されないが、以下の目の構成員：ノミ目 (Siphonaptera)、双翅目 (Diptera)、咀嚼目、鱗翅目 (Lepidoptera)、鞘翅目 (Coleoptera) 及び同翅目 (Homoptera) が挙げられる。ノミ目 (Siphonaptera) の構成員としては、これらに限定されないが、ネコノミ (Ctenocephalides felis) 及びイヌノミ (Ctenocephalides canis) が挙げられる。双翅目 (Diptera) の構成員としては、これらに限定されないが、イエバエ属の種 (Musca spp.)；ウマバエ、例えばウマバエ (Gasterophilus intestinalis) 及びヒツジバエ (Oestrus ovis)；サシバエ；アブ、例えばゴマフアブ属の種 (Haematopota spp.) 及びタブヌス属の種 (Tabanus spp.)；ヘマトビア属 (haematobia)、例えばノサシバエ (haematobia irritans)；サシバエ属 (Stomoxys)；ギンバエ属 (Lucilia)；ユスリカ；並びに蚊が挙げられる。咀嚼目の構成員としては、これらに限定されないが、吸血シラミ及び刺咬性のシラミ、例えばヒツジハジラミ (Bovicola Ovis) 及びウシハジラミ (Bovicola Bovis) が挙げられる。

【0229】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「有効量」という用語は、本発明又はその塩の化合物の量又は投与量であって、動物への一回又は複数回の投与量において動物内又は上で所望の効果が得られるものを指す。有効量は、公知の技術の使用により及び類似する状況下で得られる結果を観察することにより、当業者としての担当の診断医によって容易に判定され得る。有効量の判定では、特に、これらに限定されないが、哺乳類の種；そのサイズ、年齢及び一般的な健康状態；防除される寄生生物及び侵襲の程度；関連する特定の病害又は障害；病害又は障害の程度又は合併症又は重症度；固体の応答；投与される特定の化合物；投与モード；投与される調製物のバイオアベイラビリティ特徴；選択される投与量投与計画；併用薬の使用；並びに他の関連する状況を含む多数の要因が担当の診断医によって考慮される。

10

【0230】

本発明の化合物は、特に、これらに限定されないが、局部、経口、非経口及び皮下を含む、所望の効果を有するいずれかの経路によって動物に投与され得る。局部投与が好ましい。局部投与に好適な配合物としては、例えば、溶液、エマルジョン及び懸濁液が挙げられ、ポアオン、スポットオン、スプレーオン、スプレーレース又はディップの形態であり得る。代わりに、本発明の化合物は、耳標又はカラーによって投与され得る。

【0231】

本発明の化合物の塩形態は、農芸化学的に許容可能な塩と異なり得る薬学的に許容可能な塩及び獣医学的に許容可能な塩の両方を含む。薬学的及び獣医学的に許容可能な塩並びにこれらを調製するための一般的な方法論は、当技術分野において周知である。例えば、Gould, P. L., "Salt selection for basic drugs", International Journal of Pharmaceutics, 33:201-217 (1986); Bastin, R. J., et al. "Salt Selection and Optimization Procedures for Pharmaceutical New Chemical Entities", Organic Process Research and Development, 4:427-435 (2000); 及び Berge, S. M., et al., "Pharmaceutical Salts", Journal of Pharmaceutical Sciences, 66:1-19, (1977) を参照されたい。本発明の化合物は、当業者に周知である技術及び条件を用いて、塩酸塩などの塩に容易に転換されると共に、このような塩として単離され得ることを合成の当業者は理解するであろう。加えて、合成の当業者は、本発明の化合物が、対応する塩から対応する遊離塩基に容易に転換されると共に、このような塩として単離され得ることを理解するであろう。

20

30

【0232】

本発明は、有害生物（蚊及び他の病原媒介動物など；http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/ も参照されたい）を防除する方法も提供する。一実施形態において、有害生物を防除する方法は、本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材にブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬によって施用する工程を含む。例として、壁、天井又は床面などの表面の IRS（屋内残留噴霧）施用が、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、このような組成物を網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の不織布又は布帛材料などの基材に施用することが想定されている。

40

【0233】

一実施形態において、このような有害生物を防除する方法は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面又は基材に与えるように、殺有害生物的に有効な量の本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材に施用する工程を含む。このような施用は、本発明の殺有害生物組成物をブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬することによって行われ得る。例として、壁、天井又は床面などの表面における IRS 施用は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面に与えるように、本発明の方法によって想定されてい

50

る。別の実施形態において、網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の布帛材料などの基材における有害生物の残存性防除のためにこのような組成物を施用することが想定されている。

【0234】

処理される不織布、布帛又は網を含む基材は、綿、ラフィア、ジュート、亜麻、サイザル、麻布若しくは羊毛などの天然繊維又はポリアミド、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリアクリロニトリルなどの合成繊維で作製され得る。ポリエステルが特に好適である。織物処理の方法は、例えば、国際公開第2008/151984号、国際公開第2003/034823号、米国特許第5631072号明細書、国際公開第2005/64072号、国際公開第2006/128870号、欧州特許第1724392号明細書、国際公開第2005113886号又は国際公開第2007/090739号から公知である。

10

【0235】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、すべての観賞用樹木並びにあらゆる種類の果樹及び堅果の成る木の樹幹注入／幹処理の分野である。

【0236】

樹幹注入／幹処理の分野において、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目（Lepidoptera）及び鞘翅目（Coleoptera）の木材穿孔性（wood-boring）昆虫、特に以下の表A及びBに列挙される木材穿孔性昆虫（woodborer）に対して特に好適である。

20

【0237】

【表2】

表 A. 経済的に重要な外来の木材穿孔性昆虫の例

科	種	寄生される宿主又は作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アオナガタマムシ (<i>Agrilus planipennis</i>)	セイヨウトネリコ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	アノプラ・グラブリペンニス (<i>Anoplura glabripennis</i>)	広葉樹
キクイムシ科 (Scolytidae)	サクキクイムシ (<i>Xylosandrus crassiusculus</i>)	広葉樹
	クスノキオオキクイムシ (<i>X. mutilatus</i>)	広葉樹
	マツノキクイムシ (<i>Tomicus piniperda</i>)	針葉樹

30

【0238】

【表 3 - 1】

表 B. 経済的に重要な在来の木材穿孔性昆虫の例

科	種	寄生される宿主又は作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アグリルス・アンキシウス (<i>Agrilus anxius</i>)	カバノキ
	アグリルス・ポリツス (<i>Agrilus politus</i>)	ヤナギ、カエデ
	アグリルス・サイ(<i>Agrilus sayi</i>)	ヤマモモ、ニセヤマモモ
	アグリルス・ビッタチコリス (<i>Agrilus vittaticollis</i>)	リンゴ、セイヨウナシ、クランベリ ー、サービズベリー、サンザシ
	クリソボトリス・フェモラタ (<i>Chrysobothris femorata</i>)	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカ エデ、サクランボ、クリ、スグリ、ニ レ、サンザシ、エノキ、ヒッコリー、セ イヨウトチノキ、リンデン、カエデ、ナ ナカマド、オーク、ペカン、セイヨウ ナシ、モモ、カキ、プラム、ポプラ、 マルメロ、アメリカハナズオウ、サー ビズベリー、スズカケノキ、クルミ、 ヤナギ
	テキサニア・カンペストリス (<i>Texania campestris</i>)	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、ス ズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	ゴエス・プルベルレンツス(<i>Goes pulverulentus</i>)	ブナ、ニレ、ナットール(Nuttall)、ヤ ナギ、クロガシワ、アメリカキレハガ シワ(Cherrybark oak)、ミズナラ、ス ズカケノキ
	ゴエス・チグリヌス(<i>Goes tigrinus</i>)	オーク
	ネオクリツス・アクミナツス (<i>Neoclytus acuminatus</i>)	セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オー ク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、 イースタンホップホーンビーム (Eastern hophornbeam)、ハナミズ キ、カキ、アメリカハナズオウ、ヒイ ラギ、エノキ、ニセアカシア、アメリ カサイカチ、ユリノキ、クリ、アメリカ ハリグワ、サッサfras、ライラッ ク、マウンテン・マホガニー、セイヨ ウナシ、サクランボ、プラム、モモ、 リンゴ、ニレ、シナノキ、モミジバフ ウ
	ネオプチコデス・トリリネツス (<i>Neoptychodes trilineatus</i>)	イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、 ネットリーフハックベリー(Netleaf hackberry)
	オベレア・オセラータ(<i>Oberea ocellata</i>)	ヌルデ、リンゴ、モモ、プラム、セイ ヨウナシ、スグリ、ブラックベリー (Blackberry)
	オベレア・トリプンクタータ(<i>Oberea tripunctata</i>)	ハナミズキ、ガマズミ属 (<i>Viburnum</i>)、ニレ、サワーウッド、ブ ルーベリー、シャクナゲ、ツツジ、月 桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ
	オンシデレス・シングラータ (<i>Oncideres cingulata</i>)	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワ ーウッド、シナノキ、アメリカサイカ

10

20

30

40

【表 3 - 2】

科	種	寄生される宿主又は作物
		チ、ハナミズキ、ユーカリ属 (Eucalyptus)、オーク、エノキ、カエデ、果樹
	サペルダ・カルカラタ (<i>Saperda calcarata</i>)	ポプラ
	ストロフィオナ・ニテンス (<i>Strophiona nitens</i>)	クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブナ、カエデ
キクイムシ科 (Scolytidae)	コルチルス・コロンビアヌス (<i>Corthylus columbianus</i>)	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバノカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ
	デンドロクトヌス・フロンタリス (<i>Dendroctonus frontalis</i>)	マツ
	ドリオコエテス・ベツラエ (<i>Dryocoetes betulae</i>)	カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミザクラ、ブナ、セイヨウナシ
	モナルトルム・ファスシアツム (<i>Monarthrum fasciatum</i>)	オーク、カエデ、カバノキ、クリ、モミジバフウ、ヌマミズキ、ポプラ、ヒッコリー、ミモザ、リンゴ、モモ、マツ
	フロエオトリブス・リミナリス (<i>Phloeotribus liminaris</i>)	モモ、サクランボ、プラム、アメリカザクラ、ニレ、クワ、ナナカマド
	シュードピチオフトルス・プルイノス (<i>Pseudopityophthorus pruinus</i>)	オーク、アメリカブナ、アメリカザクラ、チッカソープラム (Chickasaw plum)、クリ、カエデ、ヒッコリー、シデ、アサダ
スカシバガ科 (Sesiidae)	パラントレネ・シムランス (<i>Paranthrene simulans</i>)	オーク、アメリカグリ
	サンニナ・ウロセリフォルミス (<i>Sannina uroceriformis</i>)	カキ
	シナンテドン・エキシチオサ (<i>Synanthedon exitiosa</i>)	モモ、プラム、ネクタリン、サクランボ、アンズ、アーモンド、アメリカザクラ
	シナンテドン・ピクチペス (<i>Synanthedon pictipes</i>)	モモ、プラム、サクランボ、ブナ、アメリカザクラ
	シナンテドン・ルブロファスシア (<i>Synanthedon rubrofascia</i>)	アメリカヌマミズキ
	シナンテドン・シツラ (<i>Synanthedon scitula</i>)	ハナミズキ、ペカン、ヒッコリー、オーク、クリ、ブナ、カバノキ、アメリカザクラ、ニレ、ナナカマド、ガマズミ属 (Viburnum)、ヤナギ、リンゴ、ビワ、アメリカテマリシモツケ、ヤマモモ
	ビタセア・ポリステフォルミス (<i>Vitacea polistiformis</i>)	ブドウ

【0239】

本発明は、例えば、甲虫、イモムシ、ヒアリ、ワタフキカイガラムシ (ground pearl)、ヤスデ、ダンゴムシ、ダニ、ケラ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、マ

ダニ、アワフキムシ、サウザンキンクバグ (southern chinch bug) 及び地虫を含む、芝草中に存在し得る任意の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。本発明は、卵、幼虫、若虫及び成虫を含む、生活環の様々な段階の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

【0240】

特に、本発明は、地虫 (コガネカブト属 (Cyclocephala spp.)) (例えば、マスクドコガネムシ (masked chafer)、C. ルリダ (C. lurida))、リゾトログス属 (Rhizotrogus spp.) (例えば、ヨーロピアンコガネムシ、R. マハリス (R. majalis))、コチヌス属 (Cotinus spp.) (例えば、アオコフキコガネ、C. ニチダ (C. nitida))、ポピリア属 (Popillia spp.) (例えば、マメコガネ (Japanese beetle)、マメコガネ (P. japonica))、フィロファガ属 (Phyllophaga spp.) (例えば、コガネムシ (May/June beetle))、アテニウス属 (Ataenius spp.) (例えば、ブラック・ターフグラス・アテニウス (Black turfgrass ataenius)、A. スプレツルス (A. spretulus))、マラデラ属 (Maladera spp.) (例えば、アカビロウドコガネ、M. カスタネア (M. castanea)) 及びトマルス属 (Tomarus spp.) など)、ワタフキカイガラムシ (マルガロデス属 (Margarodes spp.))、ケラ (タウニー (tawny)、サウザン (southern) 及び短翅型; スカプテリスキス属 (Scapteriscus spp.))、ケラ (Gryllotalpa africana)) 及びレザージャケット (leather jacket) (ヨーロピアンクレーンフライ (European crane fly)、ガガンボ属 (Tipula spp.)) を含む、芝草の根を餌とする昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

【0241】

本発明は、ヨトウムシ (ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) 及び一般的なヨトウムシ (common armyworm) (プセウダレチア・ユニプンクタ (Pseudaletia unipuncta) など)、ネキリムシ、ゾウムシ (スフェノホルス属 (Sphenophorus spp.))、シバオサゾウムシ (S. venatus verstitus) 及び S. パルブルス (S. parvulus) など) 及びソッドウェブワーム (sod webworm) (クラムプス属 (Crambus spp.)) 及び熱帯ソッドウェブワーム (tropical sod webworm)、ケナシクロオビクロノメイガ (Herpetogramma phaeopteralis) など) を含む、藁に住む芝草の昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

【0242】

本発明は、ヒメコガネナガカメムシ (サウザンキンクバグ、ブリスス・インスラリス (Blissus insularis) など)、ギョウギシバ (Bermudagrass) のダニ (エリオフィエス・シノドニエンシス (Eriophyes cynodonienensis))、アフリカヒゲシバ (rhodesgrass) のコナカイガラムシ (チガヤシロオカイガラムシ (Antonina graminis))、2本線のあるアワフキムシ (two-lined spittlebug) (プロサピア・ビシンクタ (Propsapia bicincta))、ヨコバイ、ネキリムシ (ヤガ科 (Noctuidae)) 及びムギミドリアブラムシを含む、地上に生息し、芝草の葉を餌とする昆虫有害生物を防除するのにも使用され得る。

【0243】

本発明は、芝生にアリ塚を作製するアカヒアリ (Solenopsis invicta) など、芝草の他の有害生物を防除するのにも使用され得る。

【0244】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ (hard tick)、ヒメダ

10

20

30

40

50

ニ (soft tick)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ (サシバエ及び舐性 (licking) のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミ及びノミなどの外部寄生生物に対して有効である。

【0245】

このような寄生生物の例は以下のとおりである：

シラミ目 (Anoplurida) のうち、ブタジラミ属 (Haematopinus spp.)、ホソジラミ属 (Linognathus spp.)、ペディクルス属 (Pediculus spp.) 及びケジラミ属 (Phtirus spp.)、ソレノポテス属 (Solenopotes spp.)。

【0246】

ハジラミ目 (Mallophagida) のうち、トリメノポン属 (Trimenopon spp.)、タンカクハジラミ属 (Menopon spp.)、トリノトン属 (Trinoton spp.)、ボビコラ属 (Bovicola spp.)、ウェルネッキエラ属 (Werneckiella spp.)、レピケントロン属 (Lepikentron spp.)、ダマリナ属 (Damalina spp.)、トリコデクテス属 (Trichodectes spp.) 及びフェリコラ属 (Felicola spp.)。

【0247】

双翅目 (Diptera) 並びにその亜目であるネマトセリナ亜目 (Nematocerina) 及び短角亜目 (Brachycerina) のうち、例えばヤブカ属 (Aedes spp.)、ハマダラカ属 (Anopheles spp.)、イエカ属 (Culex spp.)、ブヨ属 (Simulium spp.)、ツノマユブユ属 (Eusimulium spp.)、サシチョウバエ属 (Phlebotomus spp.)、ルツォミヤ属 (Lutzomyia spp.)、キュリコイデス属 (Culicoides spp.)、メクラアブ属 (Chrysops spp.)、ヒボミトラ属 (Hybomitra spp.)、キイロアブ属 (Atylotus spp.)、アブ属 (Tabanus spp.)、ゴマフアブ属 (Haematopota spp.)、フィリポミア属 (Phillipomyia spp.)、ブラウラ属 (Braula spp.)、イエバエ属 (Musca spp.)、トゲアシメマトイ属 (Hydrotaea spp.)、サシバエ属 (Stomoxys spp.)、ヘマトビア属 (Haematobia spp.)、モレリア属 (Morellia spp.)、ヒメイエバエ属 (Fannia spp.)、ツェツェバエ属 (Glossina spp.)、オオクロバエ属 (Calliphora spp.)、キンバエ属 (Lucilia spp.)、オビキンバエ属 (Chrysomyia spp.)、ヴォールファールトニクバエ属 (Wohlfahrtia spp.)、ニクバエ属 (Sarcophaga spp.)、ヒツジバエ属 (Oestrus spp.)、ウシバエ属 (Hypoderma spp.)、ウマバエ属 (Gasterophilus spp.)、シラミバエ属 (Hippobosca spp.)、シカシラミバエ属 (Lipoptena spp.) 及びヒツジシラミバエ属 (Melophagus spp.)。

【0248】

ノミ目 (Siphonapterida) のうち、例えばヒトノミ属 (Pulex spp.)、イヌノミ属 (Ctenocephalides spp.)、ネズミノミ属 (Xenopsylla spp.)、ナガノミ属 (Ceratophyllus spp.)。

【0249】

異翅目 (Heteropterida) のうち、例えばトコジラミ属 (Cimex spp.)、サシガメ属 (Triatoma spp.)、ロドニウス属 (Rhodnius spp.)、パンストロギルス属 (Panstrongylus spp.)。

【0250】

ゴキブリ目 (Blattarida) のうち、例えばトウヨウゴキブリ (Blatta

10

20

30

40

50

orientalis)、ワモンゴキブリ(Periplaneta americana)、チャバネゴキブリ(Blattella germanica)及びスベラ属(Suppella spp.)。

【0251】

ダニ亜綱(Acaria(Acarida))並びにマダニ亜目(Metastigmata)及び中気門亜目(Mesostigmata)のうち、例えばナガヒメダニ属(Argas spp.)、カズキダニ属(Ornithodoros spp.)、オトビウス属(Otobius spp.)、タネガタマダニ属(Ixodes spp.)、キララマダニ属(Amblyomma spp.)、ウシマダニ属(Boophilus spp.)、カクマダニ属(Dermacentor spp.)、チマダニ属(Haemophysalis spp.)、イボマダニ属(Hyalomma spp.)、コイタマダニ属(Rhipicephalus spp.)、デルマニスス属(Dermanyssus spp.)、ライリエチア属(Raillietia spp.)、ニューモニスス属(Pneumonyssus spp.)、ステルノストマ属(Sternostoma spp.)及びバロア属(Varroa spp.)。

10

【0252】

ダニ目(Actinedida)(前気門類(Prostigmata))及びカイチュウ目(Acaridida)(コナダニ亜目(Astigmata))のうち、例えばアカラピス属(Acarapis spp.)、ツメダニ属(Cheyletiella spp.)、オルニソケイレチア属(Ornithocheyletia spp.)、ミオビア属(Myobia spp.)、ヒツジツメダニ属(Psorergates spp.)、ニキビダニ属(Demodex spp.)、ツツガムシ属(Trombicula spp.)、リストロホルス属(Listrophorus spp.)、コナダニ属(Acarus spp.)、チロファグス属(Tyrophagus spp.)、ゴミコナダニ属(Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス属(Hypolectes spp.)、プテロリクス属(Pterolichus spp.)、キュウセンヒゼンダニ属(Psoroptes spp.)、ショクヒゼンダニ属(Chorioptes spp.)、ミミヒゼンダニ属(Otodectes spp.)、ヒゼンダニ属(Sarcoptes spp.)、ショウセンコウヒゼンダニ属(Notoedres spp.)、クネミドコプテス属(Knemidocoptes spp.)、シトジテス属(Cytodites spp.)及びラミノシオプテス属(Laminosioptes spp.)。

20

30

【0253】

本発明に係る組成物は、木材、織物、プラスチック、接着剤、のり、塗料、紙及び厚紙、皮革、床仕上げ材及び建築物などの材料の場合、昆虫の寄生から保護するのにも好適である。

【0254】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイエカミキリ(Hylotrupes bajulus)、クロロホルス・ピロシス(Chlorophorus pilosis)、アノビウム・プンクタツム(Anobium punctatum)、キセストビウム・ルホビロスム(Xestobium rufovillosum)、プチリヌスペクチコルニス(Ptilinuspecticornis)、デンドロビウム・ペルチネクス(Dendrobium pertinex)、マツザイシバンムシ(Ernobius mollis)、オオナガシバンムシ(Priobium carpini)、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus)、アフリカヒラタキクイムシ(Lyctus africanus)、アメリカヒラタキクイムシ(Lyctus planicollis)、ナラヒラタキクイムシ(Lyctus linearis)、リクツス・プベセンシス(Lyctus pubescens)、トロゴキシロン・アエクアレ(Trogoxylon aequale)、ミンテスルギコリス(Minthesrugicollis)、キシルボルス属種(Xyleb

40

50

orus spec.)、トリプトデンドロン属種 (Tryptodendron spec.)、アパテ・モナクス (Apate monachus)、ボストリクス・カプシ
 ンス (Bostrychus capucins)、ヘテロボストリクス・ブルンネウス
 (Heterobostrychus brunneus)、シノキシロン属種 (Sinoxylon spec.) 及びチビタケナガシンクイムシ (Dinoderus mi
 nutus) などの甲虫並びにさらにコルリキバチ (Sirex juvencus)、
 モミノオオキバチ (Urocetus gigas)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス
 (Urocetus gigas taignus) 及びウロセルス・アウグル (Uro
 cetus augur) などの膜翅類の昆虫 (hymenopteran) 並びにカロ
 テルメス・フラヴィコリス (Kaloterme flavicollis)、ニシイ
 ンドカンザイシロアリ (Cryptoterme brevis)、ヘテロテルメス・
 インディコラ (Heteroterme indicola)、キアシシロアリ (Re
 ticuliterme flavipes)、レティクリテルメス・サントネンシス
 (Reticuliterme santonensis)、レティキュリテルメス・
 ルシフグス (Reticuliterme lucifugus)、ムカシシロアリ (Ma
 stoterme darwiniensis)、ネバダオオシロアリ (Zoot
 ermopsis nevadensis) 及びイエシロアリ (Coptoterme
 formosanus) などのシロアリ並びにセイヨウシミ (Lepisma sac
 charina) などのシミ。式 (I) 及び (I' a) の化合物又はその塩は、科：ヤガ
 科 (Noctuidae)、クチブサガ科 (Plutellidae)、ハムシ科 (Ch
 rysomelidae)、アザミウマ科 (Thripidae)、カメムシ科 (Pen
 tatomidae)、ハマキガ (Tortricidae)、ウンカ科 (Delpha
 cidae)、アリマキ科 (Aphididae)、ヤガ科 (Noctuidae)、ツ
 トガ科 (Crambidae)、ロイドギネ科 (Meloïdogynidae) 及びシ
 ストセンチュウ科 (Heteroderidae) から選択される1種以上の有害生物の
 防除に特に好適である。各態様の好ましい実施形態において、化合物TX (ここで、TX
 は、「表A-1~A-64及び表Pにおいて定義されている化合物から選択される1種の
 化合物」を意味する) は、科：ヤガ科 (Noctuidae)、クチブサガ科 (Plut
 ellidae)、ハムシ科 (Chrysomelidae)、アザミウマ科 (Thri
 pidae)、カメムシ科 (Pentatomidae)、ハマキガ (Tortrici
 dae)、ウンカ科 (Delphacidae)、アリマキ科 (Aphididae)、
 ヤガ科 (Noctuidae)、ツトガ科 (Crambidae)、ロイドギネ科 (Me
 loïdogynidae) 及びシストセンチュウ科 (Heteroderidae) か
 ら選択される1種以上の有害生物を防除する。

【0255】

式 (I) 及び (I' a) の化合物又はその塩は、属：スポドプテラ属の種 (Spodoptera spp)、プルテラ属の種 (Plutella spp)、ハナアザミウマ
 属の種 (Frankliniella spp)、トリプス属の種 (Thrips spp)、ユースキスツス属の種 (Euschistus spp)、シジア属の種 (Cyd
 ia spp)、ニラバルバタ属の種 (Nilaparvata spp)、ミズス属の
 種 (Myzus spp)、ワタアブラムシ属の種 (Aphis spp)、ジアブロチ
 カ属の種 (Diabrotica spp)、ロパロシウム属の種 (Rhopalosiphum spp)、シュードプルシア属の種 (Pseudoplusia spp) 及
 びキロ属の種 (Chilo spp) から選択される1種以上の有害生物の防除に特に好
 適である。各態様の好ましい実施形態において、化合物TX (ここで、TXは、「表A-
 1~A-64及び表Pにおいて定義されている化合物から選択される1種の化合物」を意
 味する) は、属：スポドプテラ属の種 (Spodoptera spp)、プルテラ属の
 種 (Plutella spp)、ハナアザミウマ属の種 (Frankliniella
 spp)、トリプス属の種 (Thrips spp)、ユースキスツス属の種 (Eus
 chistus spp)、シジア属の種 (Cydia spp)、ニラバルバタ属の種

10

20

30

40

50

(*Nilaparvata* spp)、ミズス属の種(*Myzus* spp)、ワタアブラムシ属の種(*Aphis* spp)、ジアブロチカ属の種(*Diabrotica* spp)、ロパロシフム属の種(*Rhopalosiphum* spp)、シュードブルシア属の種(*Pseudoplusia* spp)及びキロ属の種(*Chilo* spp)から選択される1種以上の有害生物を防除する。

【0256】

式(I)及び(I'a)の化合物又はその塩は、エジプトヨトウ(*Spodoptera littoralis*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ユースキスツスヘロス(*Euschistus heros*)、コドリング(*Cydia pomonella*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、クリソデイキスインクルデンス(*Chrysodeixis includens*)、マメアブラムシ(*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ(*Diabrotica balteata*)、ロパロシフウムパディ(*Rhopalosiphum padi*)及びニカメイガ(*Chilo suppressalis*)の1種以上の防除に特に好適である。

【0257】

各態様の好ましい実施形態において、化合物TX(ここで、TXは、「表A-1～A-64及び表Pにおいて定義されている化合物から選択される1種の化合物」を意味する)は、エジプトヨトウ(*Spodoptera littoralis*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ユースキスツスヘロス(*Euschistus heros*)、コドリング(*Cydia pomonella*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、クリソデイキスインクルデンス(*Chrysodeixis includens*)、マメアブラムシ(*Aphis craccivora*)、ジアブロチカバルテアタ(*Diabrotica balteata*)、ロパロシフウムパディア(*Rhopalosiphum Padi*a)並びにエジプトヨトウ(*Spodoptera littoralis*)+TX、コナガ(*Plutella xylostella*)+TXなどのニカメイガ(*Chilo Suppressalis*)；ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)+TX、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)+TX、ユースキスツスヘロス(*Euschistus heros*)+TX、コドリング(*Cydia pomonella*)+TX、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)+TX、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)+TX、クリソデイキスインクルデンス(*Chrysodeixis includens*)+TX、マメアブラムシ(*Aphis craccivora*)+TX、ジアブロチカバルテアタ(*Diabrotica balteata*)+TX、ロパロシフウムパディ(*Rhopalosiphum Padi*) +TX及びニカメイガ(*Chilo suppressa*lis)+TXの1種以上を防除する。

【0258】

各態様の一実施形態において、表A-1～A-64及び表Pにおける1種の化合物は、綿、野菜、トウモロコシ、穀類、イネ及びダイズ作物における、エジプトヨトウ(*Spodoptera littoralis*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ユースキスツスヘロス(*Euschistus heros*)、コドリング(*Cydia pomonella*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、クリソデイキスインクルデンス(*Chrysodeixi*

10

20

30

40

50

s includens)、マメアブラムシ (Aphis craccivora)、ジ
アブロチカバルテアタ (Diabrotica balteata)、ロパロシフウムパ
ディア (Rhopalosiphum padi) 及びニカメイガ (Chilo suppressalis) の防除に好適である。

【0259】

一実施形態において、表 A-1～A-64 及び表 P 由来の 1 種の化合物は、ヨトウガ (Mamestra) (好ましくは野菜におけるもの)、コドリング (Cydia pomonella) (好ましくはリンゴにおけるもの)、エンポアスカ属 (Empoasca) (好ましくは野菜、ブドウ園におけるもの)、レプチノタルサ属 (Leptinotarsa) (好ましくはジャガイモにおけるもの) 及びニカメイガ (Chilo suppressalis) (好ましくはイネにおけるもの) の防除に好適である。

10

【0260】

本発明に係る化合物は、とりわけ、昆虫に対して植物を保護するための有利なレベルの生物学的活性又は農芸化学的有効成分として用いられるための優れた特性 (例えば、高い生物学的活性、有利な活性範囲、高い安全性プロファイル (地上及び地下の非標的生物 (魚類、鳥類及びハチ類など) に対して、向上した物理化学的特性又は高い生分解性) を含むいずれかの数の有益性を有し得る。特に、特定の式 (I) の化合物は、特にミツバチ、単生ミツバチ及びマルハナバチなどの受粉媒介者といった非標的節足動物に対して有利な安全性プロファイルを示し得ることが意外なことに見出された。最も具体的には、セイヨウミツバチ (Apis mellifera) である。

20

【0261】

本発明に係る化合物は、未変性の形態で殺有害生物剤として使用可能であるが、これらは、一般に、種々の方法でキャリア、溶剤及び表面活性物質などの配合助剤を用いて組成物に配合される。配合物は、例えば、散粉粉末、ゲル、水和剤、水分散性顆粒、水分散性錠剤、発泡性ペレット、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、水中油型エマルジョン、油性フロアブル、水性分散体、油性分散体、サスポエマルジョン、カプセル懸濁液、乳化性顆粒、可溶性液体、水溶性濃縮物 (キャリアとして水又は水和性の有機溶剤を含む)、含浸ポリマーフィルムの形態又は例えば the Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010) から公知である他の形態といった種々の物理的形態であり得る。このような配合物は、直接用いられるか又は使用前に希釈され得る。希釈は、例えば、水、液体肥料、微量元素、生物学的生体、油又は溶剤により行うことが可能である。

30

【0262】

配合物は、例えば、微細固形分、顆粒、溶液、分散体又はエマルジョンの形態で組成物を得るために、有効成分を配合助剤と混合することにより調製可能である。有効成分は、微細固形分、鉱油、植物性油若しくは動物性油、植物性変性油若しくは動物性変性油、有機溶剤、水、表面活性物質又はこれらの組み合わせなどの他の補助剤とも配合可能である。

40

【0263】

有効成分は、きわめて微細なマイクロカプセル中にも含まれ得る。マイクロカプセルは、多孔性キャリア中に有効成分を含有する。これにより、有効成分を、制御された量 (例えば、緩効性) で環境中に放出させることが可能である。マイクロカプセルは、通常、0.1～500 ミクロンの直径を有する。これらは、有効成分をカプセル重量基準で約 25～95 重量% の量で含有する。有効成分は、一塊の固体の形態、固体若しくは液体分散体中の微細な粒子の形態又は好適な溶液の形態であり得る。封入メンブランは、例えば、天然若しくは合成ゴム、セルロース、スチレン/ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタン又は化学変性ポリマー及びキサントゲン酸デンプン又は当業者に公知である他のポリマーを含む

50

ことが可能である。代わりに、きわめて微細なマイクロカプセルは、基剤の固体マトリックス中に微細粒子の形態で有効成分を含有して形成され得るが、マイクロカプセル自体は、封入されていない。

【0264】

本発明に係る組成物の調製に好適である配合助剤は、それら自体公知である。液体キャリアとしては、水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、ブチレンカーボネート、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1, 2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、アビエチン酸ジエチレングリコール、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N, N-ジメチルーホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1, 4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキトール、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1, 1, 1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、 α -ピネン、d-リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 γ -ブチロラクトン、グリセロール、グリセロールアセテート、グリセロールジアセテート、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチルアミン、オクタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール、プロピオン酸、プロピル乳酸塩、炭酸プロピレン、プロピレングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、メタノール、エタノール、イソプロパノール及びアミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセロール、N-メチルー2-ピロリドンなどの高分子量アルコール等が用いられ得る。

【0265】

好適な固体キャリアは、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、石灰岩、炭酸カルシウム、ベントナイト、カルシウムモンモリロナイト、綿殻、コムギ粉、ダイズ粉、軽石、木粉、粉碎したクルミの殻、リグニン及び同様の物質である

【0266】

多数の表面活性物質は、固体及び液体配合物の両方において、特に使用前にキャリアで希釈可能である配合物で有利に用いられ得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、ノニオン性又は高分子であり得、これらは、乳化剤、湿潤剤若しくは懸濁剤として又は他の目的のために用いられ得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ジエタノールアンモニウムラウリルスルフェートなどのアルキルスルフェートの塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネートの塩；ノニルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノール／アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコールエトキシレートなどのアルコール／アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどのセッケン；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホネートの塩；ジ（2-エチルヘキシル）スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレアートなどのソルビトールエ

ステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン、ポリエチレングリコールステアレートなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシド及びプロピレンオキシドのブロックコポリマー；並びにモノー及びジールキルホスフェートエステルの塩；並びに例えば McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981) に記載のさらなる物質が挙げられる。

【0267】

有害生物防除配合物において用いられ得るさらなる補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度調整剤、懸濁剤、染料、抗酸化剤、発泡剤、吸光剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和剤又はpH調整剤及び緩衝剤、腐食抑制剤、芳香剤、湿潤剤、取り込み増強剤、微量元素、可塑剤、滑剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、不凍剤、殺菌剤並びに液体及び固体肥料が挙げられる。

10

【0268】

本発明に係る組成物は、植物性油又は動物性油、鉱油、このような油のアルキルエステル又はこのような油及び油誘導体の混合物を含む添加剤を含むことが可能である。本発明に係る組成物における油添加剤の量は、一般に、適用される混合物に基づいて0.01～10%である。例えば、油添加剤は、噴霧混合物が調製された後、噴霧タンク中に所望の濃度で添加することが可能である。好ましい油添加剤は、鉱油又は例えばナタネ油、オリーブ油若しくはヒマワリ油といった植物性油、乳化植物油、例えばメチル誘導体といった植物性油のアルキルエステル又は魚油若しくは牛脂などの動物性油を含む。好ましい油添加剤は、 $C_8 \sim C_{22}$ 脂肪酸のアルキルエステル、特に $C_{12} \sim C_{18}$ 脂肪酸のメチル誘導体であり、例えばラウリン酸、パルミチン酸及びオレイン酸のメチルエステル（それぞれラウリン酸メチル、パルミチン酸メチル及びオレイン酸メチル）を含む。多くの油誘導体は、the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010から公知である。

20

【0269】

本発明の組成物は、一般に、0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の本発明の化合物と、1～99.9重量%の配合助剤（これは、0～25重量%の表面活性物質を含むことが好ましい）とを含む。商業用の製品は、濃縮物として配合されることが好ましいことがあり得るが、エンドユーザーは、通常、希釈配合物を利用することとなる。

30

【0270】

適用量は、幅広い範囲内で様々であり、土壌の性質、適用方法、作物植物、防除される有害生物、主な気象条件並びに適用方法、適用時期及び標的作物によって左右される他の要因に応じる。一般的なガイドラインのとおり、化合物は、1～2000l/ha、特に10～1000l/haの量で適用され得る。

【0271】

好ましい配合物は、以下の組成（重量%）を有することが可能である。

乳化性濃縮物：

40

有効成分：1～95%、好ましくは60～90%

表面活性薬剤：1～30%、好ましくは5～20%

液体キャリア：1～80%、好ましくは1～35%

粉剤：

有効成分：0.1～10%、好ましくは0.1～5%

固体キャリア：99.9～90%、好ましくは99.9～99%

懸濁液濃縮物：

有効成分：5～75%、好ましくは10～50%

水：94～24%、好ましくは88～30%

表面活性薬剤：1～40%、好ましくは2～30%

50

水和剤：

有効成分：0.5～90%、好ましくは1～80%

表面活性薬剤：0.5～20%、好ましくは1～15%

固体キャリア：5～95%、好ましくは15～90%

顆粒：

有効成分：0.1～30%、好ましくは0.1～15%

固体キャリア：99.5～70%、好ましくは97～85%

【0272】

以下の例は、本発明をさらに例示するが、限定するものではない。

【0273】

【表4】

水和剤	a)	b)	c)
有効成分	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	—
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	—	5 %
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	—	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル(7～8 mol のエチレンオキシド)	—	2 %	—
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	—

【0274】

複合物を補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、水で希釈して所望の濃度の懸濁液を得ることが可能である水和剤を得る。

【0275】

【表5】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
有効成分	25 %	50 %	75 %
軽油	5 %	5 %	5 %
高分散ケイ酸	5 %	5 %	—
カオリン	65 %	40 %	—
タルカム	—	—	20 %

【0276】

複合物を補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得る。

【0277】

【表6】

乳化性濃縮物	
有効成分	10 %
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル(4～5 mol のエチレンオキシド)	3 %
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3 %
ひまし油ポリグリコールエーテル(35 mol のエチレンオキシド)	4 %
シクロヘキサノン	30 %
キシレン混合物	50 %

【0278】

植物の保護に使用可能である、いずれかの必要とされる希釈度のエマルジョンは、水で希釈することによりこの濃縮物から入手が可能である。

【0279】

【表7】

粉剤	a)	b)	c)
有効成分	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	—	—
カオリン	—	94 %	—
無機充填材	—	—	96 %

10

【0280】

直ちに使用可能な粉剤は、複合物をキャリアと混合し、この混合物を好適なミル中において粉砕することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣にも用いることができる。

【0281】

【表8】

押出し顆粒	
有効成分	15 %
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
カオリン	82 %

20

【0282】

複合物を補助剤と混合及び粉砕し、この混合物を水で湿らせる。混合物を押し出し、次いで空気流中において乾燥させる。

【0283】

【表9】

被覆顆粒	
有効成分	8 %
ポリエチレングリコール(mol. wt. 200)	3 %
カオリン	89 %

30

【0284】

ミキサ中において、微細に粉砕した複合物を、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉塵を発生させないコーティングされた顆粒がこれにより得られる。

40

【0285】

【表 10】

懸濁液濃縮物

有効成分	40 %
プロピレングリコール	10 %
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル(15 mol のエチレンオキシド)	6 %
リグノスルホン酸ナトリウム	10 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
シリコーン油(水中の 75 %エマルジョンの形態)	1 %
水	32 %

10

【0286】

微細に粉碎した複合物を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、水で希釈することによりいずれかの所望の希釈度の懸濁液を得ることが可能である。このような希釈を用いて、生存している植物及び植物繁殖体を、吹付け、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による外寄生に対して処理及び保護することが可能である。

【0287】

【表 11】

種子処理用のフロアブル濃縮物

活性成分	40 %
プロピレングリコール	5 %
コポリマーブタノール PO/EO	2 %
10~20 モルの EO を含むトリスチレンフェノール	2 %
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(水中 20%の溶液の形態)	0.5 %
モノアゾ顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油(水中 75%の乳剤の形態)	0.2 %
水	45.3 %

20

【0288】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁濃縮物が得られ、この懸濁濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が、水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物並びに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による寄生から保護され得る。

【0289】

緩効性カプセル懸濁液

28部の複合物を2部の芳香族溶剤及び7部のトルエンジイソシアネート／ポリメチレンポリフェニルイソシアネート混合物（8：1）と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤及び51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化する。このエマルジョンに5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を添加する。混合物を重合反応が完了するまで攪拌する。得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の有効成分を含有する。中型カプセルの直径は、8~15ミクロンである。得られる配合物を、この目的に好適である装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

40

【0290】

配合タイプとしては、エマルジョン濃縮物（EC）、懸濁液濃縮物（SC）、サスポエマルジョン（SE）、カプセル懸濁液（CS）、水分散性顆粒（WG）、乳化性顆粒（EG）、エマルジョン、油中水型（EO）、エマルジョン、水中油型（EW）、マイクロエ

50

マルジョン (ME)、油分散体 (OD)、油混和性フロアブル (OF)、油混和性液体 (OL)、可溶性濃縮物 (SL)、超低体積懸濁液 (SU)、超低体積液体 (UL)、工業用濃縮物 (TK)、分散性濃縮物 (DC)、水和剤 (WP)、可溶性顆粒 (SG) 又は農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物が挙げられる。

【実施例】

【0291】

調製例：

「Mp」は、融点 (°C) を意味する。フリーラジカルは、メチル基を表す。¹H NMR 計測値は、Bruker 400 MHz 分光計で記録し、化学シフトは TMS 標準を基準とした ppm で示されている。スペクトルは、明記のとおり、重溶媒中において計測した。以下の LC-MS 法のいずれか 1 つを用いて化合物を特徴付けた。各化合物について得た特徴的な LC-MS 値は、保持時間 (「Rt」は、分で記録した) 及び計測した分子イオン (M+H)⁺ であった。

【0292】

LC-MS 及び GC-MS 法：

LC-MS 法 1：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性：陽イオン及び陰イオン、キャピラリ：3.00 kV、コーン範囲：30 V、抽出器：2.00 V、ソース温度：150 °C、脱溶剤温度：350 °C、コーンガス流：50 l/h、脱溶剤ガス流：650 l/h、質量範囲：100~900 Da) を備える Waters 製の質量分光計 (SQD、SQD II シングル四重極型質量分光計) 並びに Waters 製の Acquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオードアレイ検出器及び ELS D 検出器で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 µm、30×2.1 mm、温度：60 °C、DAD 波長範囲 (nm)：210~500、溶剤勾配：A=水+5% MeOH+0.05% HCOOH、B=アセトニトリル+0.05% HCOOH、勾配：1.2 分間で 10~100% の B；流れ (ml/分) 0.85。

【0293】

LC-MS 法 2：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性：陽イオン又は陰イオン、キャピラリ：3.0 kV、コーン：30 V、抽出器：3.00 V、ソース温度：150 °C、脱溶剤温度：400 °C、コーンガス流：60 L/hr、脱溶剤ガス流：700 L/hr、質量範囲：140~800 Da) を備える Waters Corporations 製の ACQUITY 質量分光計 (SQD 又は SQD II シングル四重極型質量分光計) 並びに溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオードアレイ検出器を有する Waters Corporations 製の ACQUITY UPLC で記録した。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 µm、30×2.1 mm、温度：60 °C、DAD 波長範囲 (nm)：210~400、溶剤勾配：A=水/メタノール 9：1+0.1% ギ酸、B=アセトニトリル+0.1% ギ酸、勾配：2.5 分間で 0~100% の B；流れ (ml/分) 0.75。

【0294】

GC-MS 法 3：

GC-MS を以下で実施した：Thermo、MS：ISQ 及び GC：Zebron phenomenex 製のカラムを備える Trace GC 1310：相 ZB-5 ms 15 m、径：0.25 mm、0.25 µm、He 流 1.5 ml/分、インジェクタ温度：250 °C、検出器温度：220 °C、方法：60 °C で 0.7 分間保持、320 °C まで 80 °C/分、320 °C で 2 分間保持、合計時間 6 分間。CI 試薬ガス：メタン、流 1 ml/分、イオン化モード CI、極性陽性、走査時間 0.2 秒、走査質量範囲 50~650 amu。

【0295】

LC-MS法4:

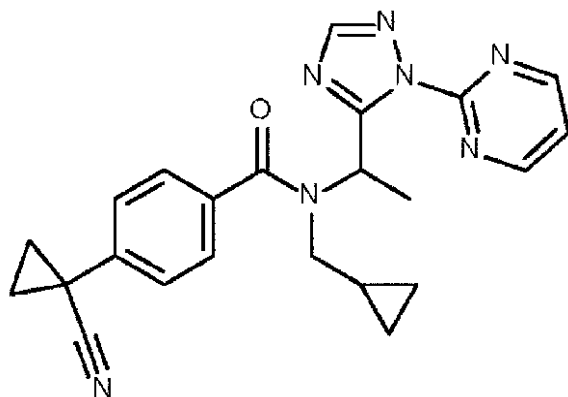
スペクトルを、マルチモード−エレクトロスプレー及びAPCI（極性：陽イオン及び陰イオン）を備えるAgilent製の質量分光計（シングル四重極型質量分光計）（キャピラリ：4.00KV、コロナ電流4.0μA、印加電圧、2.00kV、窒素ガス流：9.0L/分、ネブライザ圧力：40psig、質量範囲：100~1000m/z）、乾燥ガス温度250℃、気化器温度200℃で記録し、且つスペクトルをAgilent製のLCMS：クォータナリーポンプ、被加熱カラムコンパートメント、可変要素波長検出器で記録した。カラム：Eclipse XDB C18、5.0μm、150×4.6mm、カラム温度：周囲、波長（nm）：220nm、溶剤：A=0.05%の水中のTFA、B=0.05%のアセトニトリル中のTFA。勾配：時間/%B：0/5、0.5/5、3.5/90、5/90、5.1/5、7/5；流量：1.0ml/分。

10

【0296】

実施例1：4-（1-シアノシクロプロピル）-N-（シクロプロピルメチル）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル）エチル〕ベンズアミド（化合物P2）の調製

【化89】



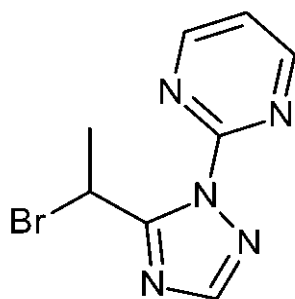
20

(化合物P2)

ステップA：2-〔5-（1-ブロモエチル）-1,2,4-トリアゾール-1-イル〕ピリミジン（I1）の調製。

30

【化90】



(I1)

40

250mLのフラスコに2-ブロモプロパンアミド（2.8g、18mmol）、ジクロロメタン（54mL）及び1,1-ジメトキシ-N,N-ジメチルメタンアミン（3.2g、27mmol）を仕込んだ。懸濁液を1時間還流し、得られた無色の溶液を蒸発させた。残渣を100mLのフラスコ中に移し、1,4-ジオキサン（18mL）及び酢酸（16mL）中に溶解した。次いで、ピリミジン-2-イルヒドラジン（2g、18mmol）を添加し、白色の懸濁液を90℃で2時間攪拌した。得られた均質混合物を蒸発させ、炭酸水素ナトリウムの飽和水溶液（30mL）で失活させた。水性相を酢酸エチルで抽出し（2×10mL）、組み合わせた有機相を水（2×5mL）、塩水（5mL）で洗浄し、Na2SO4で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、オレンジ色の粗油を得た。シリカゲルによるクロマトグラフィ（シクロヘキサン/酢酸エチル勾配、100：5~0：1

50

00) による精製で2-[5-(1-ブロモエチル)-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリミジン白色の固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm): $\delta = 8.90$ (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.40 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 6.41 (q, $J = 6.9$ Hz, 1H), 2.24 (d, $J = 6.9$ Hz, 3H);

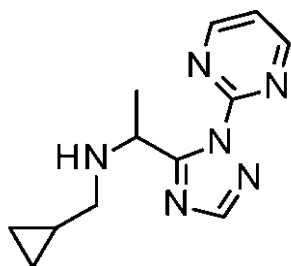
LC-MS (方法1): R_t 0.64、 $m/z = 255/256$ ($M+H^+$)。

【0297】

ステップB: N-(シクロプロピルメチル)-1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エタンアミン(I2)の調製

【化91】

10



(I2)

50 mLのフラスコに2-[5-(1-ブロモエチル)-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリミジン(0.5 g、2.0 mmol)、アセトニトリル(6 mL)、炭酸カリウム(0.55 g、4 mmol)及びシクロプロピルメタンアミン(170 mg、2.36 mmol)を仕込んだ。得られた懸濁液を80℃で2時間攪拌し、蒸発させ、水(5 mL)で失活させた。水性相を酢酸エチル(2×3 mL)で抽出し、組み合わせた有機相を水(2×3 mL)、塩水(3 mL)で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、N-(シクロプロピルメチル)-1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エタンアミンをベージュ色の油として得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): $\delta = 8.88$ (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), $8.05-8.05$ (m, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.37 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 4.96 (q, $J = 7.0$ Hz, 1H), $2.55-2.33$ (m, 2H), 2.22 (dd, $J = 7.5, 11.6$ Hz, 1H), 1.54 (d, $J = 7.0$ Hz, 3H), $0.96-0.81$ (m, 1H), $0.43-0.34$ (m, 2H), $0.07-0.09$ (m, 2H);

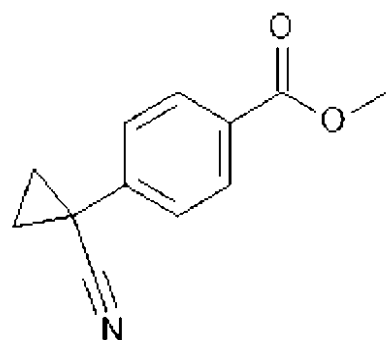
30

LC-MS (方法1): R_t 0.19、 $m/z = 245$ ($M+H^+$)。

【0298】

ステップC: 4-(1-シアノシクロプロピル)安息香酸メチルの調製

【化92】



40

100 mLのフラスコに4-(シアノメチル)安息香酸メチル(1 g、5.7 mmol)、アセトニトリル(46 mL)、炭酸セシウム(5.6 g、17 mmol)及び1,2-ジブロモエタン(1.3 g、5.8 mmol)を仕込んだ。得られた懸濁液を80℃で

50

3時間攪拌し、室温で冷却し、水（30 mL）で失活させた。水性混合物を酢酸エチル（2×20 mL）で抽出し、組み合わせた有機相を水（5 mL）、塩水（5 mL）で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。シリカゲルによるクロマトグラフィ（シクロヘキサン／酢酸エチル勾配、1：0→1：1）による精製で4-（1-シアノシクロプロピル）安息香酸メチルを得た。

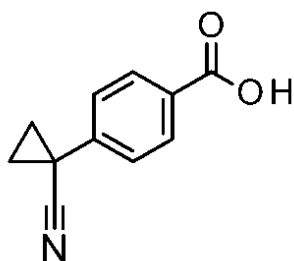
$^1\text{H-NMR}$ （400 MHz, CDCl_3 ）： δ = 8.05–8.00 (m, 2H), 7.37–7.33 (m, 2H), 3.93 (s, 3H), 1.85–1.80 (m, 2H), 1.51–1.47 (m, 2H)；

LC-MS（方法1）： R_t 0.87、 m/z = 202 ($M+1$)。

【0299】

ステップD：4-（1-シアノシクロプロピル）安息香酸の調製

【化93】



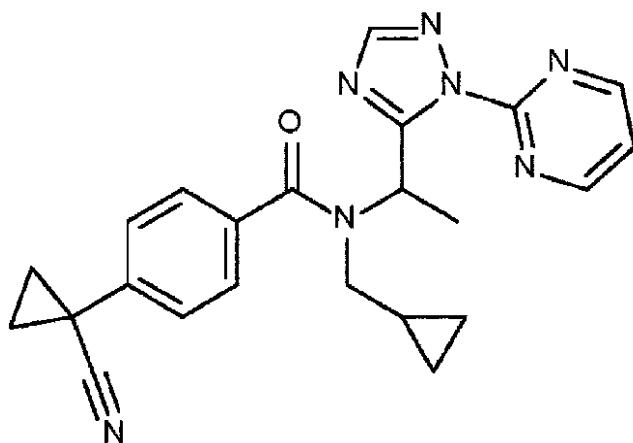
10 mLのフラスコに4-（1-シアノシクロプロピル）安息香酸メチル（140 mg、0.7 mmol）、テトラヒドロフラン（2 mL）、水（1 mL）及び水酸化リチウム一水和物（29.5 mg、0.7 mmol）を仕込んだ。この反応混合物を2時間激しく攪拌し、塩酸の1 M水溶液で酸性化した。水性相を酢酸エチル（2×2 mL）で抽出し、組み合わせた有機相を水（2 mL）で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて4-（1-シアノシクロプロピル）安息香酸を得、これを、さらに精製することなく次のステップにおいて用いた。

$^1\text{H-NMR}$ （400 MHz, CDCl_3 , ppm）： δ = 7.99–7.93 (m, 2H), 7.29–7.24 (m, 2H), 1.77–1.71 (m, 2H), 1.46–1.39 (m, 2H)；LC-MS（方法1）： R_t 0.69, m/z = 188 ($M+H^+$)。

【0300】

ステップE：4-（1-シアノシクロプロピル）-N-（シクロプロピルメチル）-N-[1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル]ベンズアミド（化合物P2）の調製

【化94】



(化合物P2)

10 mLのフラスコにN-（シクロプロピルメチル）-1-（2-ピリミジン-2-イ

ル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル) エタンアミン (90 mg、0.37 mmol)、N, N-ジメチルホルムアミド (1 mL)、N-エチル-N-イソプロピル-プロパン-2-アミン (130 μ L、0.74 mmol)、4-(1-シアノシクロプロピル)安息香酸 (76 mg、0.41 mmol) 及び 1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1, 2, 3-トリアゾロ[4, 5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロリン酸 (210 mg、0.55 mmol) を仕込んだ。得られた黄色/ベージュ色の溶液を室温で1時間攪拌し、蒸発させた。水性相を酢酸エチル (2 $\times$ 3 mL) で抽出し、組み合わせた有機相を水 (2 $\times$ 3 mL)、塩水 (3 mL) で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。シリカゲルによるクロマトグラフィ (ジクロロメタン/メタノール勾配、1:0~9:1) による精製で4-(1-シアノシクロプロピル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]ベンズアミドを得た。

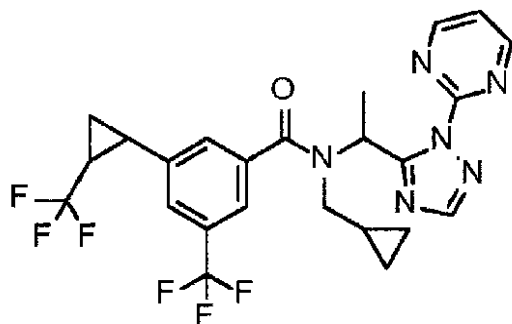
10

LC-MS (方法1): R_t 0.83、m/z = 414 (M+H⁺)。

【0301】

実施例2: N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]ベンズアミド (化合物P42) の調製

【化95】

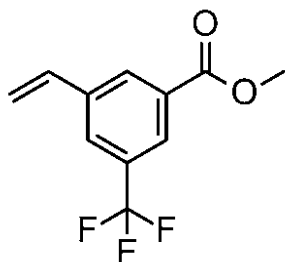


(化合物P42)

20

ステップA: 3-(トリフルオロメチル)-5-ビニル安息香酸メチルの調製

【化96】



30

3首丸底フラスコに3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)-安息香酸メチル (3.00 g、10 mmol)、トリブチル(ビニル)錫 (4.20 g、3.8 mL、12 mmol)、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (0.12 g、0.10 mmol) 及びトルエン (62 mL) を20℃でアルゴン雰囲気下において仕込んだ。明るいオレンジ色の溶液を110℃で加熱し、2時間攪拌した。この反応混合物を室温に冷却し、酢酸エチルで希釈し、Celite (登録商標) パッドを通してろ過した。減圧下で蒸発させた後、粗生成物を粘性の液体として得た。得られた粗材料をシリカゲルによるカラムクロマトグラフィにより精製して、純粋な3-(トリフルオロメチル)-5-ビニル安息香酸メチル (2.10 g) を無色の液体として得た。

40

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm): δ = 3.94-4.01 (m, 3H), 5.46 (d, J = 10.64 Hz, 1H), 5.93 (d, J = 17.61 Hz, 1H), 6.73-6.84 (m, 1H), 7.80-7.84 (m, 1H) 8.17-

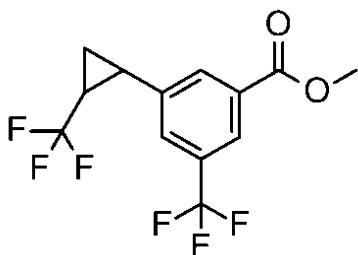
50

8.21 (m, 1H) 8.23–8.28 (m, 1H).

【0302】

ステップB：3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸メチルの調製

【化97】



10

バイアルに3-(トリフルオロメチル)-5-ビニル安息香酸メチル(0.41g、1.78mmol)、CsF(0.38g、2.14mmol)、(0.08g、0.11mmol)メソーテトラフェニルボルフィン塩化鉄(III)、(トリフルオロエチル)-ジフェニル-スルホニウム塩トリフレート(1.00g、2.39mmol)及びDMA(8.7mL)をアルゴン雰囲気下で仕込んだ。反応を20℃、アルゴン雰囲気下で4日間攪拌し、次いでCH₂Cl₂及び水で希釈した。有機相を分離し、水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。残渣を、シクロヘキサン中における0~10%の酢酸エチルの勾配を溶離液として用いる、シリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィーに供して、3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸メチル(0.28g)を無色の液体として得た。

20

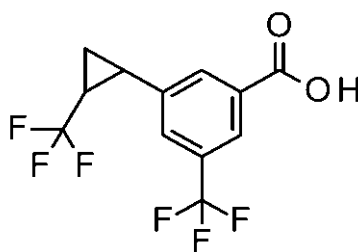
¹H-NMR(400MHz, CDCl₃, ppm): δ=1.25–1.34(m, 1H), 1.48–1.55(m, 1H), 1.88–2.00(m, 1H), 2.46–2.53(m, 1H), 3.98(s, 3H), 7.60(s, 1H), 7.98(s, 1H), 8.19(s, 1H).

【0303】

ステップC：3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸メチル(I6)の調製

30

【化98】



(I6)

バイアルに3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸塩(0.28g、0.66mmol)、LiOH(7.0mg、1.73mmol)、3.0mLのTHF及び1.3mLの水を仕込んだ。この反応混合物を20℃で2時間攪拌した。次いで、反応混合物を0℃に冷却し、HCl(1M)で酸性化し、15mLの酢酸エチル(2×)で抽出し、塩水で洗浄した。有機相を分離し、水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸を白色の固体として得た。この生成物を、さらなる精製を行うことなく次のステップにおいて用いた。

40

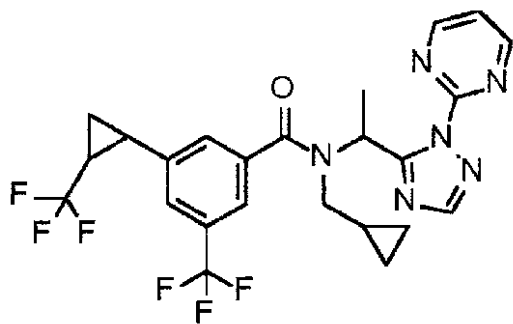
LC-MS(方法1): R_t 1.00、m/z=297(M-H⁺).

【0304】

ステップD：N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-

50

1, 2, 4-トリアゾール-3-イル) エチル] - 3- (トリフルオロメチル) - 5- [2- (トリフルオロメチル) シクロプロピル] ベンズアミド (化合物 P 4 2) の調製
【化 9 9】



10

(化合物P42)

10 mL のフラスコに N- (シクロプロピルメチル) - 1- (2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル) エタンアミン (0.10 g、0.41 mmol)、N, N-ジメチルホルムアミド (2.50 mL)、N-エチル-N-イソプロピルプロパン-2-アミン (0.11 g、0.82 mmol)、3- (トリフルオロメチル) - 5- [2- (トリフルオロメチル) シクロプロピル] 安息香酸 (0.13 g、0.45 mmol) 及び 1- [ビス (ジメチルアミノ) メチレン] - 1H-1, 2, 3-トリアゾロ [4, 5-b] ピリジニウム 3-オキシドヘキサフルオロリン酸 (0.23 g、0.61 mmol) を仕込んだ。この反応混合物を室温で 2 時間攪拌し、次いで冷たい NH₄Cl の水溶液中に注ぎ入れた。次いで、水性相を酢酸エチルで抽出し、水及び塩水で洗浄した。組み合わせた有機相を Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。シリカゲルによるクロマトグラフィ (シクロヘキサン中に 0~10% の酢酸エチルの勾配、次いでジクロロメタン中のメタノール) による粗生成物の精製で N- (シクロプロピルメチル) - N- [1- (2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル) エチル] - 3- (トリフルオロメチル) - 5- [2- (トリフルオロメチル) シクロプロピル] ベンズアミドを無色の樹脂として得た。

20

¹H-NMR (600 MHz, DMSO-d₆, ppm) δ = -0.19~0.06 (m, 1H), -0.04~0.06 (m, 1H), 0.27~0.41 (m, 2H), 0.78 (br s, 1H), 1.29~1.35 (m, 1H), 1.37~1.47 (m, 1H), 1.77 (d, J=6.9 Hz, 3H), 2.23~2.32 (m, 1H), 2.53~2.58 (m, 1H), 3.12 (br dd, J=15.1, 6.2 Hz, 1H), 3.26 (br dd, J=14.8, 5.7 Hz, 1H), 6.22 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.23 (s, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.57 (td, J=4.7, 3.2 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.84 (d, J=4.7 Hz, 2H)。

30

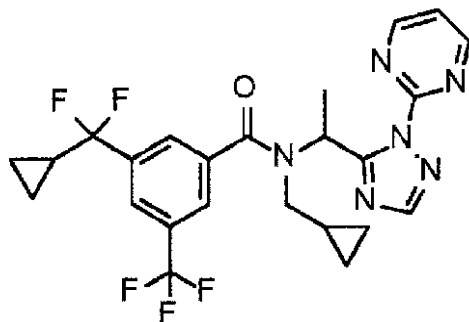
LC-MS (方法 1) : R_t 1.07、m/z = 525 (M+H⁺)。

【0305】

実施例 3 : 3- [シクロプロピル (ジフルオロ) メチル] - N- (シクロプロピルメチル) - N- [1- (2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル) エチル] - 5- (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 P 4 9) の調製

40

【化 1 0 0】

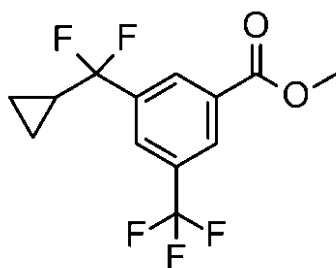


(化合物P49)

10

ステップA：3-〔シクロプロピル（ジフルオロ）メチル〕-5-（トリフルオロメチル）安息香酸メチルの調製

【化 1 0 1】



20

磁気攪拌機を備える50 mLの丸底フラスコに3-（シクロプロパンカルボニル）-5-（トリフルオロメチル）安息香酸メチル（0.80 g、2.94 mmol、国際公開第2006/067445号、第148ページと同様に調製した）及び2,2-ジフルオロ-1,3-ジメチルイミダゾリンを20℃においてアルゴン雰囲気下で仕込んだ。この反応混合物を110℃で14時間攪拌した。反応混合物を0℃に冷却し、慎重に Na_2CO_3 の飽和水溶液で失活させた。次いで、水性相を酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機相を Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。最後に、粗生成物を、シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィ（シクロヘキサン中に0～30%の酢酸エチルの勾配）により精製して、3-〔シクロプロピル（ジフルオロ）メチル〕-5-（トリフルオロメチル）安息香酸メチル（0.64 g）を無色の油として得た。

30

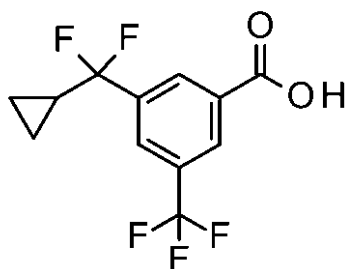
$^1\text{H-NMR}$ （400 MHz, CDCl_3 , ppm） δ = 8.40（1H, s）, 8.38（1H, s）, 7.98（1H, t, J = 0.74 Hz）, 4.00（3H, s）, 1.50–1.58（1H, m）, 0.81–0.87（2H, m）, 0.72–0.80（2H, m）。

【0306】

ステップB：3-〔シクロプロピル（ジフルオロ）メチル〕-5-（トリフルオロメチル）安息香酸（I26）の調製

40

【化 1 0 2】



(I26)

50

バイアルに 3-〔シクロプロピル（ジフルオロ）メチル〕-5-（トリフルオロメチル）安息香酸メチル（0.64 g、2.18 mmol）、LiOH（9.2 mg、2.18 mmol）、6.50 mL の THF 及び 3.30 mL の水を仕込んだ。この反応混合物を 20℃ で 1.5 時間撹拌した。この反応混合物を 0℃ に冷却し、HCl（1 M）で酸性化し（pH = 2）、酢酸エチル（3×）で抽出し、塩水で洗浄した。有機相を分離し、水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3-〔シクロプロピル（ジフルオロ）メチル〕-5-（トリフルオロメチル）安息香酸（0.57 g）を白色の固体として得た。粗生成物は、十分に純粋であり、そのまま次のステップに用いた。

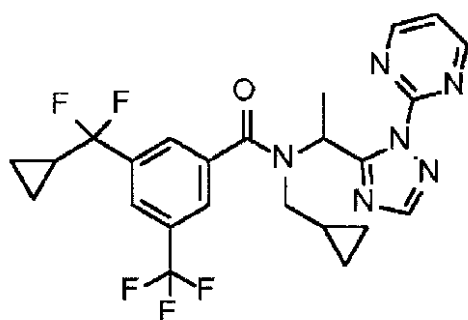
¹H-NMR（400 MHz, CDCl₃, ppm）：δ = 10.70–12.60（1H, br s）, 8.48（1H, s）, 8.45（1H, s）, 8.05（1H, m）, 1.46–1.58（1H, m）, 0.80–0.88（2H, m）, 0.73–0.79（2H, m）。

10

【0307】

ステップ C：3-〔シクロプロピル（ジフルオロ）メチル〕-N-（シクロプロピルメチル）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（化合物 P49）の調製

【化103】



20

(化合物P49)

バイアルに N-（シクロプロピルメチル）-1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エタンアミン（0.16 g、0.63 mmol）、アセトニトリル（1.90 mL）、N-エチル-N-イソプロピルプロパン-2-アミン（0.17 g、0.22 mL、1.27 mmol）、3-〔シクロプロピル（ジフルオロ）メチル〕-5-（トリフルオロメチル）安息香酸（0.19 g、0.67 mmol）及び 1-〔ビス（ジメチルアミノ）メチレン〕-1H-1, 2, 3-トリアゾロ〔4, 5-b〕ピリジニウム 3-オキシドヘキサフルオロリン酸（0.37 g、0.095 mmol）を仕込んだ。得られた黄色の溶液を室温で 1.5 時間撹拌し、次いで減圧下で濃縮した。シリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ（シクロヘキサン中に 0～80% の酢酸エチルの勾配）による粗生成物の精製で 3-〔シクロプロピル（ジフルオロ）メチル〕-N-（シクロプロピルメチル）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（0.28 g）を明るい黄色の樹脂として得た。

30

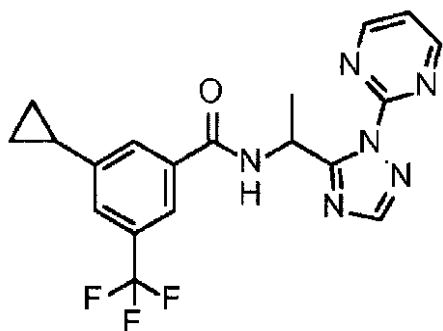
40

LC-MS（方法 1）：R_t 1.06、m/z = 507（M+H⁺）。

【0308】

実施例 4：3-シクロプロピル-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（化合物 P24）の調製

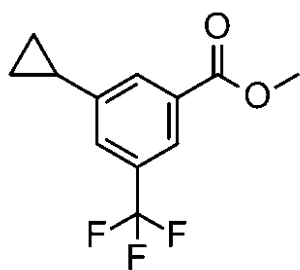
【化 1 0 4】



(化合物P24)

10

ステップ A：3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルの調製
【化 1 0 5】



20

3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル (1.00 g、3.46 mmol) を仕込んだバイアルに 1,4-ジオキサン (8.70 mL)、 Na_2CO_3 の 3 N 溶液 (1.10 g、10.40 mmol、3.50 mL)、シクロプロピルボロン酸 (0.62 g、6.92 mmol) 及び $\text{Pd}(\text{Cl}_2(\text{dppf}))$ (0.14 g、0.173 mmol) を添加した (国際公開第 2013/171712 号、第 109 ページと同様)。この反応混合物をアルゴンで 5 分間脱気し、次いで 100 °C で 3 時間攪拌した。この反応混合物を室温に冷却し、水で希釈し、酢酸エチル (3 ×) で抽出した。組み合わせた有機層を乾燥させ (Na_2SO_4)、ろ過し、減圧中で蒸発させた。粗生成物をシリカゲルによるフラッシュカラムクロマトグラフィ (シクロヘキサン中に 0~15% の酢酸エチルの勾配) により精製して、3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル (0.77 g) を明るい黄色の油として得た。

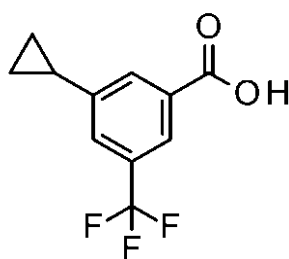
30

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) : δ = 8.07 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.51 (1H, s), 3.95 (3H, s), 2.02 (1H, tt, J = 8.44, 5.14 Hz), 1.04–1.14 (2H, m), 0.74–0.87 (2H, m)。

【0309】

ステップ B：3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸 (I5) の調製
【化 1 0 6】

40



(I5)

バイアルに 3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル (0.7

50

7 g、3.14 mmol)、LiOH-水和物(0.133 g、3.14 mmol)、9.4 mLのTHF及び4.7 mLの水を仕込んだ。この反応混合物を20℃で3時間攪拌した。次いで、反応をHCl(1M)で酸性化し(pH=2)、酢酸エチル(3×)で抽出した。組み合わせた有機相をNa₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸(0.72 g)を白色の固体として得た。粗生成物は、十分に純粋であり、そのまま次のステップに用いた。

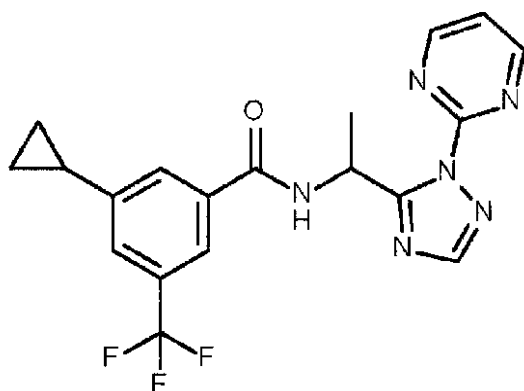
¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃, ppm): δ = 10.4-10.9(1H, br s), 8.14(1H, s), 7.97(1H, s), 7.57(1H, s), 2.08-2.01(1H, m), 1.08-1.14(2H, m), 0.80-0.86(2H, m).

LC-MS(方法1): R_t 0.96、m/z = 229(M-H⁺)。

【0310】

ステップC: 3-シクロプロピル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物P24)の調製

【化107】



(化合物P24)

バイアルに1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エタンアミン(0.20 g、1.05 mmol)(国際公開第2017/192385号、第30ページに従って調製した)、アセトニトリル(3.2 mL)、N-エチル-N-イソプロピルプロパン-2-アミン(0.28 g、0.37 mL、2.10 mmol)、(3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸(0.242 g、1.05 mmol)及び1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1, 2, 3-トリアゾロ[4, 5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロリン酸(0.62 g、1.58 mmol)(Tetrahedron Lett. 1999, 40, 3109と同様)を仕込んだ。得られた黄色の溶液を室温で1時間攪拌し、次いで減圧下で濃縮した。シリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ(H₂O中における0~80%のアセトニトリルの勾配)による粗生成物の精製で3-シクロプロピル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(0.17 g)を明るいオレンジ色の粉末として得た。

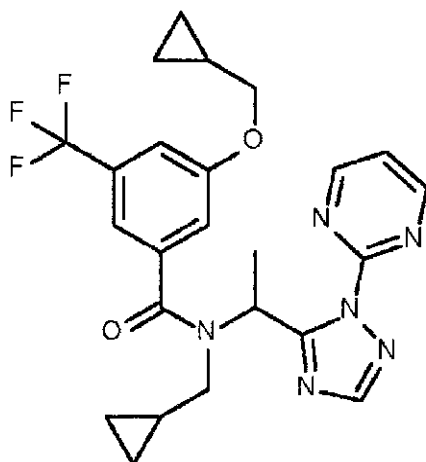
¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃, ppm): δ = 8.93(2H, d, J = 4.77 Hz), 8.07(1H, s), 7.81(1H, m), 7.71(1H, m), 7.44(2H, m), 7.41(1H, t, J = 4.77 Hz), 6.42-6.50(1H, m), 1.98-2.06(1H, m), 1.71(3H, d, J = 6.97 Hz), 1.06-1.12(2H, m), 0.78-0.83(2H, m).

LC-MS(方法1): R_t 0.94、m/z = 403(M+H⁺)。

【0311】

実施例5: 3-(シクロプロピルメトキシ)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-

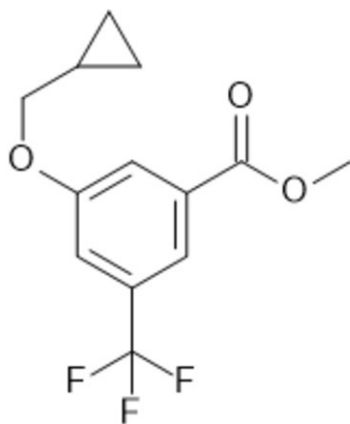
(トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 P 4 7) の調製
【化 1 0 8】



(化合物P47)

10

ステップ A : 3 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) 安息香酸メチルの調製
【化 1 0 9】



20

30

バイアル中においてアルゴン雰囲気下で 3 - ヒドロキシ - 5 - (トリフルオロメチル) 安息香酸メチル (CAS : 7 9 6 1 1 9 - 6 3 - 6、0. 2 5 8 g、1. 1 7 m m o l) を DMF (6 m L) 中に溶解した。ジセシウム；炭酸セシウム (1. 1 5 g、3. 5 2 m m o l) 及びブロモメチルシクロプロパン (1. 1 4 m L、1 1. 7 m m o l) を添加し、溶液を 1 0 0 °C で 4 時間攪拌した。この反応混合物を水で失活させ、水性層を酢酸エチルで 2 回抽出した。有機相を水、次いで塩水で 4 回洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) 安息香酸メチルを得た。

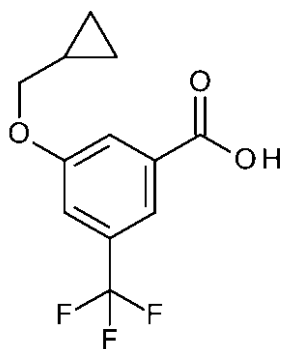
40

LC-MS (方法 1) : R t 1. 1 6 分間、 $m/z = 275$ (M+H+)。

【0 3 1 2】

ステップ B : 3 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) 安息香酸 (I 2 4) の調製

【化 1 1 0】



(I24)

10

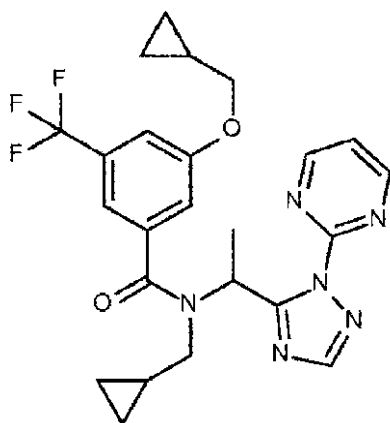
3-(シクロプロピルメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル(0.315 g、1.15 mmol)をTHF(3.5 mL)及び水(1.7 mL)中に溶解した。水酸化リチウム-水和物(0.073 g、1.72 mmol)を添加し、得られた混合物を室温で一晩攪拌した。この反応混合物を水で失活させ、水性層を酢酸エチルで抽出した。次いで、水性層をHCl 2 M溶液でpH 2まで酸性化し、酢酸エチルで2回、再度抽出した。組み合わせた有機層を水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3-(シクロプロピルメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸を得た。LC-MS(方法1): R_t 1.00分間、 $m/z = 259$ (M-H⁺)。

20

【0 3 1 3】

ステップC: 3-(シクロプロピルメトキシ)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物P47)の調製

【化 1 1 1】



(化合物P47)

30

化合物P47を、3-(シクロプロピルメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸及び化合物P49(ステップC)に記載の条件を用いて調製した。

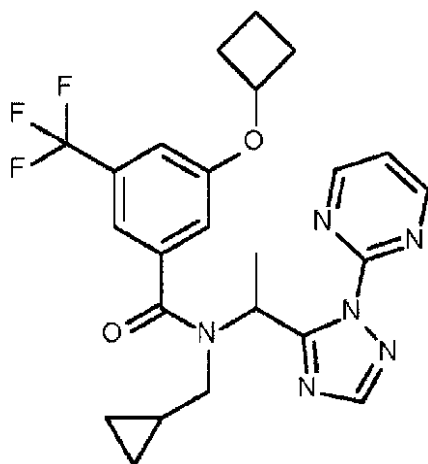
40

LC-MS(方法1): R_t 1.07、 $m/z = 486$ (M+H⁺)。

【0 3 1 4】

実施例6: 3-(シクロプロピルメトキシ)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物P48)の調製

【化 1 1 2】

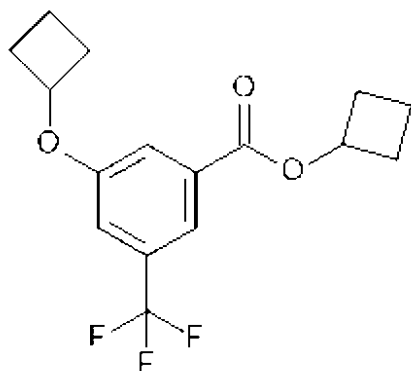


10

(化合物P48)

ステップA：シクロブチル 3-（シクロブトキシ）-5-（トリフルオロメチル）安息香酸塩の調製

【化 1 1 3】



20

バイアル中においてアルゴン雰囲気下で 3-ヒドロキシ-5-（トリフルオロメチル）安息香酸メチル（CAS：796119-63-6、0.150 g、0.728 mmol）を DMF（4 mL）中に溶解した。炭酸セシウム（0.711 g、2.18 mmol）及びブロモシクロブタン（0.685 mL、7.28 mmol）を添加し、溶液を 100℃で 4 時間攪拌した。この反応混合物を水で失活させ、水性層を酢酸エチルで 2 回抽出した。有機相を水、次いで塩水で 4 回洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、シクロブチル 3-（シクロブトキシ）-5-（トリフルオロメチル）安息香酸塩を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ （400 MHz, CDCl_3 , ppm） δ = 1.68–1.82（m, 2H）, 1.84–1.98（m, 2H）, 2.13–2.31（m, 4H）, 2.43–2.57（m, 4H）, 4.74（t, J = 7.15 Hz, 1H）, 5.24（dd, J = 8.07, 6.97 Hz, 1H）, 7.24（t, J = 1.65 Hz, 1H）, 7.64（d, J = 2.20 Hz, 1H）, 7.86（s, 1H）。

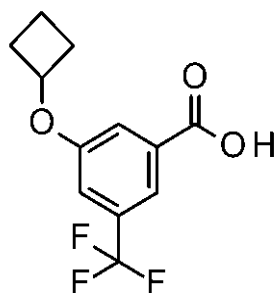
40

LC-MS（方法1）：Rt 1.33 分間、 m/z = 315（M+H⁺）。

【0315】

ステップB：3-（シクロブトキシ）-5-（トリフルオロメチル）安息香酸（I25）の調製

【化 1 1 4】



(I25)

10

シクロブチル 3-(シクロブトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸塩 (0.204 g、0.649 mmol) を THF (2 mL) 及び水 (1 mL) 中に溶解した。水酸化リチウム-水和物 (0.041 g、0.974 mmol) を添加し、得られた混合物を 60 °C で一晩撹拌した。この反応混合物を水で失活させ、水性層を酢酸エチルで抽出した。次いで、水性層を HCl 2 M 溶液で pH 2 まで酸性化し、酢酸エチルで 2 回、再度抽出した。有機層を水で洗浄し、Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3-(シクロブトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸を得た。

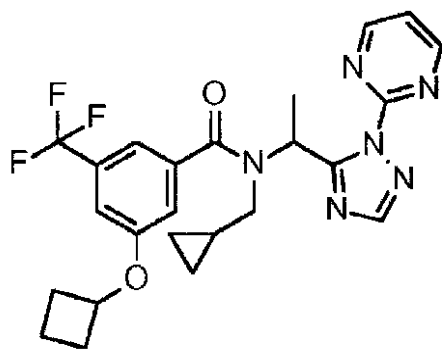
LC-MS (方法 1) : Rt 1.03 分間、m/z = 261 (M+H⁺)。

【0316】

20

ステップ C : 3-(シクロブトキシ)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (化合物 P48) の調製

【化 1 1 5】



(化合物P48)

30

化合物 P48 を、3-(シクロブトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸及び化合物 P49 (ステップ C) に記載の条件を用いて調製した。

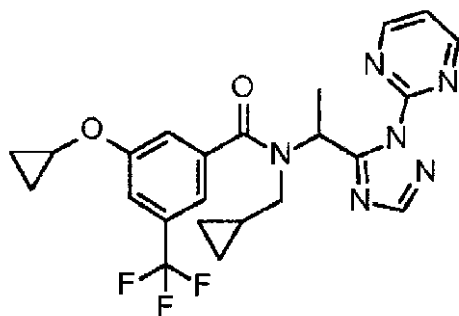
LC-MS (方法 1) : Rt 1.08、m/z = 487 (M+H⁺)。

【0317】

実施例 7 : 3-(シクロプロポキシ)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (化合物 P51) の調製

40

【化 1 1 6】



(化合物P51)

10

化合物 P 5 1 を、化合物 P 4 8 に記載の条件を用いて調製して、3-（シクロプロポキシ）-N-（シクロプロピルメチル）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミドを得た。

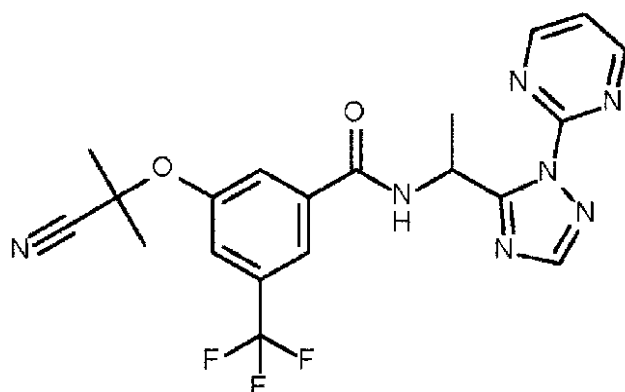
LC-MS（方法1）：R_t 1.02分間、m/z = 473（M+H⁺）。

【0318】

実施例 8：3-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（化合物 P 5 6）の調製

20

【化 1 1 7】

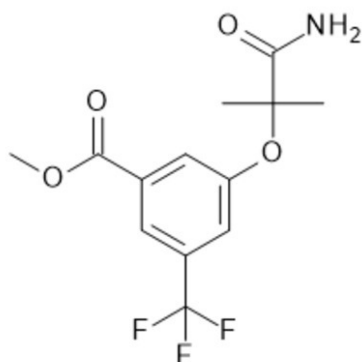


(化合物P56)

30

ステップ A：3-（2-アミノ-1, 1-ジメチル-2-オキソ-エトキシ）-5-（トリフルオロメチル）安息香酸メチルの調製

【化 1 1 8】



40

メチル-3-ヒドロキシ-5-（トリフルオロメチル）安息香酸塩（0.50 g、2.2 mmol）をアセトニトリル（11 mL）中に溶解した。次いで、炭酸セシウム（1.1 g、3.3 mmol）を添加した。得られた懸濁液を5分間攪拌し、2-ブロモ-2-メチル-プロパンアミド（0.59 g、3.6 mmol）を添加した。反応混合物を70

50

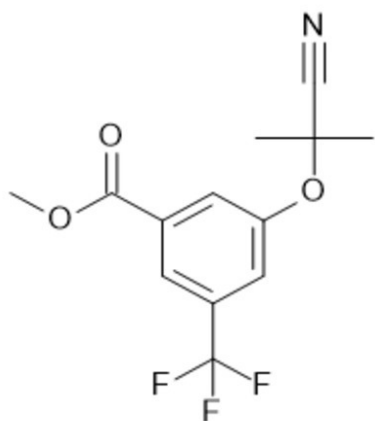
℃で一晩攪拌した。この反応混合物を蒸発させ、水及び酢酸エチルを添加した。有機相を分離し、塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3-(2-アミノ-1,1-ジメチル-2-オキソ-エトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルを得た。

LC-MS (方法1) : Rt 0.89分間、 $m/z = 306$ (M+H+)。

【0319】

ステップB : 3-(1-シアノ-1-メチル-エトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルの調製

【化119】



10

20

メチル-3-(2-アミノ-1,1-ジメチル-2-オキソ-エトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸塩 (0.72 g, 2.4 mmol) をジクロロメタン (24 mL) 中に懸濁させ、トリエチルアミン (3 mL, 9.4 mmol) を添加した。混合物を 0℃に冷却し、トリフルオロ酢酸無水物 (0.99 mL, 7.1 mmol) を滴下した。得られた黄色の溶液を室温で一晩攪拌した。この反応混合物を慎重にメタノールで失活させ、次いで NaHCO_3 で失活させ (ガスが形成した)、次いで水性層をジクロロメタンで2回抽出した。組み合わせた有機層を Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。粗残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-(1-シアノ-1-メチル-エトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルを得た。

30

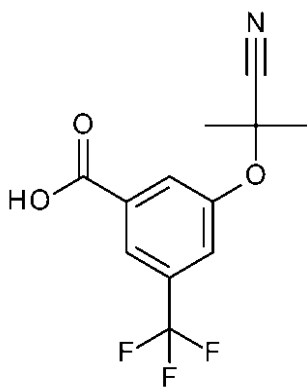
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) $\delta = 1.80$ (s, 6H), 3.99 (s, 3H), 7.63 (t, $J = 1.65$ Hz, 1H), 8.05 (d, $J = 1.47$ Hz, 1H), 8.10–8.16 (m, 1H)。

LC-MS (方法1) : Rt 1.09分間、 $m/z = 286$ (M+H+)。

【0320】

ステップC : 3-(1-シアノ-1-メチル-エトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸 (I30) の調製

【化120】



(I30)

40

メチル-3-(1-シアノ-1-メチル-エトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安

50

息香酸塩（0.36 g、1.3 mmol）をTHF（5.4 mL）及び水（1.8 mL）中に溶解し、次いで水酸化リチウム水和物（0.11 g、2.5 mmol）を添加し、混合物を室温で3時間攪拌した。THFを蒸発させ、次いで水（2 mL）を添加し、混合物を塩酸（2.0 mol/L）でpH 5に酸性化した。酢酸エチル及び水を添加し、有機相を分離し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、3-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-5-（トリフルオロメチル）安息香酸を得た。

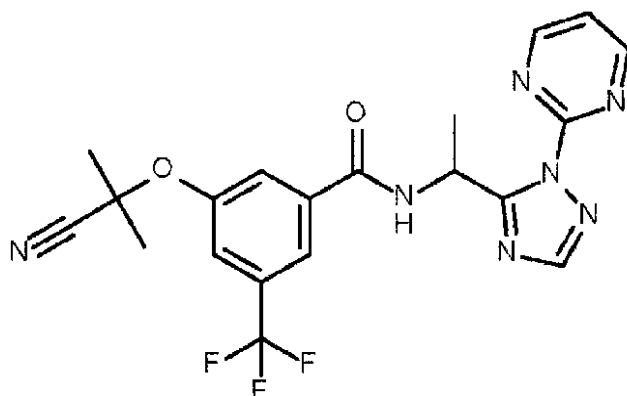
LC-MS（方法1）：Rt 0.92分間、 $m/z = 272$ （ $\text{M}-\text{H}^+$ ）。

【0321】

ステップD：3-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（化合物P56）の調製

10

【化121】



20

（化合物P56）

化合物P56を、3-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-5-（トリフルオロメチル）安息香酸及び化合物P49（ステップC）に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ （400 MHz, DMSO, ppm） $\delta = 1.65$ （d, $J = 6.97$ Hz, 3H）, 1.74（s, 6H）, 6.01（t, $J = 6.97$ Hz, 1H）, 7.55–7.70（m, 2H）, 7.84（s, 1H）, 8.00（s, 1H）, 8.18（s, 1H）, 8.99（d, $J = 5.14$ Hz, 2H）, 9.39（d, $J = 7.34$ Hz, 1H）。

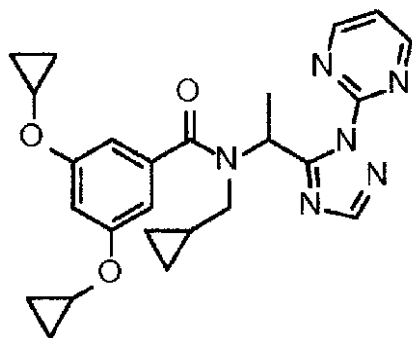
30

LC-MS（方法1）：Rt 0.89分間、 $m/z = 446$ （ $\text{M}+\text{H}^+$ ）。

【0322】

実施例9：3, 5-ビス（シクロプロポキシ）-N-（シクロプロピルメチル）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル〕ベンズアミド（化合物P60）の調製

【化122】

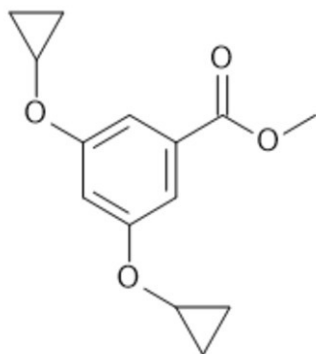


40

（化合物P60）

ステップA：3, 5-ビス（シクロプロポキシ）安息香酸メチルの調製

【化 1 2 3】



10

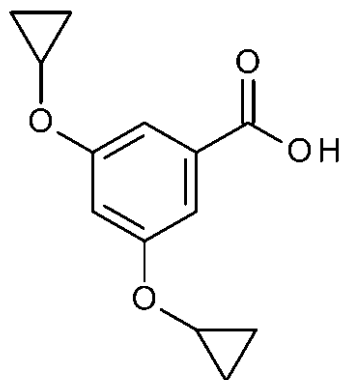
バイアル中においてアルゴン雰囲気下で 3, 5-ジヒドロキシ安息香酸メチル (CAS : 2150-44-9、0.100 g、0.595 mmol) を DMF (3 mL) 中に溶解した。炭酸セシウム (0.585 g、1.78 mmol) 及びプロモシクロプロパン (0.476 mL、5.95 mmol) を添加し、バイアルを閉じ、マイクロ波システム下において 200 °C で 1 時間攪拌した。この反応混合物を水で失活させ、水性層を酢酸エチルで 2 回抽出した。有機相を水、次いで塩水で 4 回洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3, 5-ビス (シクロプロポキシ) 安息香酸メチルを得た。
LC-MS (方法 1) : Rt 1.09 分間、 $m/z = 249$ (M+H⁺)。

20

【0 3 2 3】

ステップ B : 3, 5-ビス (シクロプロポキシ) 安息香酸 (I 31) の調製

【化 1 2 4】



(I31)

30

メチル-3, 5-ビス (シクロプロポキシ) 安息香酸塩 (0.111 g、0.447 mmol) を THF (1.5 mL) 及び水 (1 mL) 中に溶解した。水酸化リチウム一水和物 (0.018 g、0.447 mmol) を添加し、得られた混合物を室温で一晩攪拌した。この反応混合物を水で失活させ、水性層を酢酸エチルで抽出した。次いで、水性層を HCl (2 M) で pH 2 まで酸性化し、酢酸エチル (2 ×) で再度抽出した。有機層を水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3, 5-ビス (シクロプロポキシ) 安息香酸を得た。

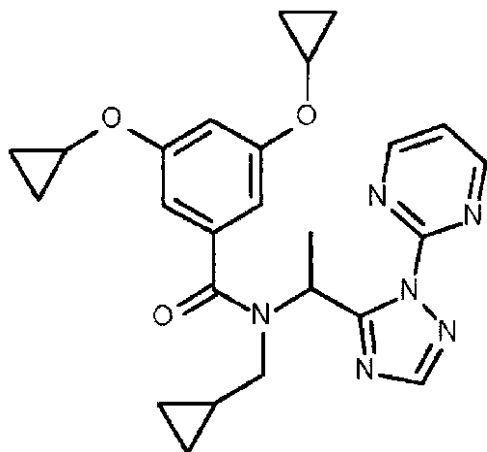
40

LC-MS (方法 1) : Rt 0.91 分間、 $m/z = 233$ (M-H⁺)。

【0 3 2 4】

ステップ C : 3, 5-ビス (シクロプロポキシ) -N- (シクロプロピルメチル) -N- [1- (2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル) エチル] ベンズアミド (化合物 P 60) の調製

【化 1 2 5】



(化合物P60)

10

化合物 P 6 0 を、3, 5-ビス (シクロプロポキシ) 安息香酸及び化合物 P 4 9 (ステップ C) に記載の条件を用いて調製した。

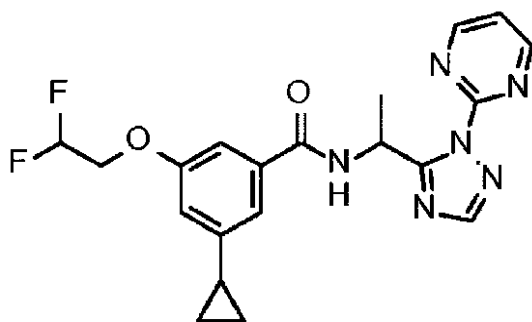
LC-MS (方法 1) : R_t 0.99 分間、 $m/z = 461$ (M+H⁺)。

【0 3 2 5】

実施例 10 : 3-シクロプロピル-5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]ベンズアミド (化合物 P 6 1) の調製

20

【化 1 2 6】

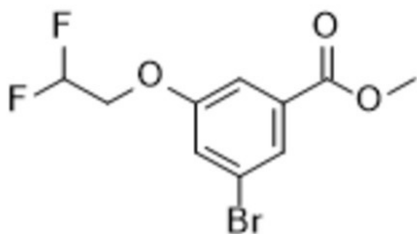


(化合物P61)

30

ステップ A : 3-ブロモ-5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)安息香酸メチルの調製

【化 1 2 7】



40

メチル-3-ブロモ-5-ヒドロキシ安息香酸塩 (CAS : 192810-12-1、0.200 g、0.866 mmol) をバイアル中に仕込み、アセトニトリル (2 mL) 中に溶解し、炭酸セシウム (0.570 mg、1.73 mmol) を添加した。得られた黄色の混合物をアルゴンでパージし、2, 2-ジフルオロエチルトリフルオロメタンスルホネート (0.195 mg、0.909 mmol) を添加し、溶液を室温で 1 時間攪拌した。混合物を水中に注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出した (2×)。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて、3-ブロモ-5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)安息香酸メチルを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ 3.94 (s, 3H) 4.24 (

50

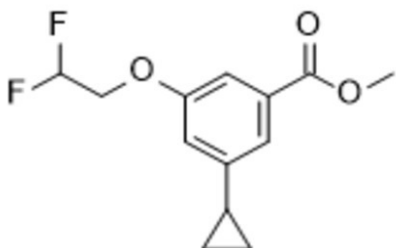
t d, $J = 12.84, 4.03 \text{ Hz}$, 2H) 5.94–6.30 (m, 1H) 7.30 (dd, $J = 2.57, 1.83 \text{ Hz}$, 1H) 7.52 (dd, $J = 2.38, 1.28 \text{ Hz}$, 1H) 7.85 (t, $J = 1.47 \text{ Hz}$, 1H)

LC-MS (方法1): Rt 1.07 分間、 $m/z = 293$ (M-H⁺)。

【0326】

ステップB: 3-シクロプロピル-5-(2,2-ジフルオロエトキシ)安息香酸メチルの調製

【化128】



10

メチル-3-ブロモ-5-(2,2-ジフルオロエトキシ)安息香酸塩 (0.255 g、0.864 mmol) をバイアル中に仕込み、1,4-ジオキサン (2 mL) 中に溶解して、黄色の清透な溶液を得た。溶液をアルゴンでバージし、続いてシクロプロピルボロン酸 (0.155 g、1.73 mmol)、炭酸ナトリウム (0.275 g、2.59 mmol)、水 (0.8 mL) 及び PdCl₂(dppf) (0.035 g、0.0432 mmol) を添加した。

20

【0327】

オレンジ色の溶液を 100 °C に加熱し、2 時間攪拌した。水を混合物に添加し、酢酸エチル (3×) で抽出を行った。組み合わせた有機層を Na₂SO₄ で乾燥させ、焼結ディスクフィルタ漏斗でろ過し、減圧下において 40 °C で濃縮した。粗残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-シクロプロピル-5-(2,2-ジフルオロエトキシ)安息香酸メチルを得た。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ 0.70–0.79 (m, 2H) 0.97–1.07 (m, 2H) 1.88–1.99 (m, 1H) 3.92 (s, 3H) 4.23 (td, $J = 13.11, 4.22 \text{ Hz}$, 2H) 5.92–6.29 (m, 1H) 6.84–6.90 (m, 1H) 7.35 (dd, $J = 2.38, 1.28 \text{ Hz}$, 1H) 7.44 (t, $J = 1.47 \text{ Hz}$, 1H)

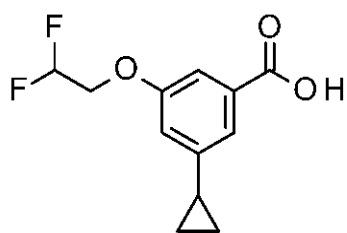
30

LC-MS (方法1): Rt 1.07 分間、 $m/z = 257$ (M+H⁺)。

【0328】

ステップC: 3-シクロプロピル-5-(2,2-ジフルオロエトキシ)安息香酸 (I 32) の調製

【化129】



(I32)

40

3-シクロプロピル-5-(2,2-ジフルオロエトキシ)安息香酸メチル (0.128 g、0.500 mmol) をフラスコ中に仕込み、テトラヒドロフラン (1.5 mL) 及び水 (1 mL) 中に溶解して無色の溶液を得た。

【0329】

50

この溶液に水酸化リチウム一水和物（0.024 mg、0.999 mmol）を添加し、得られた混合物を室温で一晩攪拌した。反応溶液を1 M HClで酸性化し、次いで酢酸エチル（2×）で抽出した。組み合わせた有機相をNa₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、次いで濃縮して、3-シクロプロピル-5-（2, 2-ジフルオロエトキシ）安息香酸を得た。

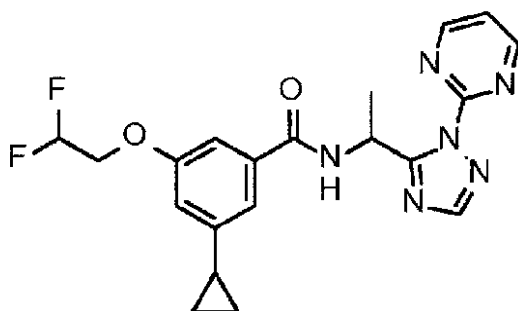
¹H-NMR（400 MHz, DMSO-d₆, ppm）δ 0.70-0.77（m, 2H）0.94-1.00（m, 2H）1.95-2.06（m, 1H）4.36（td, J=14.76, 3.48 Hz, 2H）6.21-6.54（m, 1H）6.91-6.97（m, 1H）7.26（dd, J=2.38, 1.28 Hz, 1H）7.31（t, J=1.28 Hz, 1H）11.73-13.25（m, 1H）

LC-MS（方法1）：Rt 0.91分間、m/z = 241（M-H⁺）。

【0330】

ステップD：3-シクロプロピル-5-（2, 2-ジフルオロエトキシ）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル〕ベンズアミド（化合物P61）の調製

【化130】



(化合物P61)

1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エタンアミン；ヒドロクロリド（0.110 g、0.485 mmol）をN、N-ジメチルホルムアミド（1.5 mL）中に溶解した。N-エチル-N-イソプロピルプロパン-2-アミン（0.249 mL、1.46 mmol）を添加し、得られた混合物を室温で5分間攪拌した。次いで、3-シクロプロピル-5-（2, 2-ジフルオロエトキシ）安息香酸（0.129 g、0.534 mmol）、続いてHATU（0.277 mg、0.728 mmol）を添加して茶色の溶液を得、これを室温で一晩攪拌した。この反応混合物をNH₄Clに注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機相を水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物をクロマトグラフィにより2回精製して、3-シクロプロピル-5-（2, 2-ジフルオロエトキシ）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル）エチル〕ベンズアミドを得た。

¹H-NMR（400 MHz, CDCl₃, ppm）δ 0.66-0.78（m, 2H）0.87-1.12（m, 2H）1.69（d, J=6.97 Hz, 3H）1.91（tt, J=8.34, 5.04 Hz, 1H）4.09-4.24（m, 2H）5.90-6.24（m, 1H）6.41-6.49（m, 1H）6.73-6.77（m, 1H）7.13-7.19（m, 2H）7.40（t, J=4.95 Hz, 1H）7.43-7.51（m, 1H）8.05（s, 1H）8.91（d, J=4.77 Hz, 2H）

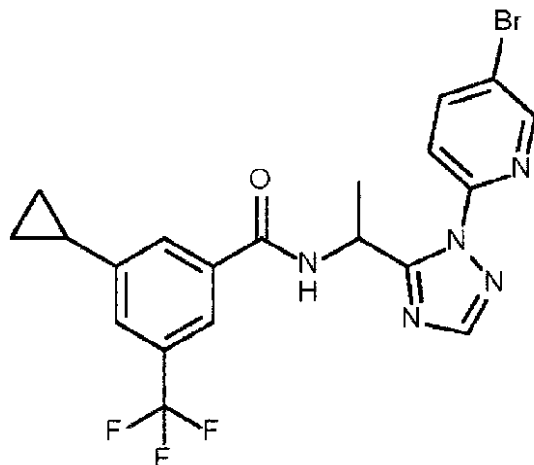
LC-MS（方法1）：Rt 0.88分間、m/z = 415（M+H⁺）。

m. p：128~132℃。

【0331】

実施例11：N-〔1-〔2-（5-ブロモ-2-ピリジル）-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル〕エチル〕-3-シクロプロピル-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（化合物P74）の調製

【化 1 3 1】

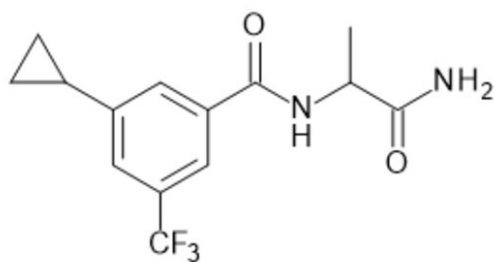


(化合物P74)

10

ステップA：N-(2-アミノ-1-メチル-2-オキソ-エチル)-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの調製

【化 1 3 2】



20

3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸(300mg、1.17mmol)の酢酸エチル(4.0mL)中の攪拌溶液に2-アミノプロパンアミド(287mg、2.93mmol)、続いて、T3P(1.49g、2.35mmol)及びDIPA(0.615mL、3.52mmol)を添加し、室温で16時間攪拌した。この反応混合物を水(100mL)で希釈し、ジクロロメタン(2×150mL)で抽出した。組み合わせた有機層を塩水(30mL)で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗材料をシリカゲルによるカラムクロマトグラフィにより精製して、N-(2-アミノ-1-メチル-2-オキソ-エチル)-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドを白色の固体として得た。

30

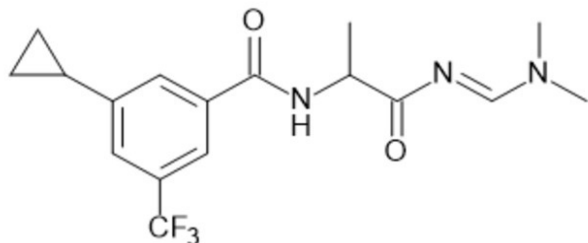
¹H-NMR(400MHz, DMSO-d₆, ppm): δ 8.71(d, J=7.6Hz, 1H), 7.98(s, 1H), 7.81(s, 1H), 7.62(s, 1H), 7.40(s, 1H), 7.01(s, 1H), 4.42(m, 1H), 2.11(m, 1H), 1.33(d, J=7.2Hz, 3H), 1.06-1.04(m, 2H), 1.03-0.83(m, 2H).

40

【0332】

ステップB：3-シクロプロピル-N-[2-[(E)-ジメチルアミノメチレンアミノ]-1-メチル-2-オキソ-エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの調製

【化 1 3 3】



N-〔2-アミノ-1-メチル-2-オキソ-エチル〕-3-シクロプロピル-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（50 mg、0.1 mmol）のジクロロメタン（2.0 mL）中の攪拌溶液に1,1-ジメトキシ-N,N-ジメチルメタンアミン（21.4 mg、0.180 mmol）を添加し、50℃で2時間攪拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮して、3-シクロプロピル-N-〔2-〔（E）-ジメチルアミノメチレンアミノ〕-1-メチル-2-オキソ-エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（50 mg、粗重量）を茶色の液体として得た。粗化合物を、さらなる精製を行うことなく次のステップにおいて用いた。

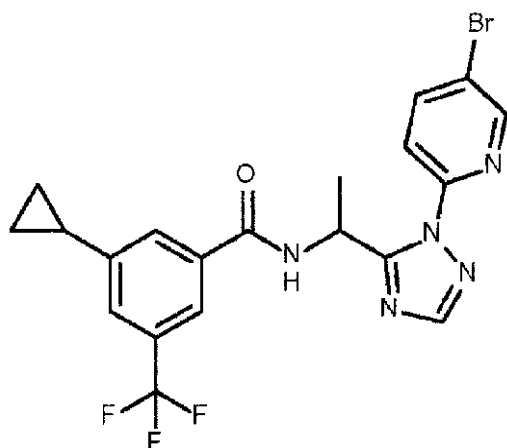
10

【0 3 3 3】

ステップC：N-〔1-〔2-（5-ブロモ-2-ピリジル）-1,2,4-トリアゾール-3-イル〕エチル〕-3-シクロプロピル-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（化合物P74）の調製

20

【化 1 3 4】



30

(化合物P74)

3-シクロプロピル-N-〔2-〔（E）-ジメチルアミノメチレンアミノ〕-1-メチル-2-オキソ-エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（300 mg、0.760 mmol）の1,4-ジオキサン（5 mL）中の攪拌溶液に（5-ブロモ-2-ピリジル）ヒドラジン（214 mg、1.14 mmol）及びAcOH（3 mL）を添加し、得られた混合物を90℃で2時間攪拌した。この反応混合物を室温に冷却し、水（30 mL）で希釈し、ジクロロメタン（2×150 mL）で抽出した。組み合わせた有機層を塩水（30 mL）で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗材料をヘシリカゲルによるカラムクロマトグラフィにより精製して、N-〔1-〔2-（5-ブロモ-2-ピリジル）-1,2,4-トリアゾール-3-イル〕エチル〕-3-シクロプロピル-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミドとした。

40

¹H-NMR（400 MHz, DMSO-d₆, ppm）：δ 9.20（d, J=6.8 Hz, 1H）, 8.68（d, J=2.4 Hz, 1H）, 8.30（dd, J=6.4 Hz, 1H）, 8.16（s, 1H）, 7.81（m, 2H）, 7.62（d, J=19.2 Hz, 2H）, 5.99-5.92（m, 1H）, 2.12-2.06（m, 1H）

50

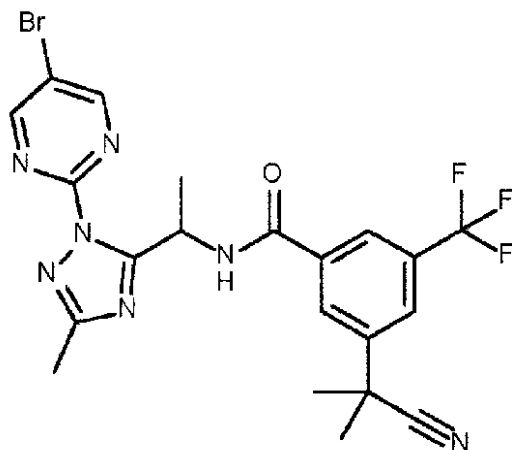
, 1.62 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.05–1.01 (m, 2H), 1.01–0.78 (m, 2H).

LC-MS (方法4): Rt 5.24分間、 $m/z = 482$ (M+H+).

【0334】

実施例12: N-[1-[2-(5-ブロモピリミジン-2-イル)-5-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (化合物P77) の調製

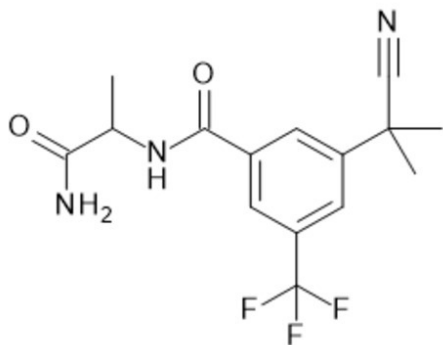
【化135】



(化合物P77)

ステップA: N-(2-アミノ-1-メチル-2-オキソ-エチル)-3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの調製

【化136】



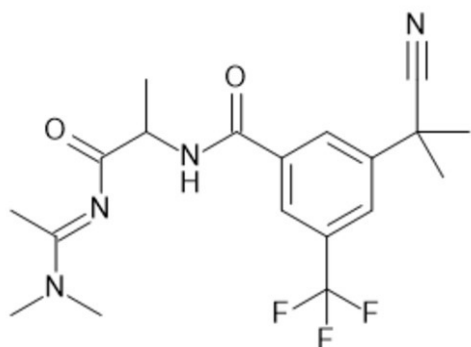
0℃で、2-アミノプロパンアミド (500mg、5.11mmol) のDMF (25mL) 中の攪拌溶液に3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸 (1.32g、5.13mmol)、DIPEA (2.7mL、15.3mmol)、続いてEDC・HCl (1.95g、10.2mmol)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (1.38g、10.2mmol) を添加し、反応混合物を室温で2時間攪拌した。この反応混合物をH₂O (50mL) で希釈し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液 (100mL) で洗浄し、EtOAc (2×70mL) で抽出した。組み合わせた有機層を塩水 (100mL) で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗混合物をシリカゲルによるカラムクロマトグラフィにより精製して、N-(2-アミノ-1-メチル-2-オキソ-エチル)-3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドを得た。

¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆, ppm): δ 8.90 (d, $J = 7.6$ Hz, 1H), 8.29 (d, $J = 16.8$ Hz, 2H), 7.99 (s, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.03 (s, 1H), 4.47–4.43 (t, 1H), 1.78 (s, 6H), 1.35 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H).

【0335】

ステップB：3-（1-シアノ-1-メチル-エチル）-N-〔2-〔（E）-1-（ジメチルアミノ）エチリデンアミノ〕-1-メチル-2-オキソ-エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミドの調製

【化137】



10

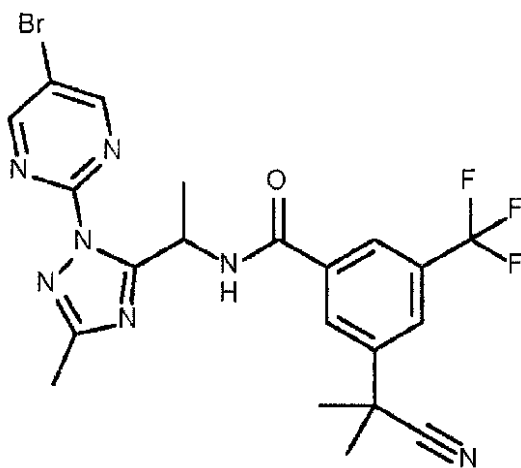
N-（2-アミノ-1-メチル-2-オキソ-エチル）-3-（1-シアノ-1-メチル-エチル）-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（500mg、1.45mmol）のジクロロメタン（20mL）中の攪拌溶液にN,N-ジメチルアセタミドジメチルアセタール（0.319mL、2.18mmol）を添加し、反応混合物を50℃で1時間攪拌した。この反応混合物を減圧下で濃縮して、3-（1-シアノ-1-メチル-エチル）-N-〔2-〔（E）-1-（ジメチルアミノ）エチリデンアミノ〕-1-メチル-2-オキソ-エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミドを無色の液体として得た。粗化合物を、さらなる精製を行うことなく次のステップにおいて用いた。

20

【0336】

ステップC：N-〔1-〔2-（5-ブロモピリミジン-2-イル）-5-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル〕エチル〕-3-（1-シアノ-1-メチル-エチル）-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（化合物P77）の調製

【化138】



30

(化合物P77)

40

3-（1-シアノ-1-メチル-エチル）-N-〔2-〔（E）-1-（ジメチルアミノ）エチリデンアミノ〕-1-メチル-2-オキソ-エチル〕-5-（トリフルオロメチル）ベンズアミド（250mg、0.568mmol）の1,4-ジオキサン（5mL）及びAcOH（5mL）中の攪拌溶液に（5-ブロモピリミジン-2-イル）ヒドラジン（161mg、0.851mmol）を添加し、得られた混合物を80℃で2時間攪拌した。この反応混合物を室温に到達させ、H₂O（50mL）で希釈し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液（100mL）で洗浄し、EtOAc酢酸エチル（2×70mL）で抽出した。組み合わせた有機層を塩水（100mL）で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、減圧下で

50

濃縮した。粗残渣をシリカゲルによるカラムクロマトグラフィにより精製して、N- [1- [2- (5-プロモピリミジン-2-イル)-5-メチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル] エチル]-3- (1-シアノ-1-メチル-エチル)-5- (トリフルオロメチル) ベンズアミドを白色の固体として得た。

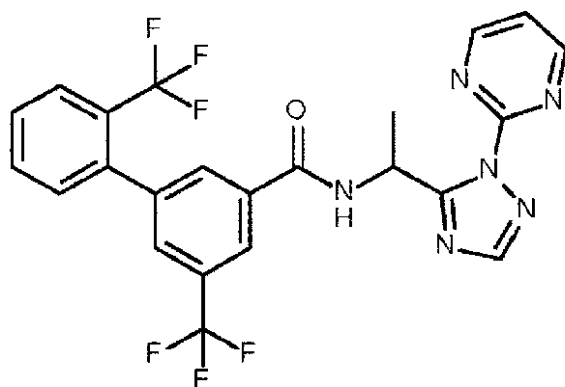
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , ppm): δ 9.40 (d, $J=7.2$ Hz, 1H), 9.13 (s, 2H), 8.17 (d, $J=22.0$ Hz, 2H), 7.98 (s, 1H), 6.0-5.96 (t, 1H), 2.33 (s, 3H), 1.75 (s, 6H), 1.63 (d, $J=6.8$ Hz, 3H).

LC-MS (方法4): Rt 4.78 分間、 $m/z = 522$ (M+H+).

【0337】

実施例13: N- [1- (2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル) エチル]-3- (トリフルオロメチル)-5- [2- (トリフルオロメチル) フェニル] ベンズアミド (化合物P69) の調製

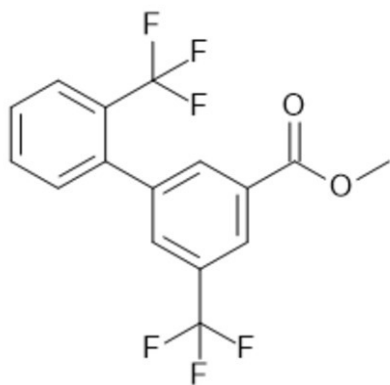
【化139】



(化合物P69)

ステップA: 3- (トリフルオロメチル)-5- [2- (トリフルオロメチル) フェニル] 安息香酸メチルの調製

【化140】



丸底フラスコ中において、メチル-3-ヨード-5- (トリフルオロメチル) 安息香酸塩 (0.400 g、1.15 mmol) をテトラヒドロフラン (9.21 mL) 中に溶解し、2- (トリフルオロメチル) フェニル硼酸 (0.338 g、1.73 mmol) 及び炭酸カリウム (1.4 mL、2.0 mmol/L) を添加した。得られた混合物をアルゴン雰囲気下で5分間脱気し、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) (0.0672 g、0.058 mmol) を添加し、その後、バイアルをシールした。反応物を80℃で18時間加熱した。混合物を酢酸エチルで希釈し、ろ紙でろ過し、水で希釈し、酢酸エチル (2×20 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3- (トリフルオロメチル)-5- [2- (トリフルオロメチル) フェニル] 安息香

酸メチルを得た。

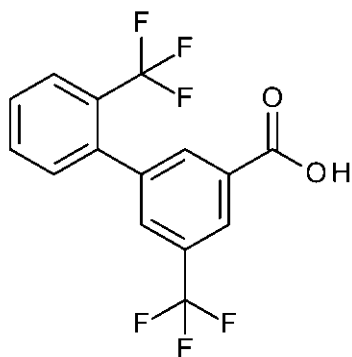
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ 8.4 (s, 1H) 8.2 (s, 1H) 7.8–7.9 (m, 2H) 7.6–7.7 (m, 1H) 7.6 (d, $J=7.7$ Hz, 1H) 7.3–7.4 (m, 1H) 4.0 (s, 3H)

GCMS (方法3): Rt 3.30分間、 $m/z=349$ (M+H)。

【0338】

ステップB: 3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]安息香酸(I39)の調製

【化141】



(I39)

3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]安息香酸を、3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]安息香酸塩及び化合物P60(ステップB)に記載の条件を用いて調製した。

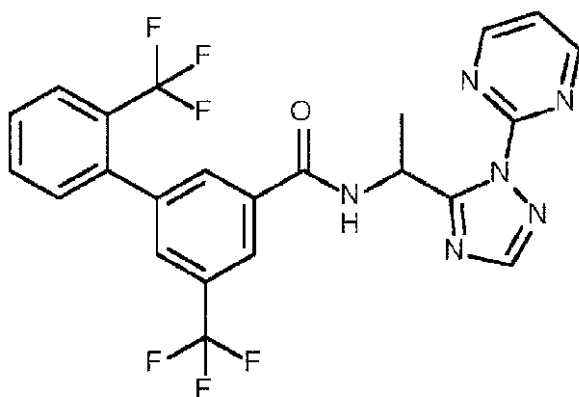
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$, ppm) δ 7.53–7.57 (m, 1H) 7.68–7.74 (m, 1H) 7.77–7.84 (m, 1H) 7.89–7.93 (m, 1H) 7.95–7.99 (m, 1H) 8.11–8.14 (m, 1H) 8.24–8.27 (m, 1H) 13.71 (br s, 1H).

LC-MS (方法1): Rt 1.09分間、 $m/z=333$ (M-H)。

【0339】

ステップC: N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド(化合物P69)の調製

【化142】



(化合物P69)

化合物P69を、3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]安息香酸及び化合物P24(ステップC)に記載の条件を用いて調製した。

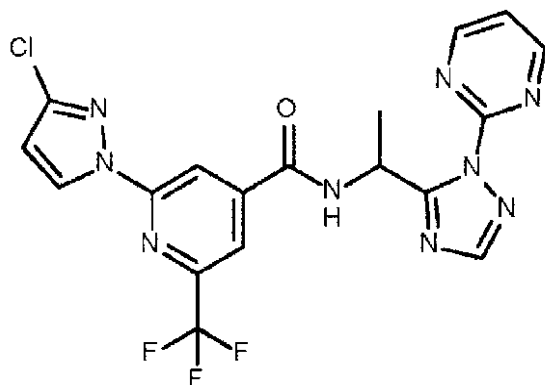
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ 1.73 (d, $J=6.60$ Hz, 3H) 6.43–6.53 (m, 1H) 7.35–7.39 (m, 1H) 7.40–7.44 (m, 1H) 7.47–7.54 (m, 1H) 7.52 (br d, $J=8.07$

H z, 1 H) 7.55–7.61 (m, 1 H) 7.62–7.68 (m, 1 H) 7.77 (s, 1 H) 7.82 (d, J = 7.34 Hz, 1 H) 7.97 (s, 1 H) 8.05–8.08 (m, 1 H) 8.15 (s, 1 H) 8.94 (d, J = 4.77 Hz, 2 H). LC-MS (方法1): Rt 1.07 分間、m/z = 507 (M+H+).

【0340】

実施例14: 2-(3-クロロピラゾール-1-イル)-N-[1-(2-ピリジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド (化合物P70) の調製

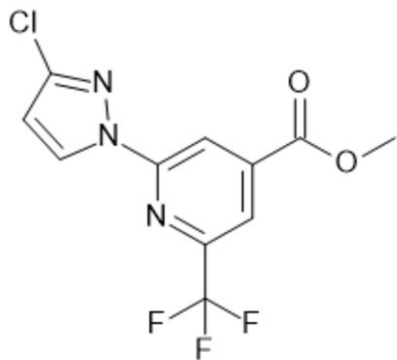
【化143】



(化合物P70)

ステップA: メチル 2-(3-クロロピラゾール-1-イル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートの調製

【化144】



メチル-2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート (143 mg, 0.59 mmol) を 1,4-ジオキサン (6 mL) 中に溶解し、得られた溶液をアルゴンで 10 分間フラッシュした。次いで、3-クロロ-1H-ピラゾール (77 mg, 0.72 mmol)、リン酸カリウム (191 mg, 0.90 mmol) 及び [tBuXPhosPd (アリル)] OTf (44 mg, 0.06 mmol) を添加し、反応物を 80 °C で 18 時間攪拌した。混合物を水で希釈し、水性層を酢酸エチル (2×) で抽出した。有機層を組み合わせ、Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。粗残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィ (シクロヘキサン+0~20% 酢酸エチル) により精製して、メチル 2-(3-クロロピラゾール-1-イル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートを得た。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ 8.7 (s, 1 H) 8.6 (d, J = 2.57 Hz, 1 H) 8.1 (d, J = 1.10 Hz, 1 H) 6.5 (d, J = 2.57 Hz, 1 H) 4.1 (s, 3 H)

LC-MS (方法1): Rt 1.14 分間、m/z = 306 (M+H+).

【0341】

10

20

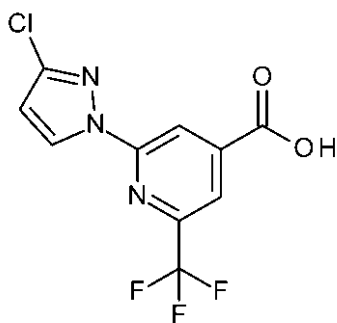
30

40

50

ステップ B：2-（3-クロロピラゾール-1-イル）-6-（トリフルオロメチル）ピリジン-4-カルボン酸（I 40）の調製

【化 1 4 5】



(I40)

10

2-（3-クロロピラゾール-1-イル）-6-（トリフルオロメチル）ピリジン-4-カルボン酸を、メチル 2-（3-クロロピラゾール-1-イル）-6-（トリフルオロメチル）ピリジン-4-カルボキシレート及び化合物 P 60（ステップ B）に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ （400 MHz，DMSO- d_6 ，ppm） δ 13.9-15.0（m，1H）8.7（d， $J=2.57\text{ Hz}$ ，1H）8.4（s，1H）8.1（d， $J=1.10\text{ Hz}$ ，1H）6.8（d， $J=2.57\text{ Hz}$ ，1H）

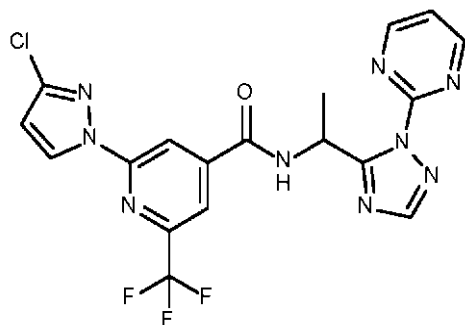
LC-MS（方法 1）：Rt 0.96 分間、 $m/z=292$ （ $M+H^+$ ）。

20

【0 3 4 2】

ステップ C：2-（3-クロロピラゾール-1-イル）-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1，2，4-トリアゾール-3-イル）エチル〕-6-（トリフルオロメチル）ピリジン-4-カルボキサミド（化合物 P 70）の調製

【化 1 4 6】



(化合物P70)

30

化合物 P 70 を、2-（3-クロロピラゾール-1-イル）-6-（トリフルオロメチル）ピリジン-4-カルボン酸及び化合物 P 24（ステップ C）に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ （400 MHz，CDCl $_3$ ，ppm） δ 1.75（d， $J=6.6\text{ Hz}$ ，3H）6.43-6.53（m，2H）7.46（t， $J=4.8\text{ Hz}$ ，1H）7.86-7.93（m，1H）8.02（d， $J=1.1\text{ Hz}$ ，1H）8.09（s，1H）8.45（d， $J=0.7\text{ Hz}$ ，1H）8.60（d， $J=2.9\text{ Hz}$ ，1H）8.90-9.07（m，2H）

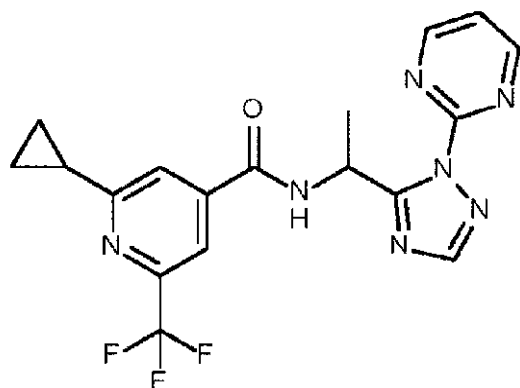
40

LC-MS（方法 1）：Rt 0.97 分間、 $m/z=464$ （ $M+H^+$ ）。

【0 3 4 3】

実施例 15：2-シクロプロピル-N-〔1-（2-ピリミジン-2-イル-1，2，4-トリアゾール-3-イル）エチル〕-6-（トリフルオロメチル）ピリジン-4-カルボキサミド（化合物 P 54）の調製

【化 1 4 7】

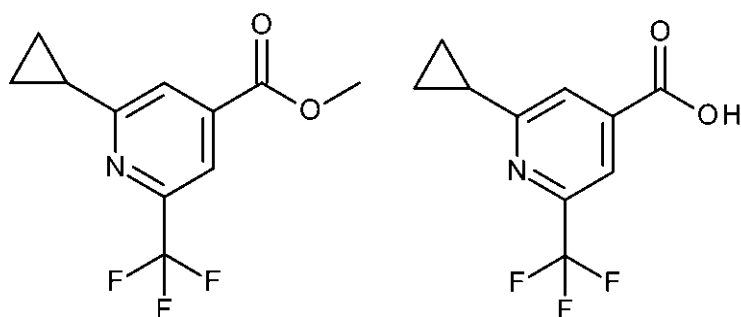


10

(化合物P54)

ステップA：メチル 2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート及び2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸 (I 29) の調製

【化 1 4 8】



20

(I29)

シクロプロピルボン酸 (1.43 g、16.7 mmol、2.00 当量) 及び炭酸水素ナトリウム (2.10 g、25.1 mmol) を、メチル 2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート (2.00 g、8.35 mmol) の 1, 4-ジオキサン (20.9 mL) 及び水 (8.35 mL) 中の溶液に添加し、得られた懸濁液をアルゴンで 10 分間フラッシュした。[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム (II) (0.322 g、0.417 mmol) を添加し、得られた懸濁液を、100℃で 1 時間、アルゴン雰囲気下で攪拌した。室温まで冷却させた後、反応混合物を水で失活させ、酢酸エチルで抽出した (2×)。組み合わせた有機相を Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて第 1 の粗材料を得たところ、これは、シリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (シクロヘキサン中の酢酸エチル) による精製後、所望のメチル 2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートをもたらした。

30

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 1.04–1.23 (m, 4H), 2.14–2.28 (m, 1H), 4.00 (s, 3H), 7.88 (s, 1H), 7.95 (d, J = 1.47 Hz, 1H).

40

LC-MS (方法 1): Rt 1.12 分間、m/z 246 [M+H⁺].

【0 3 4 4】

pH 1 に酸性化した後、水性層を酢酸エチルで再度抽出し (2×)、組み合わせた有機相を Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、蒸発させて第 2 の粗材料を得たところ、これは、シリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (ジクロロメタン中のメタノール) による精製で 2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸をもたらした。

¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆, ppm) δ: 0.94–1.03 (m,

50

2 H), 1.06–1.15 (m, 2 H), 2.37–2.46 (m, 1 H), 7.88 (d, $J=1.10$ Hz, 1 H), 8.05 (d, $J=0.73$ Hz, 1 H), 13.89–14.33 (m, 1 H).

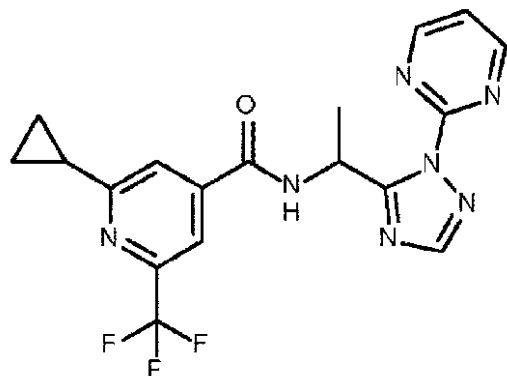
LC-MS (方法1): Rt 0.94 分間、 m/z 232 $[M+H]^+$ 。

【0345】

ステップB: 2-シクロプロピル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド (化合物P54) の調製

【化149】

10



(化合物P54)

20

化合物P54を、2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸及び化合物P24 (ステップC) に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 8.9 (d, $J=5.13$ Hz, 2 H) 8.1 (s, 1 H) 7.7–7.8 (m, 3 H) 7.4 (t, $J=4.95$ Hz, 1 H) 6.4–6.6 (m, 1 H) 2.1–2.2 (m, 1 H) 1.7 (d, $J=6.60$ Hz, 3 H) 1.2–1.3 (m, 3 H) 1.1–1.2 (m, 4 H)。

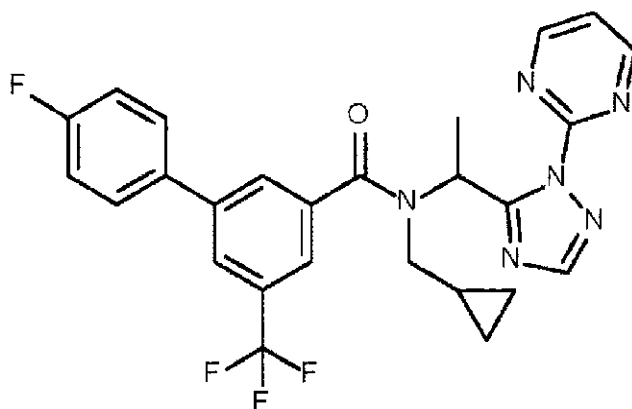
LC-MS (方法1): Rt 0.92 分間、 $m/z=404$ ($M+H$)。

【0346】

実施例16: N-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (化合物P36) の調製

【化150】

30

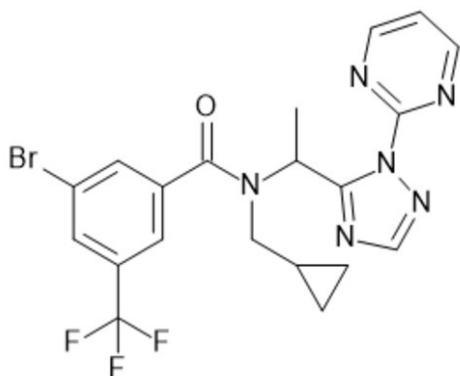


(化合物P36)

40

ステップA: 3-ブロモ-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドの調製

【化 1 5 1】



10

中間体 3-ブromo-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドを、3-ブromo-5-(トリフルオロメチル)安息香酸及び化合物 P 4 9 (ステップ C) に記載の条件を用いて調製した。

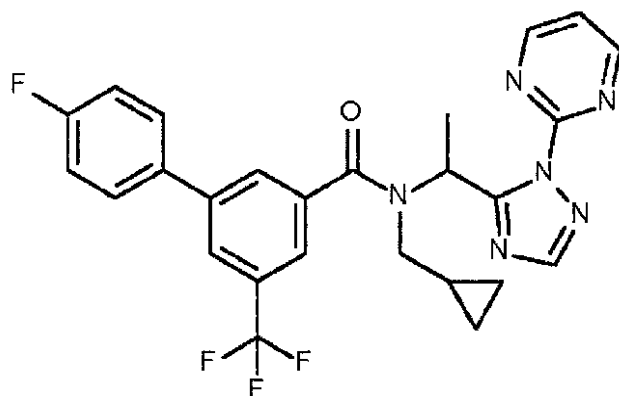
LC-MS (方法 1) : Rt 1.01 分間、m/z = 495 / 497 (M+H+)。

【0 3 4 7】

ステップ B : N-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (化合物 P 3 6) の調製

20

【化 1 5 2】



30

(化合物 P36)

3-ブromo-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (100 mg、0.202 mmol)、(4-フルオロフェニル)ボロン酸 (34 mg、0.242 mmol) 及び Na₂CO₃ (0.15 ml、0.75 mL / mmol) を、アルゴン雰囲気下で、ジオキサン中に添加し、次いでテトラキス(ホスファニル)パラジウム (2.5 mg、0.01 mmol) を添加し、混合物をアルゴンで 5 分間脱気し、その後、バイアルを閉じた。この反応混合物を 100 °C で 4 時間攪拌した。懸濁液を Celite (登録商標) でろ過し、酢酸エチルで希釈し、有機相を蒸発させて黄色の油を得、これを逆相クロマトグラフィにより精製して、N-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドを得た。

40

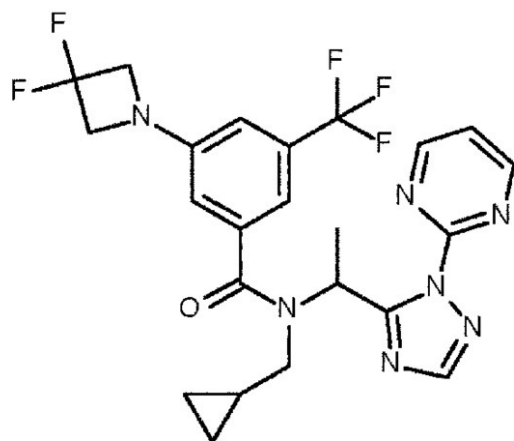
LC-MS (方法 1) : Rt 1.07 分間、m/z = 511 (M+H+)。

【0 3 4 8】

実施例 17 : N-(シクロプロピルメチル)-3-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (化合物 P 2 0) の調製

50

【化 1 5 3】



(化合物P20)

10

バイアルに 3-ブromo-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (0.100 g、0.202 mmol)、3,3-ジフルオロアゼチジン; ヒドロクロリド (0.0314 g、0.242 mmol)、ナトリウム tert-ブトキシド (0.0588 g、0.606 mmol)、トルエン (0.606 ml) 及び t Bu X Phos Pd G3 (0.0160 g、0.0202 mmol) を仕込んだ。この反応混合物をアルゴンで 5 分間フラッシュし、次いで 40 °C に 3 時間加熱した。次いで、懸濁液を Celite (登録商標) パッドでろ過した。ろ液を酢酸エチルで希釈し、濃縮した。粗材料をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、N-(シクロプロピルメチル)-3-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミドを黄色の油として得た。

20

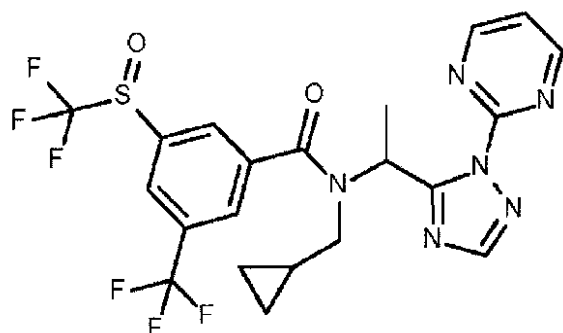
LC-MS (方法 1) : R_t 1.01、 m/z = 507 ($M+H^+$)。

【0349】

実施例 18 : N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルフィニル)ベンズアミド (化合物 P26) の調製

30

【化 1 5 4】

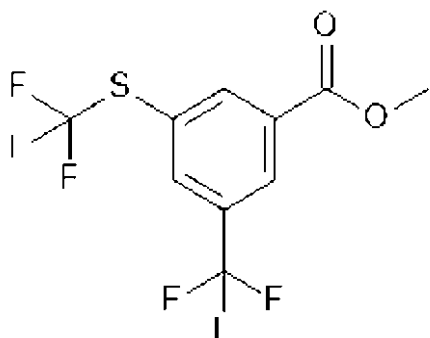


(化合物P26)

40

ステップ A : 3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)安息香酸メチルの調製

【化 1 5 5】



10

(2, 2'-ビピリジン) (トリフルオロメタンチオラート) 銅 (CAS 1413732-47-4) (3.9 g、12 mmol) を、3-ヨード-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル (2.0 g、6.1 mmol) のアセトニトリル (18 mL) 中の溶液にアルゴン雰囲気下で添加した。この反応混合物を 90 °C に加熱し、一晩攪拌した。室温まで冷却させた後、反応混合物を Celite (登録商標) パッドでろ過し、濃縮した。粗材料をシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (シクロヘキサン中の酢酸エチル) により 2 回精製して、所望の生成物を黄色のガムとして得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 4.02 (s, 3H), 8.11 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.53 (s, 1H).

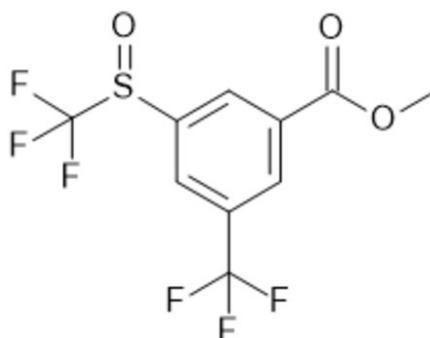
20

LC-MS (方法 1): R_t 1.21、 m/z = 279 ($M+H^+$)。

【0350】

ステップ B: 3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルフィニル)安息香酸メチルの調製

【化 1 5 6】



30

3-クロロ過安息香酸 (3.6 g、17 mmol) を、3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)安息香酸メチルのジクロロメタン (25 mL) 中の溶液に添加した。室温で 3 時間攪拌した後、3-クロロ過安息香酸 (3.6 g、17 mmol) をさらに添加し、反応混合物を一晩攪拌した。3-クロロ過安息香酸 (3.6 g、17 mmol) を添加し、反応混合物を再度、一晩攪拌した。形成した沈殿物をろ過した。ろ液をチオ硫酸ナトリウムの 10 % 水溶液及び NaHCO_3 飽和溶液で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルフィニル)安息香酸メチルを得た。

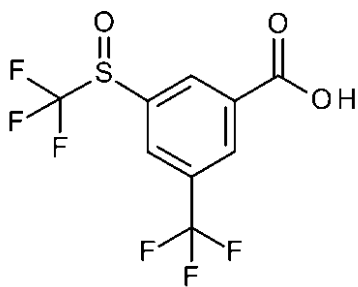
40

LC-MS (方法 1): R_t 1.05、 m/z = 321 ($M+H^+$)。

【0351】

ステップ C: 3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルフィニル)安息香酸 (I 7) の調製

【化 1 5 7】



(17)

10

3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルフィニル)安息香酸メチル(0.900 g、2.81 mmol、1当量)をフラスコ中に仕込み、テトラヒドロフラン(8.43 mL)及び水(5.62 mL)中に溶解した。この混合物に水酸化リチウム(0.135 g、5.62 mmol、2当量)を添加し、反応物を室温で2時間攪拌した。この反応混合物を1 Mの塩酸で酸性化し、水性相を酢酸エチル(2×)で抽出した。組み合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、次いで濃縮して、3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルフィニル)安息香酸を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : 8.47 (s, 1H) 8.51 (s, 1H) 8.64 (s, 1H) 14.06 (br s, 1H)

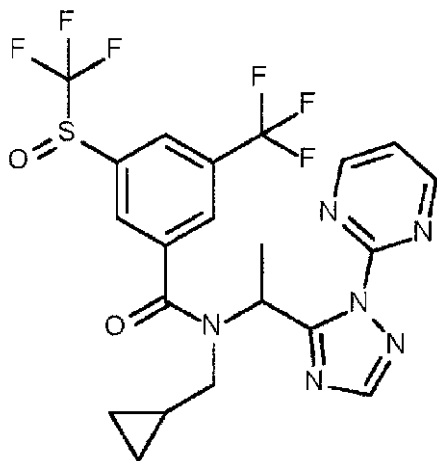
$^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : -73.46 (s, 3 F) -61.49 (s, 3 F)

LC-MS (方法1): R_t 0.89、 m/z = 307 ($M+H^+$)。

【0352】

ステップD: N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルフィニル)ベンズアミド(化合物P26)の調製

【化 1 5 8】



(化合物P26)

30

40

所望の生成物を、3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルフィニル)安息香酸及び化合物P2(ステップE)に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ (600 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : -0.21--0.10 (m, 1H) -0.10-0.00 (m, 1H) 0.30-0.38 (m, 2H) 0.70-0.79 (m, 1H) 1.80 (dd, J = 6.90, 1.27 Hz, 3H) 3.07-3.18 (m, 1H) 3.18-3.30 (m, 1H) 6.26 (quin, J = 7.04 Hz, 1H) 7.60 (td, J = 4.86, 1.91 Hz, 1H) 7.81 (s, 1H) 7.93 (br d, J = 4.54 Hz, 1H) 8.15 (d, J = 2.18 Hz, 1H) 8.22 (br d, J = 5.45 Hz, 1H) 8.88 (d, J = 5.08 Hz, 1H)

50

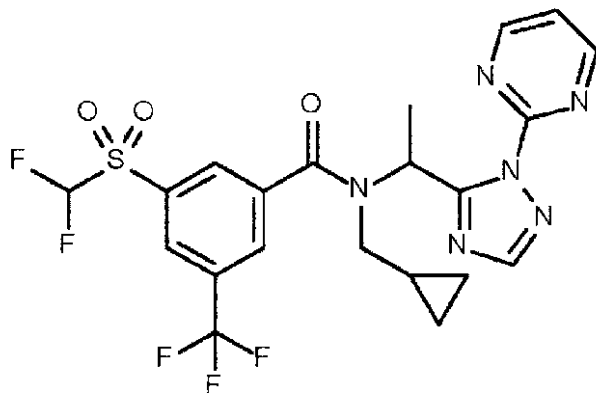
z, 2 H)

LC-MS (方法1) : R_t 0.98、 m/z = 533 ($M+H^+$)。

【0353】

実施例19 : N-(シクロプロピルメチル)-3-(ジフルオロメチルスルホニル)-N-[1-(2-ピリジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (化合物P30) の調製

【化159】



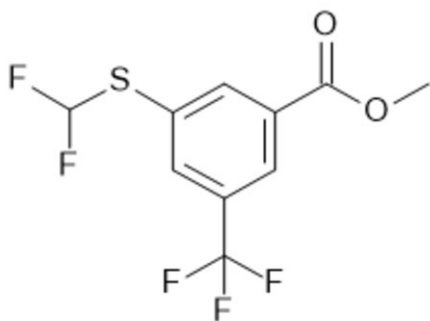
10

(化合物P30)

ステップA : 3-(ジフルオロメチルスルファニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルの調製

20

【化160】



30

3-スルファニル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル (0.540 g、2.29 mmol) のN,N-ジメチルホルムアミド (11.4 mL) 中の溶液にアルゴン雰囲気下で炭酸カリウム (0.479 g、3.43 mmol) 及びクロロジフルオロ酢酸ナトリウム (0.704 g、4.57 mmol) を添加した。反応混合物を95℃に3時間加熱した。次いで、混合物を水で希釈し、水性相を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機相を水及び塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、次いで濃縮して、3-(ジフルオロメチルスルファニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルをオレンジ色の固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 3.99 (s, 3H) 6.90 (t, 1H) 8.02 (s, 1H) 8.36 (s, 1H) 8.43 (s, 1H)

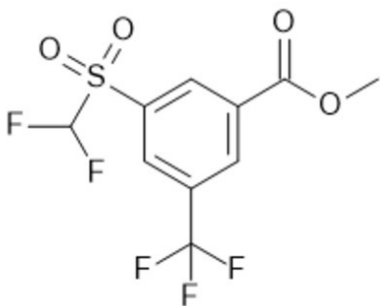
40

$^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : -91.49 (s, 2 F) -62.91 (s, 3 F)

【0354】

ステップB : 3-(ジフルオロメチルスルホニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルの調製

【化 1 6 1】



10

3-(ジフルオロメチルスルファニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル (0.540 g、1.89 mmol) の四塩化炭素 (0.943 ml)、アセトニトリル (0.943 ml) 及び水 (2.36 ml) 中の溶液に過ヨウ素酸ナトリウム (1.87 g、8.68 mmol) 及び塩化ルテニウム (III) 水和物 (0.0106 g、0.0472 mmol) を添加した。この反応混合物を室温で30分間攪拌した。混合物を水で希釈し、ジクロロメタンで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-(ジフルオロメチルスルホニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルを白色の固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 4.06 (s, 3H) 6.31 (t, 1H) 8.43 (s, 1H) 8.72 (s, 1H) 8.83 (s, 1H) 20

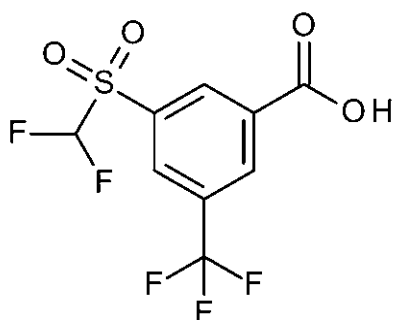
$^{19}\text{F-NMR}$ (376 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : -120.50 (s, 2 F) -62.93 (s, 3 F)

LC-MS (方法1): R_t 1.54、 m/z = 219 ($\text{M}+\text{H}^+$)。

【0355】

ステップC: 3-(ジフルオロメチルスルホニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸 (I11) の調製

【化 1 6 2】



(I11)

30

3-(ジフルオロメチルスルホニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル (0.280 g、0.880 mmol、1.0 当量) をフラスコ中に仕込み、テトラヒドロフラン (2.64 mL) 及び水 (1.76 mL) 中に溶解した。この混合物に0℃で水酸化リチウム (0.0421 g、1.76 mmol、2 当量) を数回に分けて添加し、反応物を、0℃で10分間、次いで室温で0.5時間攪拌した。この反応混合物を1Mの塩酸で酸性化し、水性相を酢酸エチル (3×) で抽出した。組み合わせた有機相を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、次いで濃縮して、3-(ジフルオロメチルスルホニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸を白色の固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO-d_6 , ppm) δ : 7.50 (t, 1H) 8.48 (s, 1H) 8.59-8.73 (m, 2H) 14.28 (br s, 1H) 40

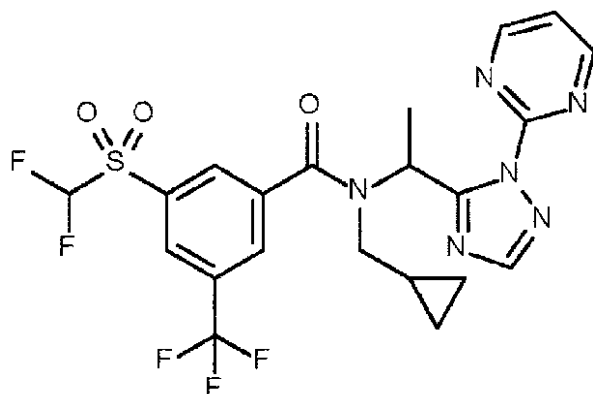
$^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, DMSO-d_6 , ppm) δ : -124.39 (s, 2 F) -61.54 (s, 3 F) 50

LC-MS (方法1) : R_t 1.20、 $m/z = 303$ ($M-H^+$)。

【0356】

ステップD : N-(シクロプロピルメチル)-3-(ジフルオロメチルスルホニル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (化合物P30) の調製

【化163】



(化合物P30)

10

所望の生成物を、3-(ジフルオロメチルスルホニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸及び化合物P2 (ステップE) に記載の条件を用いて調製した。

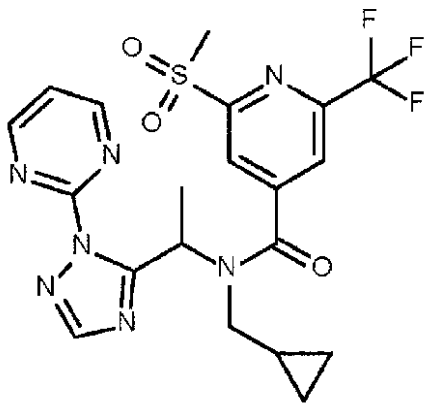
20

LC-MS (方法1) : R_t 1.48、 $m/z = 531$ ($M+H^+$)。

【0357】

実施例20 : N-(シクロプロピルメチル)-2-メチルスルホニル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド (化合物P53) の調製

【化164】



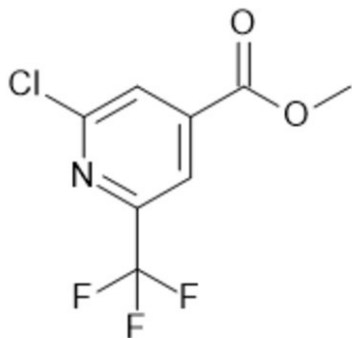
(化合物P53)

30

40

ステップA : メチル2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート の調製

【化 1 6 5】



10

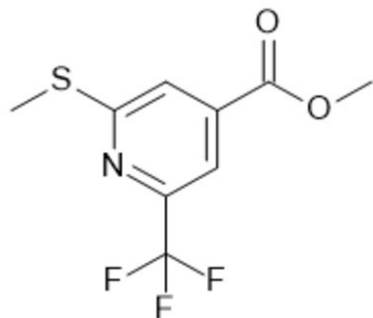
2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸 (20 g、88.7 mmol) のメタノール (266 mL) 中の溶液に室温で硫酸 (4.92 mL、88.7 mmol) を滴下した。添加後、反応混合物を 65℃ に加熱し、一晚攪拌した。この反応混合物を室温に冷却し、飽和 NaHCO₃ 水溶液 (250 mL) に注ぎ入れ、15 分間攪拌し、ジクロロメタン (3×) で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。次いで、残渣をジクロロメタン中に溶解し、Celite (登録商標) でろ過し、減圧下で濃縮してメチル 2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートを得た。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 4.04 (s, 3H) 8.11 (s, 1H) 8.17 (d, J = 1.10 Hz, 1H) 20

【0 3 5 8】

ステップ B: メチル 2-メチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートの調製

【化 1 6 6】



30

メチル 2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート (0.130 g、0.543 mmol) の N, N-ジメチルホルムアミド (2.71 mL) 中の溶液にアルゴン雰囲気下でナトリウムチオメトキシド (0.0423 g、0.543 mmol) を添加した。室温で 1 時間後、反応混合物を酢酸エチル及び水で希釈した。水性相を酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮してメチル 2-メチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートを得た。

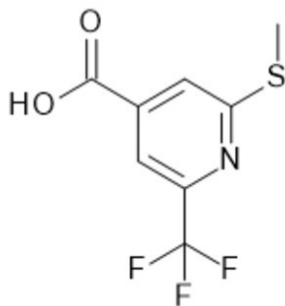
40

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 2.65 (s, 3H) 4.00 (s, 3H) 7.86 (d, J = 1.10 Hz, 1H) 7.91–7.95 (m, 1H) LC-MS (方法 1): R_t 1.09、m/z = 252 (M+H⁺)。

【0 3 5 9】

ステップ C: 2-メチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸の調製

【化 1 6 7】



10

所望の生成物を、2-メチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート及び化合物 P 2 6 (ステップ C) に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : 2.60 (s, 3H) 7.81 (d, $J=1.10$ Hz, 1H) 7.96 (s, 1H) 14.18 (br s, 1H)

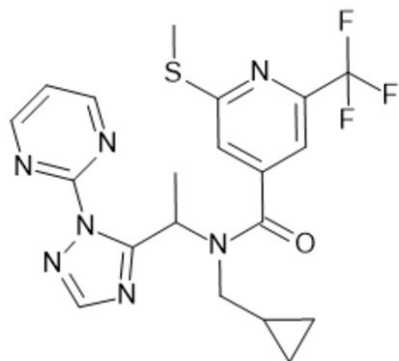
LC-MS (方法 1): R_t 0.89、 $m/z = 238$ ($M+H^+$)。

【0 3 6 0】

ステップ D: N-(シクロプロピルメチル)-2-メチルスルファニル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミドの調製

20

【化 1 6 8】



30

所望の生成物を、2-メチルスルファニル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸及び化合物 P 2 (ステップ E) に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ (600 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : -0.07-0.09 (m, 2H) 0.39 (ddt, $J=12.92, 8.65, 4.47, 4.47$ Hz, 2H) 0.78-0.86 (m, 1H) 1.77 (d, $J=6.90$ Hz, 3H) 2.57 (s, 3H) 3.13-3.35 (m, 2H) 6.15-6.25 (m, 1H) 7.19 (s, 1H) 7.26 (s, 1H) 7.61 (s, 1H) 8.15 (s, 1H) 8.88 (d, $J=4.90$ Hz, 2H)

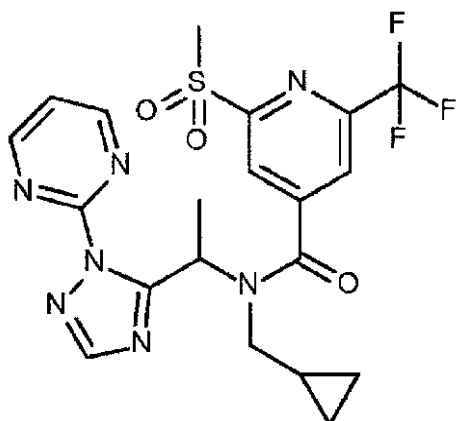
LC-MS (方法 1): R_t 1.00、 $m/z = 464$ ($M+H^+$)。

40

【0 3 6 1】

ステップ E: N-(シクロプロピルメチル)-2-メチルスルホニル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド (化合物 P 5 3) の調製

【化 1 6 9】



(化合物P53)

10

20

30

N-(シクロプロピルメチル)-2-メチルスルファニル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド (0.050 g、0.11 mmol) のジクロロメタン (2.2 ml) 中の溶液に 0℃ でアルゴン雰囲気下において 3-クロロ過安息香酸 (0.051 g、0.23 mmol) を添加した。この反応混合物を 2 時間攪拌し、次いで飽和チオ硫酸ナトリウム溶液及び 1 M 水酸化ナトリウムで失活させた。混合物を 30 分間攪拌し、次いで水性層をジクロロメタンで 3 回抽出した。組み合わせた有機層を 1 M 水酸化ナトリウムで洗浄し (2×)、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して N-(シクロプロピルメチル)-2-メチルスルホニル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミドを得た。

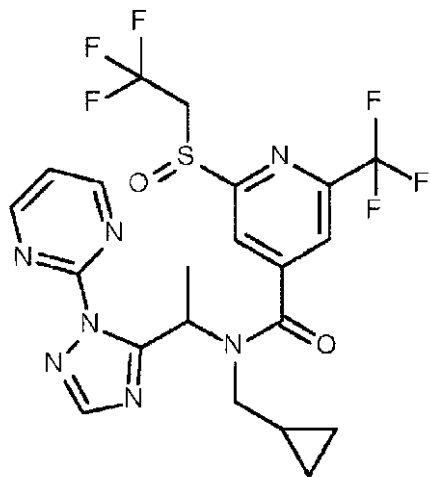
$^1\text{H-NMR}$ (600 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : -0.11-0.07 (m, 2H) 0.39 (ddt, $J=12.97, 8.65, 4.45, 4.45$ Hz, 2H) 0.76-0.86 (m, 1H) 1.80 (d, $J=6.90$ Hz, 3H) 3.18 (br s, 2H) 3.34 (s, 3H) 6.15-6.27 (m, 1H) 7.62 (s, 1H) 7.96 (s, 1H) 8.01-8.05 (m, 1H) 8.14-8.17 (m, 1H) 8.87-8.94 (m, 2H)

LC-MS (方法 1): R_t 0.85、 $m/z = 496$ ($M+H^+$)。

【0362】

実施例 21: N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド (化合物 P57) の調製

【化 1 7 0】

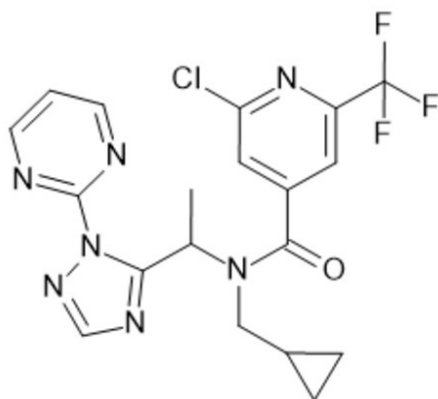


(化合物P57)

10

ステップA：2-クロロ-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミドの調製

【化 1 7 1】



20

30

所望の生成物を、2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸及び化合物P2(ステップE)に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ (600 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : -0.17-0.13 (m, 2H) 0.39 (ddd, $J=17.98, 9.08, 4.54$ Hz, 2H) 0.74-0.92 (m, 1H) 1.78 (d, $J=7.08$ Hz, 3H) 2.76-3.39 (m, 2H) 6.01-6.41 (m, 1H) 7.58 (s, 1H) 7.60 (s, 1H) 7.61-7.64 (m, 1H) 8.15 (s, 1H) 8.90 (d, $J=4.72$ Hz, 2H)

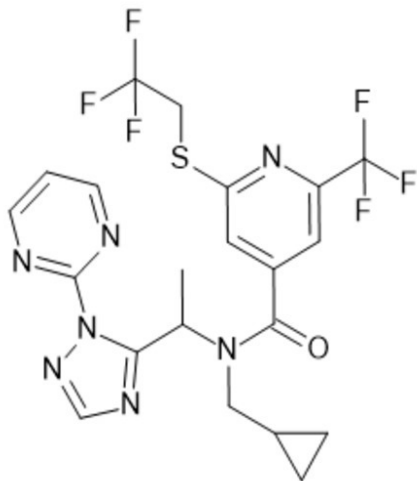
LC-MS (方法1): R_t 0.94、 $m/z = 452$ ($M+H^+$)。

【0 3 6 3】

40

ステップB：N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-2-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミドの調製

【化 1 7 2】



10

バイアルに 2-クロロ-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド (0.1 g、0.2213 mmol)、2, 2, 2-トリフルオロエタノール (0.03246 g、0.02487 mL、0.2656 mmol)、炭酸ナトリウム (0.06271 g、0.4537 mmol) 及び N, N-ジメチルホルムアミド (3 mL) を仕込んだ。この反応混合物をマイクロ波放射線下において室温で 1 時間撹拌した。この反応混合物を水で失活させ、水性層を酢酸エチル (3×) で抽出した。組み合わせた有機層を水 (5×) で洗浄し、次いで硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミドを得た。

20

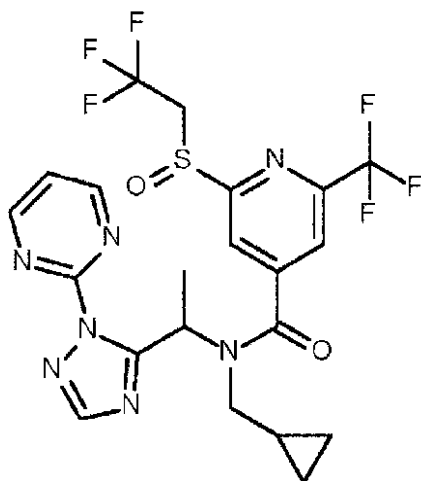
$^1\text{H-NMR}$ (600 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : -0.18-0.16 (m, 2H) 0.37 (ddd, $J=13.31, 8.95, 4.45$ Hz, 2H) 0.78 (br s, 1H) 1.76 (d, $J=6.90$ Hz, 3H) 3.09-3.37 (m, 2H) 4.21 (q, $J=10.17$ Hz, 2H) 6.20 (br d, $J=2.91$ Hz, 1H) 7.31 (s, 1H) 7.50 (s, 1H) 7.59 (t, $J=4.90$ Hz, 1H) 8.14 (s, 1H) 8.86 (br d, $J=4.72$ Hz, 2H)
LC-MS (方法 1): R_t 1.06、 $m/z = 532$ ($M+H^+$)。

30

【0364】

ステップ C: N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-2-(2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド (化合物 P 57) の調製

【化 1 7 3】



(化合物P57)

10

所望の生成物を、N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-2-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド及び化合物P26(ステップB)に記載の条件を用いて調製して、N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-2-(2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミドを得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (600 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : -0.20-0.12 (m, 2H) 0.21-0.52 (m, 2H) 0.77 (br s, 1H) 1.78 (d, $J=6.90$ Hz, 3H) 3.01-3.40 (m, 2H) 4.00-4.15 (m, 1H) 4.18-4.30 (m, 1H) 6.18 (br d, $J=1.09$ Hz, 1H) 7.60 (t, $J=4.81$ Hz, 1H) 7.76-7.85 (m, 1H) 7.95 (d, $J=13.62$ Hz, 1H) 8.14 (s, 1H) 8.89 (t, $J=4.18$ Hz, 2H)

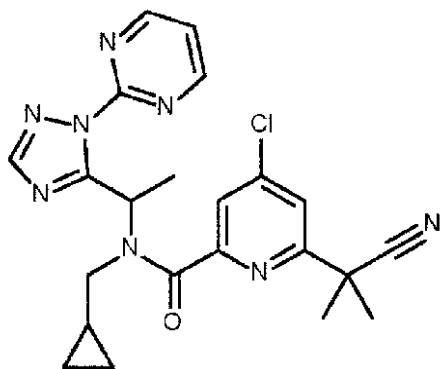
LC-MS (方法1): R_t 0.95、 $m/z=548$ ($M+H^+$)。

30

【0365】

実施例22: 4-クロロ-6-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]ピリジン-2-カルボキサミド(化合物P28)の調製

【化 1 7 4】

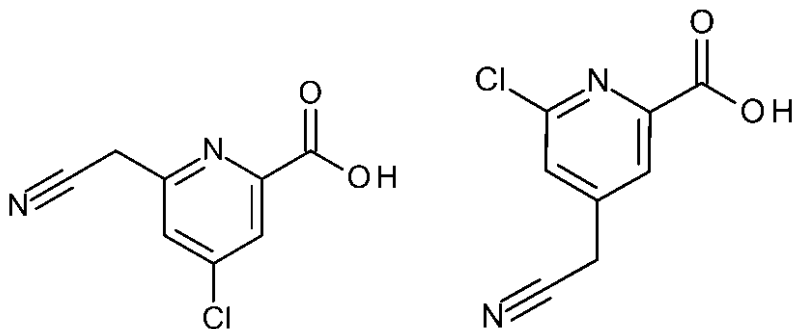


(化合物P28)

40

ステップA: 4-クロロ-6-(シアノメチル)ピリジン-2-カルボン酸及び6-クロロ-4-(シアノメチル)ピリジン-2-カルボン酸の調製

【化 175】



10

ブチルリチウム（THF中に2.5 M/L）（3.9 mL、9.77 mmol）をテトラヒドロフラン（10 mL）中において希釈し、アルゴン雰囲気下で -78°C に冷却した。アセトニトリル（0.548 mL、10.4 mmol）を滴下し、溶液を -78°C で30分間攪拌した。4,6-ジクロロピリジン-2-カルボン酸（0.250 g、1.30 mmol）のテトラヒドロフラン（10 mL）中の溶液を添加し、反応混合物を -78°C で2時間、次いで室温で1時間攪拌した。この反応混合物をメタノール、続いて飽和水性 NaHCO_3 で失活させた。混合物をジクロロメタン（2×）で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮して、4-クロロ-6-(シアノメチル)ピリジン-2-カルボン酸及び6-クロロ-4-(シアノメチル)ピリジン-2-カルボン酸の混合物を黄色の油として得、これをそのまま次のステップにおいて用いた。LC-MS（方法1）： R_t 0.51、 m/z = 197 ($M+H^+$)。

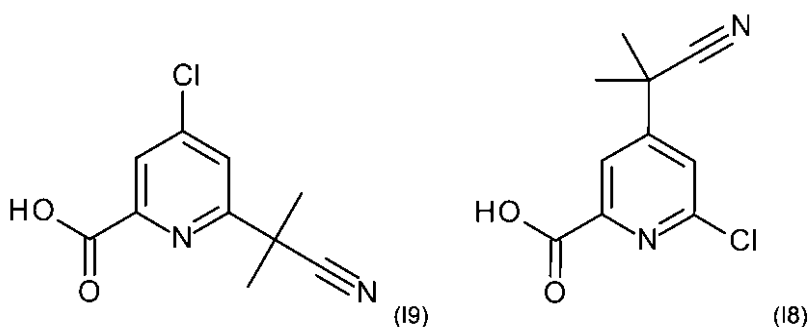
20

【0366】

ステップB：4-クロロ-6-(1-シアノ-1-メチル-エチル)ピリジン-2-カルボン酸（I9）及び6-クロロ-4-(1-シアノ-1-メチル-エチル)ピリジン-2-カルボン酸（I8）の調製

【化 176】

30



4-クロロ-6-(シアノメチル)ピリジン-2-カルボン酸及び6-クロロ-4-(シアノメチル)ピリジン-2-カルボン酸（250 mg、1.27 mmol）のアセトニトリル（2.54 mL）中の混合物に臭化テトラブチルアンモニウム（0.820 g、2.54 mmol）及びヨードメタン（0.379 g、2.67 mmol）を添加した。溶液を室温で30分間攪拌し、次いで 0°C で冷却した。水酸化ナトリウム（水中に50%）（0.671 mL、12.7 mmol）を滴下し、反応混合物を室温で一晩攪拌した。この反応混合物を水で失活させ、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。水性層を5 Mの塩酸で酸性化し、ジクロロメタン（3×）で抽出し、有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。粗残渣を逆相クロマトグラフィにより精製して4-クロロ-6-(1-シアノ-1-メチル-エチル)ピリジン-2-カルボン酸（中間体I9）及び6-クロロ-4-(1-シアノ-1-メチル-エチル)ピリジン-2-カルボン酸（中間体I8）を得たところ、これらは分離可能

40

50

であった。

中間体 I 9 : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 1.82 (s, 6H) 7.84 (d, $J=1.83\text{ Hz}$, 1H) 8.20 (d, $J=1.83\text{ Hz}$, 1H)
LC-MS (方法1) : R_t 0.75、 $m/z=225$ ($\text{M}+\text{H}^+$)。

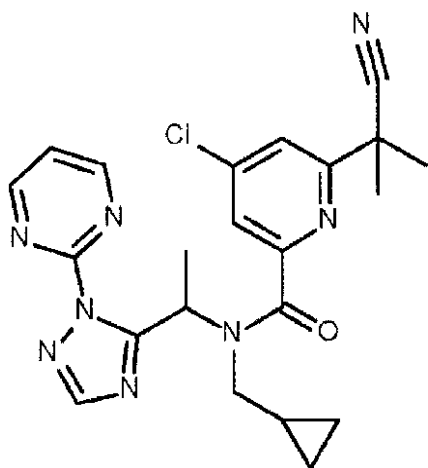
中間体 I 8 : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 1.78 (s, 6H) 7.69 (s, 1H) 8.18 (d, $J=1.47\text{ Hz}$, 1H)
LC-MS (方法1) : R_t 0.66、 $m/z=225$ ($\text{M}+\text{H}^+$)。

【0367】

ステップC : 4-クロロ-6-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]ピリジン-2-カルボキサミド (化合物P28) の調製

10

【化177】



20

(化合物P28)

所望の生成物を、4-クロロ-6-(1-シアノ-1-メチル-エチル)ピリジン-2-カルボン酸及び化合物P2 (ステップE) に記載の条件を用いて調製した。

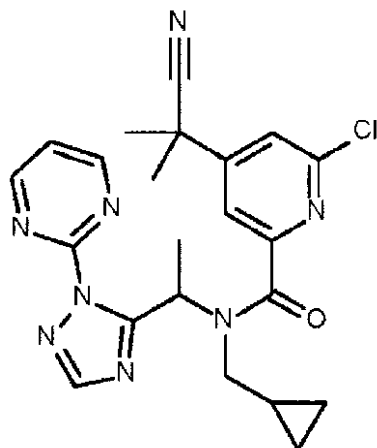
LC-MS (方法1) : R_t 0.91、 $m/z=451$ ($\text{M}+\text{H}^+$)。

【0368】

30

実施例23 : 6-クロロ-4-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]ピリジン-2-カルボキサミド (化合物P27) の調製

【化178】



40

(化合物P27)

所望の生成物を、6-クロロ-4-(1-シアノ-1-メチル-エチル)ピリジン-2-カルボン酸及び化合物P2 (ステップE) について記載の条件を用いて調製した。

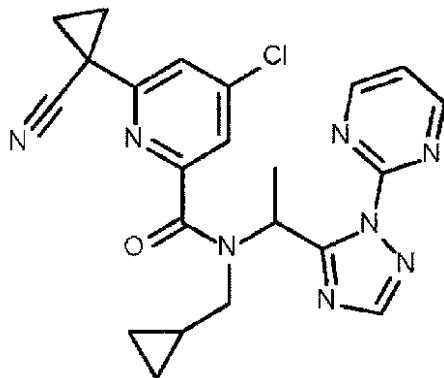
50

LC-MS (方法1) : R_t 0.90、 $m/z = 451$ ($M+H^+$)。

【0369】

実施例24 : 4-クロロ-6-(1-シアノシクロプロピル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]ピリジン-2-カルボキサミド (化合物P29) の調製

【化179】



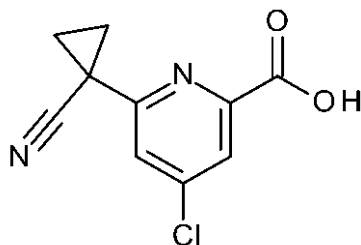
10

(化合物P29)

ステップA : 4-クロロ-6-(1-シアノシクロプロピル)ピリジン-2-カルボン酸 (I10) の調製

【化180】

20



(I10)

4-クロロ-6-(シアノメチル)ピリジン-2-カルボン酸 (0.182 g、0.926 mmol) (化合物P28に係るステップAにおいて調製した) のアセトニトリル (1.85 mL) 中の溶液に臭化テトラブチルアンモニウム (0.298 g、0.926 mmol) 及び1,2-ジブロモエタン (0.183 g、0.972 mmol) を添加した。溶液を室温で30分間攪拌し、次いで0℃で冷却した。水酸化ナトリウム (水中に50%) (0.244 mL、4.63 mmol) を滴下し、反応混合物を室温で一晩攪拌した。この反応混合物を水で失活させ、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。水性層を5Mの塩酸で酸性化し、ジクロロメタン (3×) で抽出し、有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。組み合わせた粗生成物を逆相クロマトグラフィにより精製して4-クロロ-6-(1-シアノシクロプロピル)ピリジン-2-カルボン酸を得た。

30

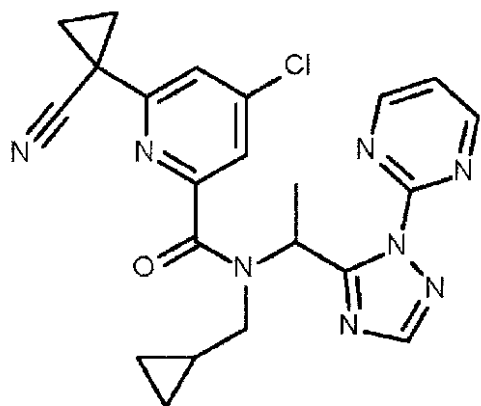
40

LC-MS (方法1) : R_t 0.61、 $m/z = 223$ ($M+H^+$)。

【0370】

ステップB : 4-クロロ-6-(1-シアノシクロプロピル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]ピリジン-2-カルボキサミド (化合物P29) の調製

【化 1 8 1】



(化合物P29)

10

所望の生成物を、4-クロロ-6-(1-シアノシクロプロピル)ピリジン-2-カルボン酸及び化合物 P 2 (ステップ E) に記載の条件を用いて調製した。

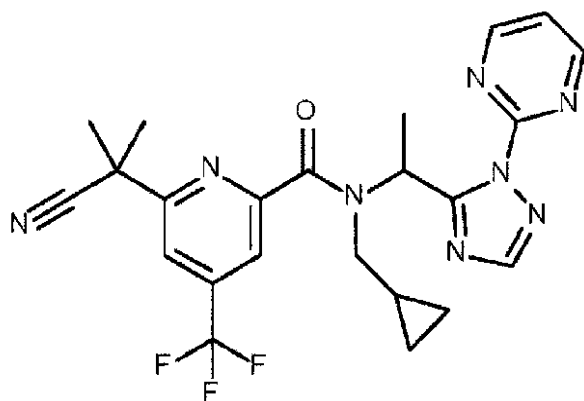
LC-MS (方法 1) : R_t 0.88、 $m/z = 449$ ($M+H^+$)。

【0 3 7 1】

実施例 25 : 6-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキサミド (化合物 P 3 1) の調製

20

【化 1 8 2】

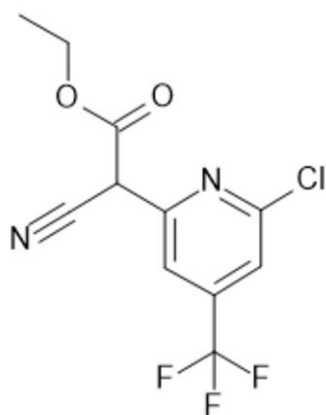


(化合物P31)

30

ステップ A : エチル 2-[6-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-2-シアノアセテートの調製

【化 1 8 3】



40

水素化ナトリウム (1.80 g、45.1 mmol) の N-メチル-2-ピロリドン (

50

12.0 mL)中の懸濁液を8℃で冷却し、エチルシアノアセテート(4.90 mL、45.1 mmol)を40分間かけて滴下した。混合物を、ガスの発生が停止するまで室温で15分間攪拌し、次いで2-クロロ-6-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)ピリジン(3.00 g、15.0 mmol)のN-メチル-2-ピロリドン(3.0 mL)中の溶液を滴下した。この反応混合物を室温で17時間攪拌した。反応媒体を、0℃で、水をゆっくりと添加することにより失活させた。次いで、これを2 N塩酸溶液でpHが3~4に達するまで酸性化し、酢酸エチル(3×)で抽出を行った。組み合わせた有機層を水(2×)、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製した。得られた生成物を冷ジエチルエーテル中に倍散し、ろ過した。固体のプレスケーキを冷ジエチルエーテルで洗浄し、乾燥させて、エチル2-[6-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-2-シアノアセテートを黄色の固体として得た。

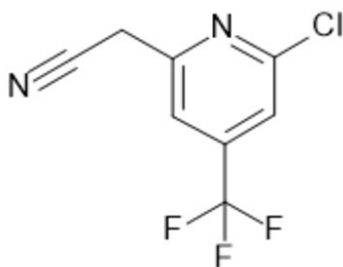
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 14.50 (1H, br s), 7.40 (1H, m), 6.65 (1H, t, $J=1.65$ Hz), 4.27-4.37 (3H, q, $J=6.97$ Hz), 1.32-1.40 (3H, t, $J=6.97$ Hz).

LC-MS (方法1): R_t 0.98, m/z = 291 ($M-H^+$).

【0372】

ステップB: 2-[6-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]アセトニトリルの調製

【化184】



2-[6-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-2-シアノアセテート(1.00 g、3.42 mmol)のエタノール(6.49 mL)中の懸濁液に水中の塩酸6 N(10.3 mL、61.5 mmol)を添加した。この反応混合物を還流で18時間攪拌し、次いで温度を室温に到達させた。反応媒体を氷/水に注ぎかけ、酢酸エチル(3×)で抽出を行った。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、2-[6-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]アセトニトリル(0.5623 g、2.549 mmol)を明るい黄色の油として得た。

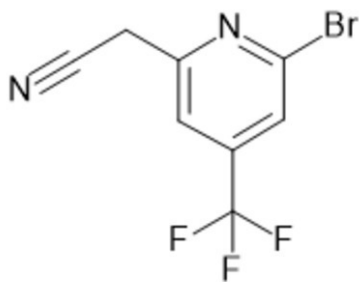
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 7.63 (1H, s), 7.58 (1H, s), 4.02 (2H, s).

LC-MS (方法1): R_t 0.88, m/z = 221 ($M+H^+$).

【0373】

ステップC: 2-[6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]アセトニトリルの調製

【化 185】



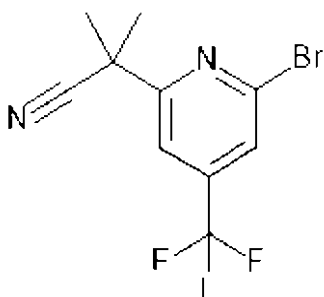
2-[6-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]アセトニトリル(0.562 g、2.55 mmol、1.00 当量)のプロピオニトリル(2.55 mL)中の溶液にトリメチルプロモシラン(0.804 g、0.693 mL、5.10 mmol、2.00 当量)を滴下した。この反応混合物を95℃で16時間攪拌し、次いでこれを室温に到達させた。この反応混合物を減圧下で濃縮し、粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、2-[6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]アセトニトリルをオレンジ色の油として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 7.73 (1H, s), 7.66 (1H, s), 4.03 (2H, s).

【0374】

ステップD: 2-[6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-2-メチルプロパンニトリルの調製

【化 186】



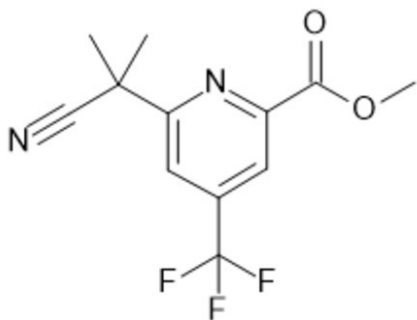
2-[6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]アセトニトリル(0.250 g、0.943 mmol)のジメチルスルホキシド(1.89 mL)中の溶液を8℃に冷却した。次いで、水素化ナトリウム(0.113 g、2.83 mmol)を、複数回に分け、2分間かけて添加した。混合物を、ガスの発生が停止するまで室温で20分間攪拌し、次いでヨードメタン(0.177 mL、2.83 mmol)を滴下した。この反応混合物を室温で1時間15分間攪拌した。次いで、これを、8℃で水をゆっくりと添加することにより慎重に失活させ、酢酸エチル(3×)で抽出した。組み合わせた有機層を水(2×)、塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、2-[6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-2-メチルプロパンニトリルを黄色の油として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 7.79 (1H, d, $J = 0.7$ Hz), 7.69 (1H, s), 1.80 (6H, s).

【0375】

ステップE: メチル6-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキシレートの調製

【化 1 8 7】



10

オートクレーブに室温、アルゴン雰囲気下において酢酸パラジウム (I I) (0.00234 g、0.0102 mmol)、Pd(dppf)Cl₂ (0.0111 g、0.0136 mmol)、dppf (0.00585 g、0.0102 mmol)、2-[6-プロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-2-メチルプロパンニトリル (0.100 g、0.341 mmol)、既に脱気したメタノール (3.5 mL) 及びトリエチルアミン (0.0976 mL、0.699 mmol) を仕込んだ。オートクレーブを閉じ、アルゴンでフラッシュし、次いで一酸化炭素でフラッシュした。この反応混合物を 100 °C、5 bar の一酸化炭素圧下において 4.5 時間攪拌した。この反応混合物を室温に到達させ、ろ過した。固体ケーキを酢酸エチルで洗浄し、ろ液を水中に注ぎ入れ、酢酸エチル (3×) で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィーにより精製して、6-(1-シアノ-1-メチルエチル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキシレートを得た。

20

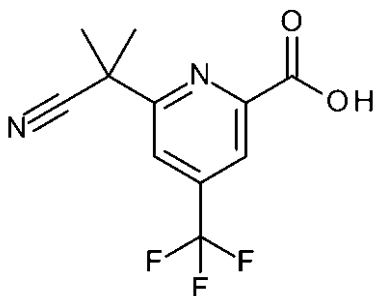
¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 8.27 (1H, s), 8.02 (1H, d, J = 0.73 Hz), 4.04 (3H, s), 1.85 (6H, s).
LC-MS (方法 1): R_t 0.96 分間、m/z = 273 (M+H⁺).

【0 3 7 6】

ステップ F: 6-(1-シアノ-1-メチルエチル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボン酸 (I 12) の調製

【化 1 8 8】

30



(I12)

40

6-(1-シアノ-1-メチルエチル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキシレート (0.083 g、0.30 mmol) のテトラヒドロフラン (0.91 mL) 及び水 (0.46 mL) 中の溶液に水酸化リチウム一水和物 (0.013 g、0.30 mmol) を添加し、得られた明るい黄色の溶液を室温で 2 時間攪拌した。この反応混合物を 1 M の塩酸で酸性化し、水性相を酢酸エチル (3×) で抽出した。組み合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、次いで濃縮して、6-(1-シアノ-1-メチルエチル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボン酸を得た。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 8.46 (1H, s), 8.06 (1H, s), 1.88 (6H, s)

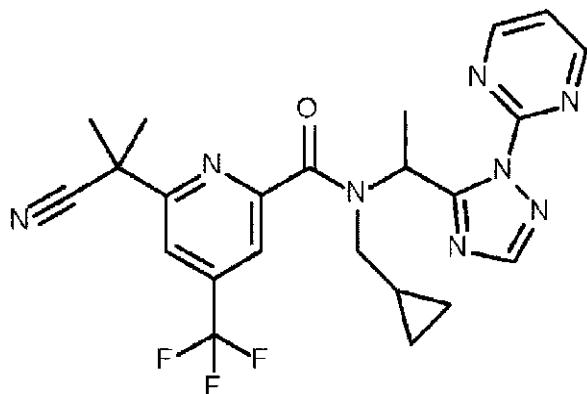
50

LC-MS（方法1）： R_t 0.80分間、 $m/z = 257$ ($M-H^+$)。

【0377】

ステップG：6-（1-シアノ-1-メチル-エチル）-N-（シクロプロピルメチル）-N-[1-（2-ピリジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル）エチル]-4-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-カルボキサミド（化合物P31）の調製

【化189】



(化合物P31)

10

所望の生成物を、6-（1-シアノ-1-メチル-エチル）-4-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-カルボン酸及び化合物P2（ステップE）について記載されている条件を用いて調製した。

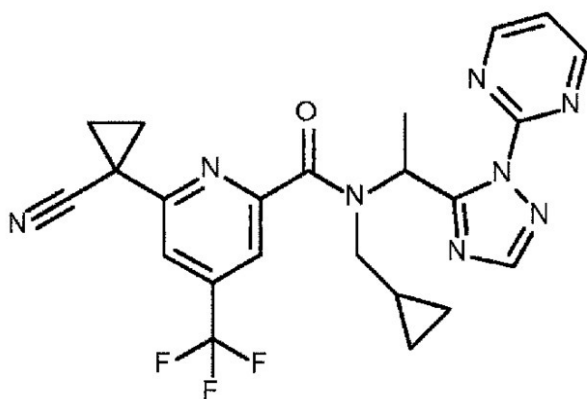
20

LC-MS（方法1）： R_t 0.95分間、 $m/z = 485$ ($M+H^+$)。

【0378】

実施例26：6-（1-シアノシクロプロピル）-N-（シクロプロピルメチル）-N-[1-（2-ピリジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル）エチル]-4-（トリフルオロメチル）ピリジン-2-カルボキサミド（化合物P33）の調製

【化190】



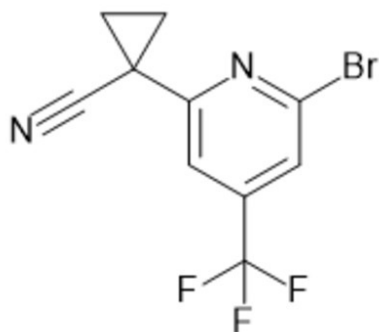
(化合物P33)

30

40

ステップA：1-[6-ブロモ-4-（トリフルオロメチル）-2-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリルの調製

【化 1 9 1】



10

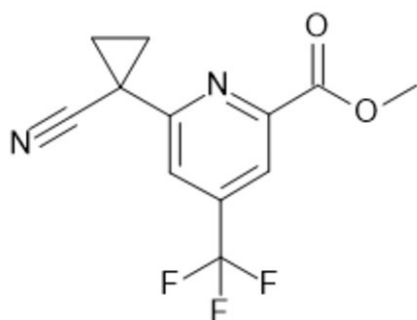
ジメチルスルホキシド（4.81 mL）中に希釈した、2-[6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]アセトニトリル（化合物 P 3 1 に係るステップ C において調製した）（0.364 g、1.37 mmol）の溶液に 8℃で水素化ナトリウム（0.165 g、4.12 mmol）を添加した。混合物を、ガスの発生が停止するまで室温で 20 分間攪拌し、次いで 1, 2-ジブロモエタン（0.179 mL、2.06 mmol）を滴下した。この反応混合物を室温で 1.5 時間攪拌した。次いで、反応混合物を慎重に 8℃で水で失活させ、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を水（2×）、塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、1-[6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリルを白色の固体として得た。
¹H-NMR（400 MHz, CDCl₃, ppm）δ：7.88（1H, s）, 7.58（1H, s）, 1.88-1.94（2H, m）, 1.82-1.87（2H, m）。
 LC-MS（方法 1）：R_t 1.06 分間、m/z = 291/293（M+H⁺）。

20

【0 3 7 9】

ステップ B：メチル 6-(1-シアノシクロプロピル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキシレートの調製

【化 1 9 2】



30

所望の生成物を、1-[6-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル及び化合物 P 3 1（ステップ E）に記載の条件を用いて調製した。

40

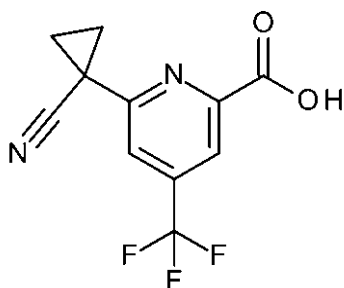
¹H-NMR（400 MHz, CDCl₃, ppm）δ：8.17（1H, s）, 8.11（1H, d, J = 0.73 Hz）, 4.00（3H, s）, 1.95-2.04（2H, m）, 1.80-1.93（2H, m）。

LC-MS（方法 1）：R_t 0.94 分間、m/z = 271（M+H⁺）。

【0 3 8 0】

ステップ C：6-(1-シアノシクロプロピル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボン酸（I 1 4）の調製

【化 1 9 3】



(114)

10

所望の生成物を、6-(1-シアノシクロプロピル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキシレート及び化合物P31(ステップF)に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 9.74–10.27 (1H, br s), 8.37 (1H, m), 8.17 (1H, m), 1.97–2.04 (2H, m), 1.88–1.96 (2H, m).

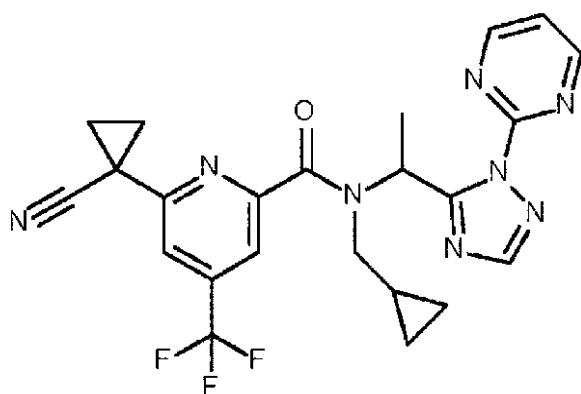
LC-MS (方法1): R_t 0.79分間、 $m/z = 257$ ($M+H^+$)。

【0381】

ステップD: 6-(1-シアノシクロプロピル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキサミド(化合物P33)の調製

20

【化 1 9 4】



(化合物P33)

30

所望の生成物を、6-(1-シアノシクロプロピル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボン酸及び化合物P2(ステップE)に記載の条件を用いて調製した。

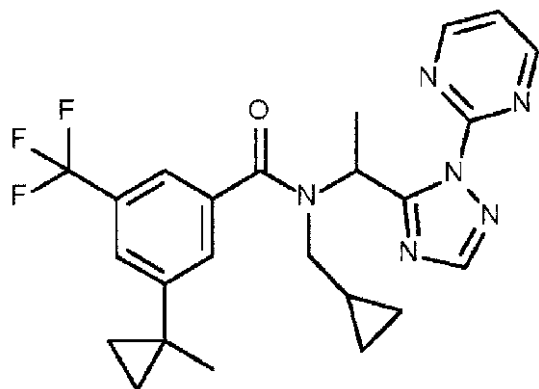
LC-MS (方法1): R_t 0.94分間、 $m/z = 483$ ($M+H^+$)。

【0382】

実施例27: N-(シクロプロピルメチル)-3-(1-メチルシクロプロピル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物P38)の調製

40

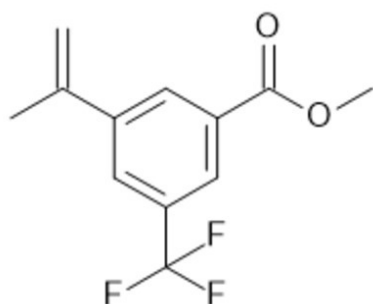
【化 1 9 5】



10

(化合物P38)

ステップA：3-イソプロペニル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルの調製
【化 1 9 6】



20

3-ブromo-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル(5.00 g、17.3 mmol)のジメトキシエタン(69.2 mL)中の溶液を、アルゴン雰囲気下で5分間脱気し、次いでPd(PPh₃)₄(0.808 g、0.692 mmol)、続いてイソプロペニルボロン酸ピナコールエステル(3.06 g、3.42 mL、17.3 mmol)を添加した。次いで、炭酸ナトリウム(7.35 g、69.2 mmol)の水(34.6 mL)中の脱気した2 N溶液を滴下した。この反応混合物を95℃で3.5時間攪拌し、次いで温度を室温に到達させた。水を反応混合物に添加し、これを酢酸エチルで抽出した(3×)。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-イソプロペニル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルを得た。

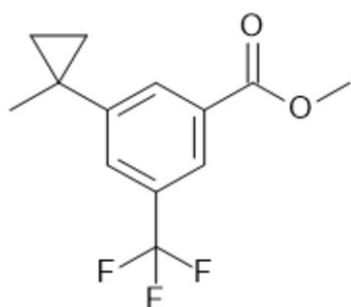
30

¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 8.31(1H, s), 8.20(1H, s), 7.88(1H, s), 5.51(1H, t, J=1.11 Hz), 5.26(1H, t, J=1.46 Hz), 3.98(3H, s), 2.21(3H, dd, J=1.47, 0.73 Hz).

【0383】

ステップB：3-(1-メチルシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルの調製
【化 1 9 7】

40



50

ヘキサン中のジエチル亜鉛 1.0 M 溶液 (6.1 mL、6.14 mmol) をジクロロメタン (3.4 mL) 中に希釈し、溶液を 0 °C に冷却した。次いで、トリフルオロ酢酸 (0.473 mL、6.14 mmol) のジクロロメタン (3.4 mL) 中の溶液を滴下した。混合物を 0 °C で 15 分間攪拌し、ジヨードメタン (0.506 mL、6.14 mmol) を滴下した。この反応混合物を 0 °C で 15 分間攪拌し、次いで 3-イソプロペニル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル (0.500 g、2.05 mmol) のジクロロメタン (3.4 mL) 中の溶液を滴下した。この反応混合物を 0 °C で 15 分間、次いで室温で 4.5 時間攪拌した。この反応混合物を 0 °C に冷却し、慎重にメタノール、次いで飽和 NH₄Cl 水溶液で失活させた。酢酸エチル (3×) で抽出を行った。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-(1-メチルシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルを明るい黄色の油として得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆, ppm) δ: 8.09 (2H, m), 7.68 (1H, m), 3.93 (3H, s), 1.46 (3H, s), 0.88-0.97 (2H, m), 0.83-0.88 (2H, m).

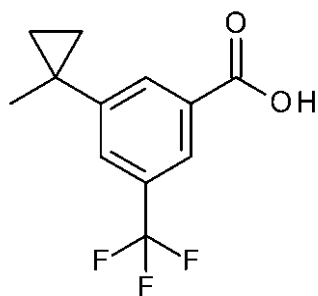
10

【0384】

ステップ C: 3-(1-メチルシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸 (I17) の調製

【化198】

20



(I17)

所望の生成物を、3-(1-メチルシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル及び化合物 P31 (ステップ F) に記載の条件を用いて調製した。

30

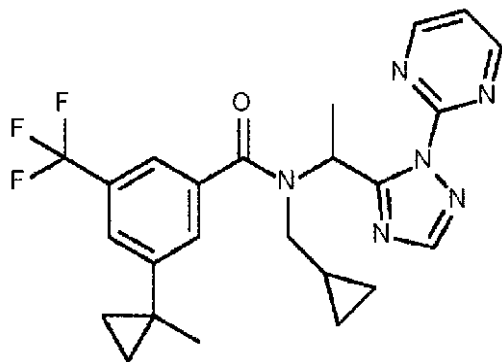
¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 8.17 (1H, m), 8.16 (1H, m), 7.74 (1H, m), 1.48 (3H, s), 0.91-0.98 (2H, m), 0.79-0.90 (2H, m).

LC-MS (方法 1): R_t 1.02 分間、m/z = 243 (M-H⁺).

【0385】

ステップ D: N-(シクロプロピルメチル)-3-(1-メチルシクロプロピル)-N-[1-(2-ピリジン-2-イル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド (化合物 P38) の調製

【化 1 9 9】



(化合物P38)

10

所望の生成物を、3-(1-メチルシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸及び化合物P2(ステップE)に記載の条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ (600 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : -0.05-0.03 (m, 1H) 0.08 (br dd, $J=8.9, 4.4$ Hz, 1H) 0.45 (ddt, $J=12.7, 8.4, 4.3, 4.3$ Hz, 2H) 0.84-0.91 (m, 1H) 0.92-0.98 (m, 4H) 1.48 (s, 3H) 1.88 (d, $J=7.1$ Hz, 3H) 3.19 (br dd, $J=15.0, 6.1$ Hz, 1H) 3.34 (br dd, $J=14.9, 6.0$ Hz, 1H) 6.34 (q, $J=6.9$ Hz, 1H) 7.25 (s, 1H) 7.28 (s, 1H) 7.59 (s, 1H) 7.69 (t, $J=4.8$ Hz, 1H) 8.23 (s, 1H) 8.95 (d, $J=4.9$ Hz, 2H).

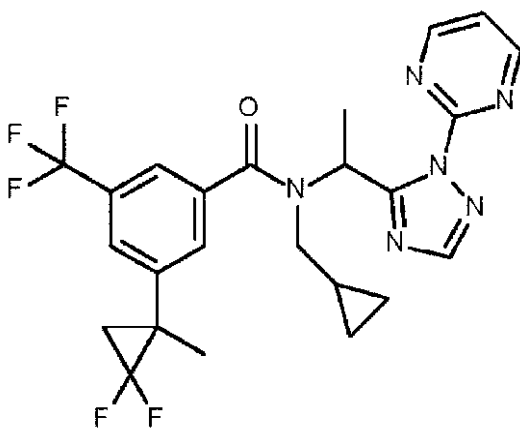
LC-MS (方法1): R_t 1.07 分間、 $m/z=471$ ($M+H^+$)。

【0386】

実施例28: N-(シクロプロピルメチル)-3-(2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物P44)の調製

【化 2 0 0】

30

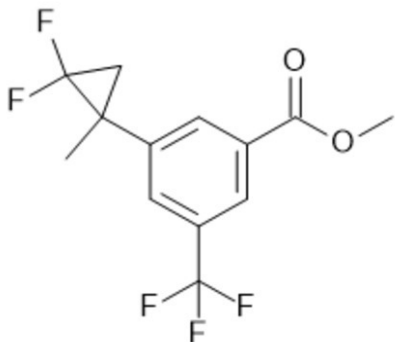


(化合物P44)

40

ステップA: 3-(2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルの調製

【化 2 0 1】



10

3-イソプロペニル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル(化合物P38に係るステップAにおいて調製した)(0.500g、2.05mmol)のトルエン(14.3mL)中の溶液に臭化テトラブチルアンモニウム(0.0200g、0.0614mmol)及びトリメチル(プロモジフルオロメチルシラン(0.478mL、3.07mmol)を添加した。この反応混合物を110℃に2時間加熱し、次いで温度を室温に到達させた。この反応混合物を氷/水に注ぎかけ、シクロヘキサン(3×)で抽出を行った。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-(2,2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルを明るい黄色の油として得た。

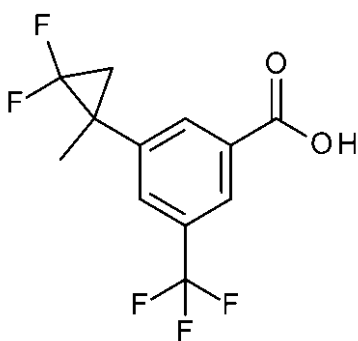
20

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 8.22 (1H, t), 8.19 (1H, t), 7.76 (1H, t), 3.98 (3H, s), 1.72-1.79 (1H, m), 1.56 (3H, s), 1.58-1.51 (1H, m)。

【0387】

ステップB: 3-(2,2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸(I21)の調製

【化 2 0 2】



(I21)

30

所望の生成物を、3-(2,2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル及び化合物P31(ステップF)に記載の条件を用いて調製した。

40

$^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 8.31 (1H, s), 8.26 (1H, s), 7.83 (1H, s), 1.75-1.81 (1H, m), 1.60 (3H, m), 0.54-1.60 (1H, m)。

LC-MS (方法1): R_t 0.98分間、 m/z = 279 ($M-H^+$)。

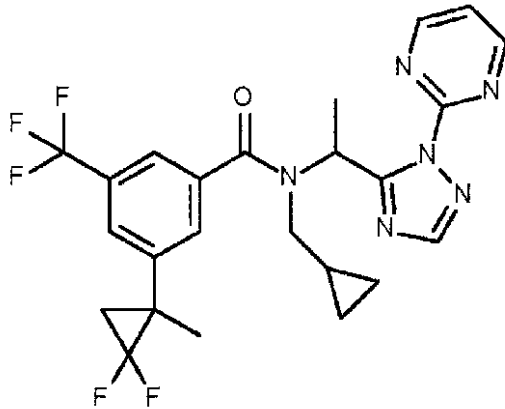
【0388】

ステップC: N-(シクロプロピルメチル)-3-(2,2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物P44)の調

50

製

【化 2 0 3】



10

(化合物P44)

所望の生成物を、3-(2,2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸及び化合物P2(ステップE)に記載の条件を用いて調製した。

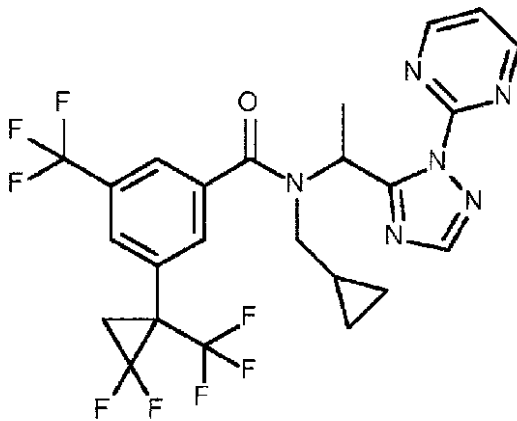
LC-MS(方法1): R_t 1.04分間、 $m/z = 507$ ($M+H^+$)。

【0389】

実施例29: N-(シクロプロピルメチル)-3-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物P41)の調製

20

【化 2 0 4】



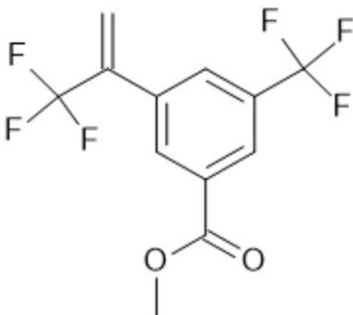
30

(化合物P41)

ステップA: 3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)ビニル]安息香酸メチルの調製

【化 2 0 5】

40



3-ブromo-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチル(0.500g、1.68m

50

mol) をジメトキシエタン (6.71 mL) 中に溶解し、アルゴン雰囲気下で 5 分間脱気した。次いで、Pd (PPh₃)₄ (0.0784 g、0.0671 mmol)、続いて 4,4,6-トリメチル-2-[1-(トリフルオロメチル)ビニル]-1,3,2-ジオキサボリナン (0.348 mL、1.68 mmol) を添加した。次いで、炭酸ナトリウム (0.713 g、6.71 mmol) の水 (3.36 mL) 中の 2 N 溶液を滴下した。この反応混合物を 85 °C に 3.5 時間加熱し、次いで温度を室温に到達させた。反応混合物を水で失活させ、酢酸エチル (3×) で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)ビニル]安息香酸メチルを無色の液体として得た。

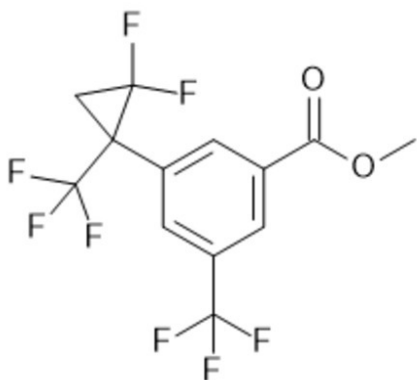
10

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 3.99 (s, 3H) 5.92 (q, J = 1.22 Hz, 1H) 6.14 (d, J = 0.73 Hz, 1H) 7.88 (s, 1H) 8.30–8.35 (m, 2H)

【0390】

ステップ B: 3-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]-5-(トリフルオロメチル)安息香酸メチルの調製

【化206】



20

所望の生成物を、3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)ビニル]安息香酸メチルメチル及び化合物 P44 (ステップ A) に記載の条件を用いて調製した。

30

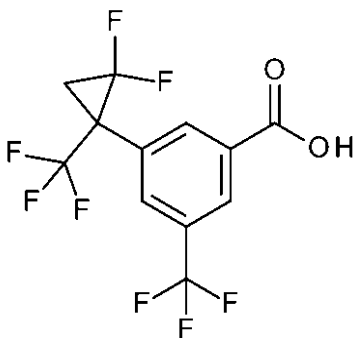
¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 8.2–8.6 (m, 2H) 7.9 (s, 1H) 4.0 (s, 3H) 2.5 (ddd, J = 12.56, 8.89, 6.05 Hz, 1H) 2.0 (dddt, J = 12.56, 8.16, 3.12, 1.47, 1.47 Hz, 1H)

【0391】

ステップ C: 3-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]-5-(トリフルオロメチル)安息香酸 (I19) の調製

【化207】

40

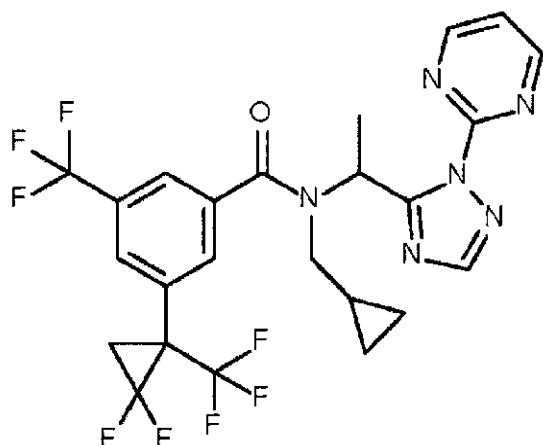


(I19)

50

【化 2 0 8】

10

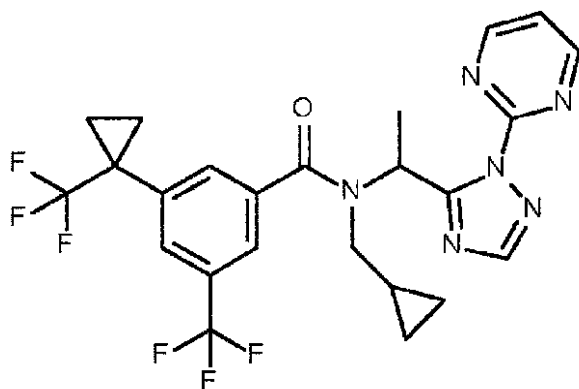


20

(化合物41)

30

【化 2 0 9】

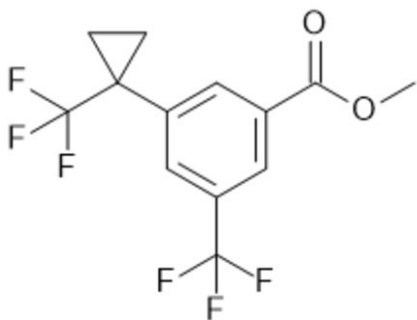


40

(化合物P45)

ステップ A：3-（トリフルオロメチル）-5-[1-（トリフルオロメチル）シクロプロピル]安息香酸メチルの調製

【化 2 1 0】



10

3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)ビニル]安息香酸メチル(化合物P41に係るステップAにおいて調製した)(0.097g、0.33mmol)のテトラヒドロフラン(1.3mL)中の溶液をアルゴン雰囲気下で-78℃に冷却した。次いで、THF(1.3mL、1.3mmol)中のジフェニル(メチル)スルホニウム塩テトラフルオロボレート(0.190g、0.65mmol)及び1Mリチウムビス(トリメチルシリル)アミドを添加した。この反応混合物を室温に温め、これを室温で2時間攪拌した。この反応混合物をNH₄Cl水溶液で失活させ、酢酸エチルで抽出した(2×)。組み合わせた有機相を水、続いて塩水で洗浄し(2×)、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸メチルを無色の油として得た。

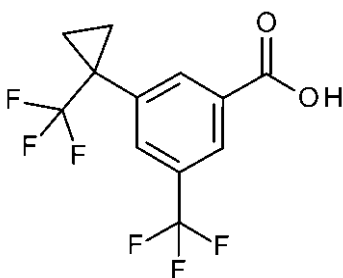
20

LC-MS(方法1): R_t 1.00分間、m/z = 311 (M-H⁺)。

【0394】

ステップB: 3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸(I22)の調製

【化 2 1 1】



(I22)

30

所望の生成物を、3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸塩及び化合物P31(ステップF)に記載の条件を用いて調製した。

¹H-NMR(400MHz, CDCl₃, ppm) δ: 1.10-1.18(m, 2H) 1.21-1.35(m, 1H) 1.47-1.54(m, 2H) 7.98(s, 1H) 8.34-8.42(m, 2H)

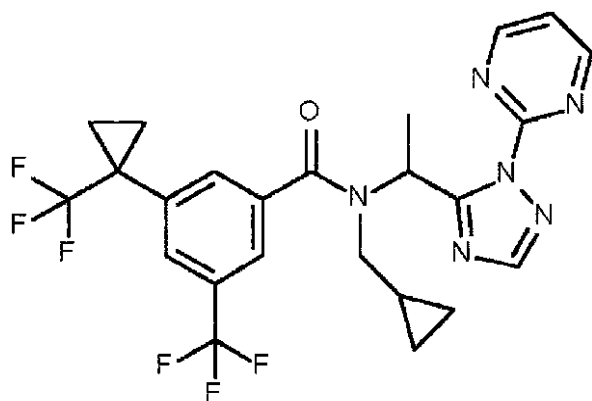
40

LC-MS(方法1): R_t 1.03分間、m/z = 297 (M-H⁺)。

【0395】

ステップC: N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]ベンズアミド(化合物P45)の調製

【化 2 1 2】



(化合物P45)

10

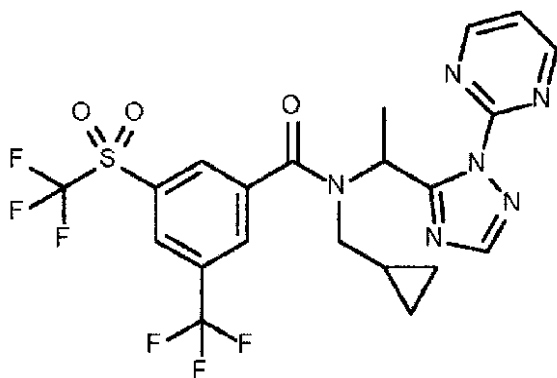
所望の生成物を、3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸及び化合物P2(ステップE)に記載の条件を用いて調製した。
LC-MS(方法1): R_t 1.09分間、 $m/z = 525$ ($M+H^+$)。

【0396】

実施例31: N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンズアミド(化合物P89)の調製

20

【化 2 1 3】

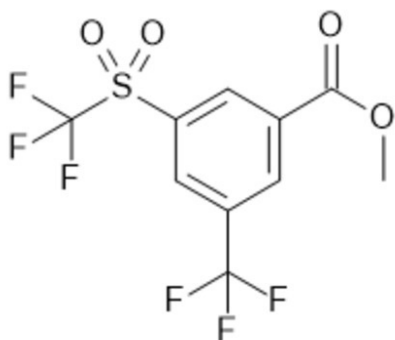


(化合物P89)

30

ステップA: 3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)安息香酸メチルの調製

【化 2 1 4】



40

0℃に冷却した、3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)安息香酸メチル(化合物P26に係るステップAにおいて調製した)(1.8g、5.3mmol)のジクロロメタン(16mL)中の溶液に3-クロロ過安息香酸(2.3g、11mmol)を複数回に分けて添加した。室温で1時間攪拌した後、3-クロロ過安息香酸(2.3g、11mmol)をさらに添加し、反応混合物を一晩攪拌した。形成

50

した沈殿物をろ過した。ろ液をチオ硫酸ナトリウムの10%水溶液及びNaHCO₃飽和溶液で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)安息香酸メチルを得た。

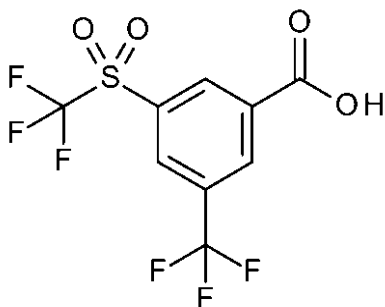
¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃, ppm) δ: 4.07 (s, 3H) 8.43-8.51 (m, 1H) 8.70-8.80 (m, 1H) 8.84-8.91 (m, 1H)

¹⁹F-NMR (377 MHz, CDCl₃, ppm) δ: -77.49 (s, 3F) -62.96 (s, 3F)

【0397】

ステップB: 3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)安息香酸(I41)の調製

【化215】



(I41)

3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)安息香酸メチル(1.8g、5.4mmol)をフラスコに仕込み、テトラヒドロフラン(16mL)及び水(11mL)中に溶解した。この混合物に水酸化リチウム一水和物(0.26g、11mmol)を添加し、反応物を室温で1時間攪拌した。この反応混合物を1Mの塩酸で酸性化し、水性相を酢酸エチルで2回抽出した。組み合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、次いで濃縮して3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)安息香酸を得、これをさらに精製せずに用いた。

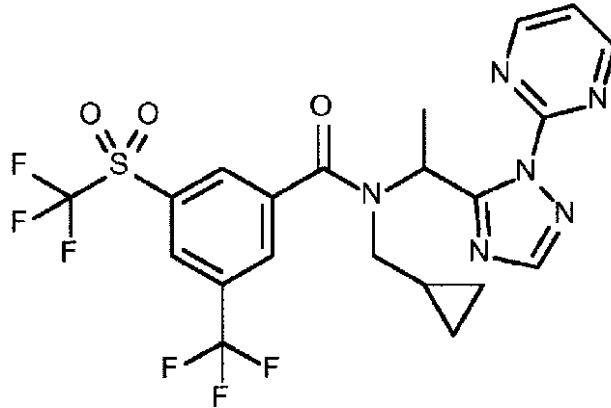
¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆, ppm) δ: 8.68 (s, 2H) 8.71-8.76 (m, 1H) 13.33-15.22 (m, 1H).

LC-MS (方法1): R_t 0.98分間、m/z = 321 (M-H⁺).

【0398】

ステップC: N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンズアミド(化合物89)の調製

【化 2 1 6】



(化合物89)

10

所望の生成物を、3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)安息香酸及び化合物P2(ステップE)について記載されている条件を用いて調製した。

$^1\text{H-NMR}$ (600 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : -0.19--0.10 (m, 1H) -0.06 (br dd, $J=8.81, 4.27$ Hz, 1H) 0.29-0.39 (m, 2H) 0.71-0.78 (m, 1H) 1.78 (d, $J=6.90$ Hz, 3H) 3.13 (br dd, $J=15.26, 6.18$ Hz, 1H) 3.23 (br dd, $J=15.26, 5.99$ Hz, 1H) 6.19-6.27 (m, 1H) 7.59 (t, $J=4.90$ Hz, 1H) 8.08-8.20 (m, 3H) 8.33 (s, 1H) 8.87 (d, $J=4.90$ Hz, 2H)

20

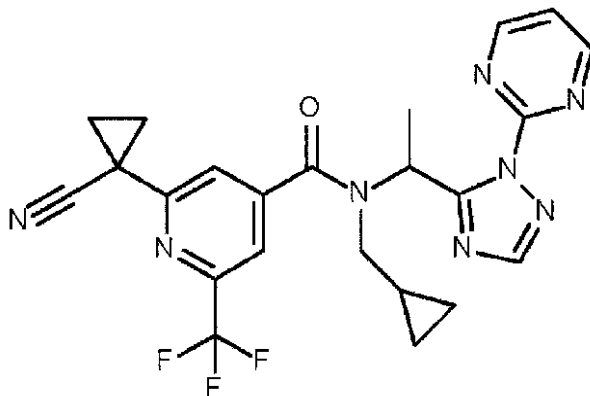
LC-MS (方法1): R_t 1.03 分間、 $m/z = 549$ ($M+H^+$)。

【0399】

実施例32: 2-(1-シアノシクロプロピル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド(化合物P32)の調製

【化 2 1 7】

30

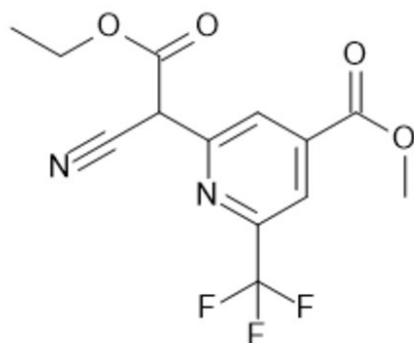


(化合物P32)

40

ステップA: メチル2-(1-シアノ-2-エトキシ-2-オキソ-エチル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートの調製

【化 2 1 8】



10

メチル 2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート (1.05 g、4.40 mmol) をジメチルスルホキシド (13.2 mL) 中に溶解した。次いで、エチル 2-シアノアセテート (0.702 mL、6.60 mmol)、炭酸カリウム (1.535 g、11.00 mmol) 及び臭化テトラブチルアンモニウム (0.145 g、0.440 mmol) を順次に室温で添加した。得られた懸濁液を 90℃ で 1 時間攪拌し、次いで室温で一晩攪拌した。反応塊を 50 mL の水及び 100 mL の酢酸エチルで希釈し、0~10℃ に冷却し、pH 3 まで 1 N 塩酸でゆっくりと失活させた。水性相を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で 50℃ で濃縮した。粗材料を、シクロヘキサン中の酢酸エチルを用いるシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、メチル 2-(1-シアノ-2-エトキシ-2-オキソ-エチル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートを得た。

20

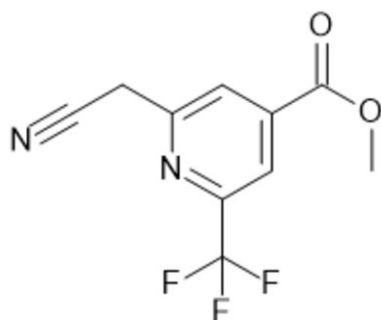
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 1.36–1.43 (m, 3H) 4.01 (s, 3H) 4.34 (q, $J=7.58$ Hz, 2H) 7.34 (s, 1H) 8.06 (s, 1H) 14.46–14.67 (m, 1H).
LC-MS (方法 1): 保持時間 1.01 分間、 m/z 317 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

【0400】

ステップ B: メチル 2-(シアノメチル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートの調製

【化 2 1 9】

30



メチル 2-(1-シアノ-2-エトキシ-2-オキソ-エチル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート (0.800 g、2.53 mmol) のジメチルスルホキシド (20 mL) 中の溶液に水 (10 mL) 中の塩化ナトリウム (0.299 g、5.06 mmol) を添加した。得られた混合物を 95℃ で 4 時間攪拌した。室温まで冷却させた後、反応混合物を水 (50 mL) で希釈し、酢酸エチル (3×50 mL) で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮してメチル 2-(シアノメチル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレートを得、これをさらに精製せずに用いた。

40

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3 , ppm) δ : 4.05 (s, 3H) 4.13 (s, 2H) 8.24 (s, 1H) 8.26 (s, 1H).

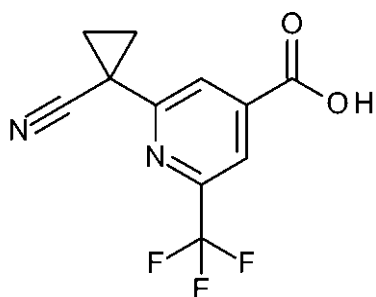
LC-MS (方法 1): 保持時間 0.89 分間、 m/z 243 $[\text{M}-\text{H}]^-$.

50

【0401】

ステップC：2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸 (I13) の調製

【化220】



(I13)

10

メチル 2-(シアノメチル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキシレート (0.05 g, 0.20 mmol) をジメチルホルムアミド (2 mL) 中に溶解した。水素化ナトリウム (24 mg, 0.61 mmol) を室温で添加したところ、無色の溶液が濃い紫色の懸濁液となった。10分後、1,2-ジブロモエタン (0.02 mL, 0.24 mmol) を添加し、得られた懸濁液を室温で15分間攪拌した。この反応混合物を飽和塩化アンモニウム溶液で、0~5℃で失活させ、酢酸エチルで希釈した。水性層を1N塩酸でpH2~3に酸性化し、酢酸エチル(2×)で抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させた。粗生成物を逆相クロマトグラフィにより精製して、2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸を得た。

20

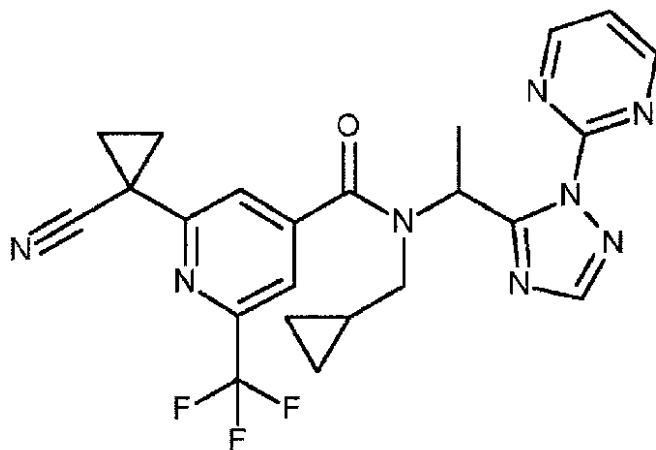
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6 , ppm) δ : 1.76-1.83 (m, 2H) 1.96-2.03 (m, 2H) 8.07 (d, $J=1.10$ Hz, 1H) 8.17 (s, 1H) 13.35-15.45 (m, 1H).

【0402】

ステップD：2-(1-シアノシクロプロピル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド (化合物P32) の調製

30

【化221】



(化合物P32)

40

所望の生成物を、2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸及び化合物P2 (ステップE) について記載されている条件を用いて調製した。

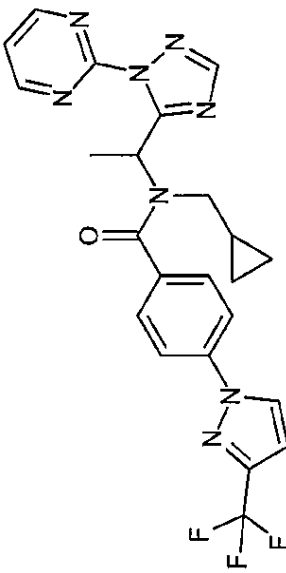
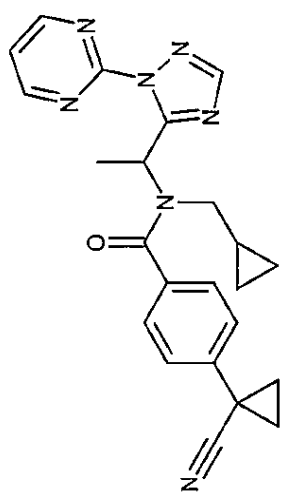
LC-MS (方法1): R_t 0.96 分間、 $m/z = 483$ ($M+H^+$)。

【0403】

50

【表 1 2 - 1】

表 P:式 I の化合物例

項目	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C / NMR
P1	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-4-[3-(トリフルオロ メチル)ピラゾール-1-イル] ベンズアミド		0.94	483	1	
P2	4-(1-シアノシクロプロピル)- N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]ベンズアミド		0.83	414	1	

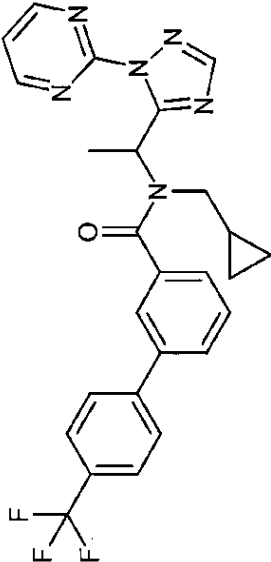
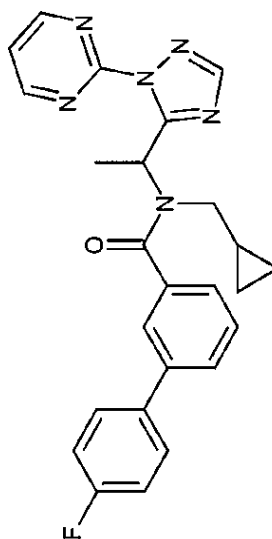
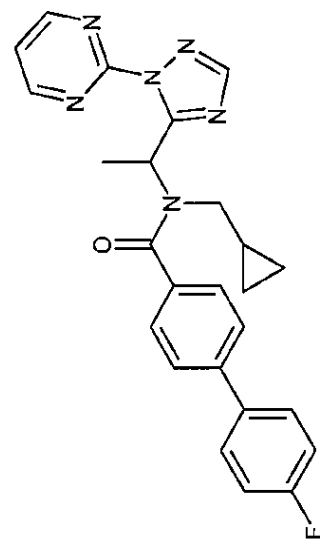
10

20

30

40

【表 1 2 - 2】

P3	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-3-[4-(トリフルオロ メチル)フェニル]ベンズアミド		1.07	493	1	
P4	N-(シクロプロピルメチル)- 3-(4-フルオロフェニル)-N- [1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]ベンズアミド		0.99	443	1	
P5	N-(シクロプロピルメチル)- 4-(4-フルオロフェニル)-N- [1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]ベンズアミド		0.99	443	1	

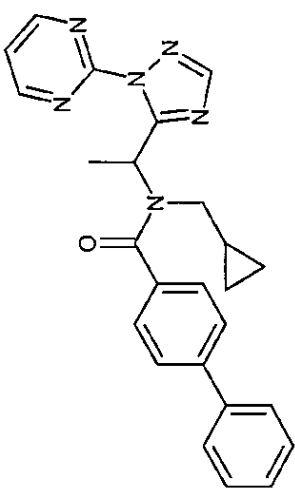
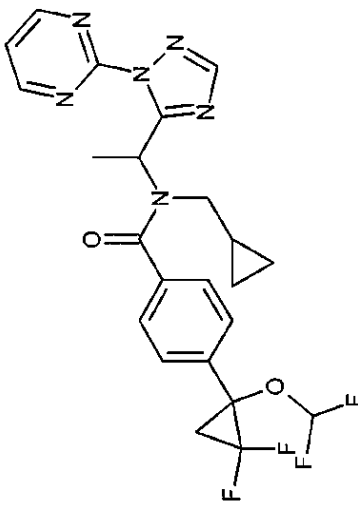
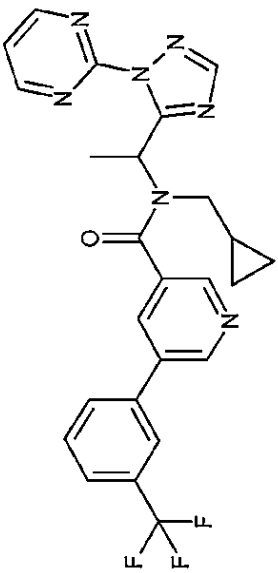
10

20

30

40

【表 1 2 - 3】

P6	N-(シクロプロピルメチル)- 4-フェニル-N-[1-(2-ピリミ ジン-2-イル-1,2,4-トリアゾ ール-3-イル)エチル]ベンズ アミド		1.56	425	2	
P7	N-(シクロプロピルメチル)- 4-[1-(ジフルオロメトキシ)- 2,2-ジフルオロ-シクロプロピ ル]-N-[1-(2-ピリミジン-2- イル-1,2,4-トリアゾール-3- イル)エチル]ベンズアミド		1.47	491	2	
P8	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-5-[3-(トリフルオロ メチル)フェニル]ピリジン-3- カルボキサミド		1.51	494	2	

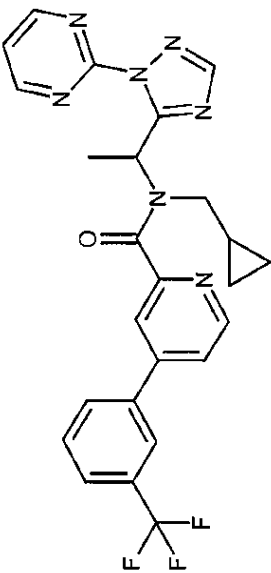
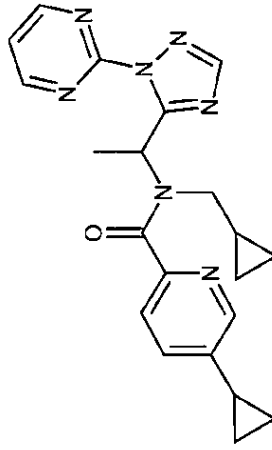
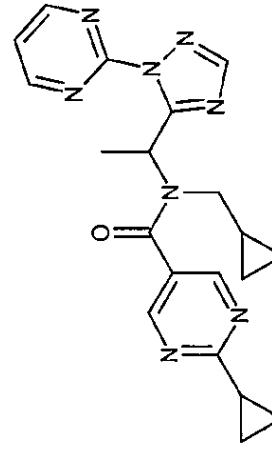
10

20

30

40

【表 1 2 - 4】

P9	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-4-[3-(トリフルオロ メチル)フェニル]ピリジン-2- カルボキサミド		1.60	494	2	
P10	5-シクロプロピル-N-(シクロ プロピルメチル)-N-[1-(2-ピ リミジン-2-イル-1,2,4-トリア ゾール-3-イル)エチル]ピリ ジン-2-カルボキサミド		1.25	390	2	
P11	2-シクロプロピル-N-(シクロ プロピルメチル)-N-[1-(2-ピ リミジン-2-イル-1,2,4-トリア ゾール-3-イル)エチル]ピリミ ジン-5-カルボキサミド		1.12	391	2	

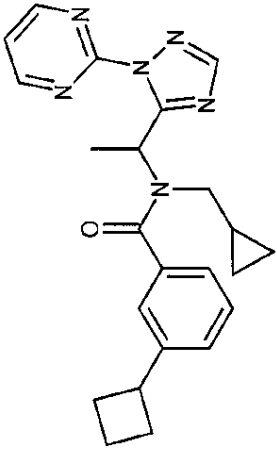
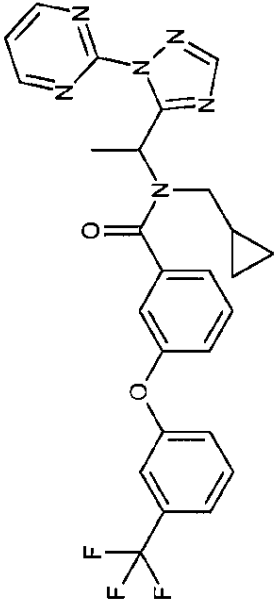
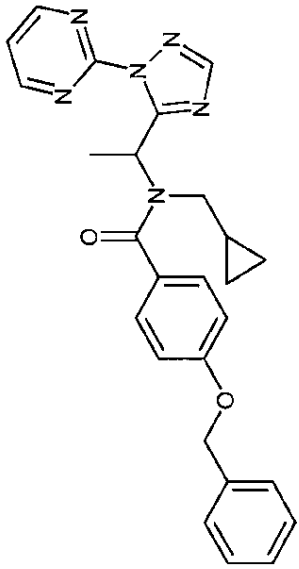
10

20

30

40

【表 1 2 - 5】

P12	3-シクロプロピル-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]ベンズアミド		1.57	403	2	
P13	N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ベンズアミド		1.74	509	2	
P14	4-ベンジルオキシ-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]ベンズアミド		1.57	455	2	

10

20

30

40

【表 1 2 - 6】

P15	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-6-[3-(トリフルオロ メチル)フェニル]ピリジン-2- カルボキサミド		1.66	494	2	
P16	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-4-[4-(トリフルオロ メチル)フェノキシ]ベンズアミ ド		1.76	509	2	
P17	N-(シクロプロピルメチル)- 4-(2-オキソ-1-ペペリジル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]ベンズアミド		1.09	446	2	

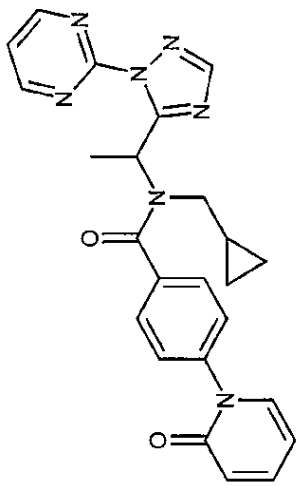
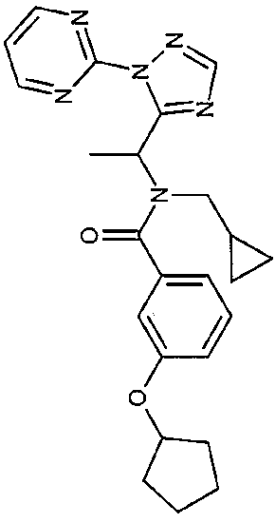
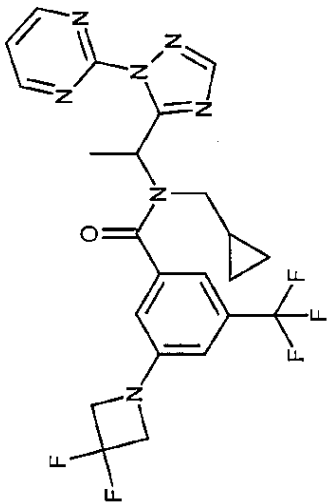
10

20

30

40

【表 1 2 - 7】

P18	N-(シクロプロピルメチル)- 4-(2-オキソ-1-ピリジル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]ベンズアミド		1.01	442	2	
P19	3-(シクロペンチキシ)-N-(シ クロプロピルメチル)-N-[1- (2-ピリミジン-2-イル-1,2,4- トリアゾール-3-イル)エチ ル]ベンズアミド		1.60	433	2	
P20	N-(シクロプロピルメチル)- 3-(3,3-ジフルオロアゼチジ ン-1-イル)-N-[1-(2-ピリミ ジン-2-イル-1,2,4-トリアゾ ール-3-イル)エチル]-5-(ト リフルオロメチル)ベンズアミ ド		1.01	508	1	

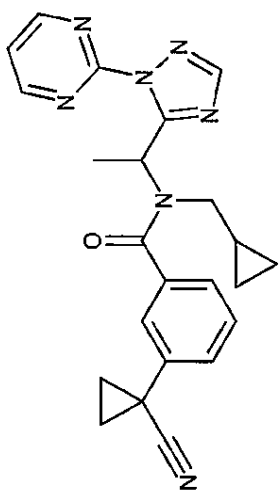
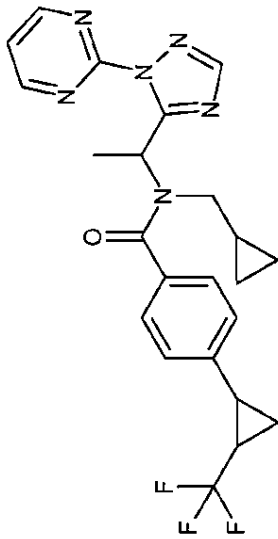
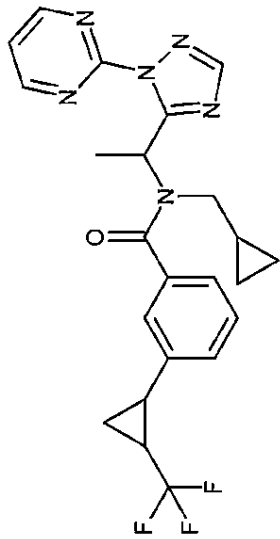
10

20

30

40

【表 1 2 - 8】

P21	3-(1-シアシクロプロピル)- N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]ベンズアミド		0.83	414	1	
P22	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-4-[2-(トリフルオロ メチル)シクロプロピル]ベン ズアミド		0.98	457	1	
P23	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-3-[2-(トリフルオロ メチル)シクロプロピル]ベン ズアミド		0.98	457	1	

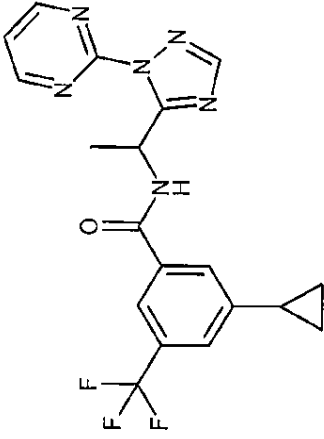
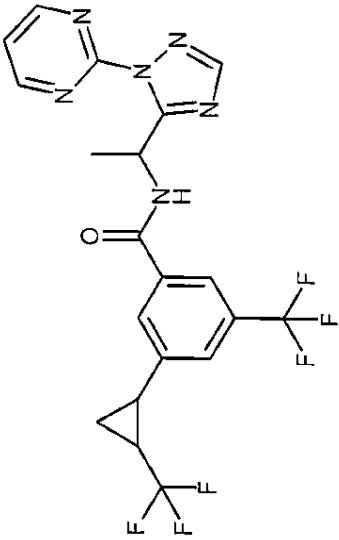
10

20

30

40

【表 1 2 - 9】

P24	3-シクロプロピル-N-[1-(2- ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリ アゾール-3-イル)エチル]- 5-(トリフルオロメチル)ベン ズアミド		0.94	403	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , ppm): δ = 141 - 143 / 8.93 (2 H, d, J=4.77 Hz), 8.07 (1 H, s), 7.81 (1 H, m), 7.71 (1 H, m), 7.44 (2 H, m), 7.41 (1 H, t, J=4.77 Hz), 6.42 - 6.50 (1 H, m), 1.98 - 2.06 (1 H, m), 1.71 (3 H, d, J=6.97 Hz), 1.06 - 1.12 (2 H, m), 0.78 - 0.83 (2 H, m).
P25	N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-3-(トリフルオロメチ ル)-5-[2-(トリフルオロプロ ピル)シクロプロピル]ベンズア ミド		0.99	471	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.26 - 1.33 (m, 2 H) 1.42 - 1.57 (m, 1 H) 1.61 (s, 1 H) 1.72 (d, J=6.97 Hz, 3 H) 1.88 - 1.98 (m, 1 H) 2.45 - 2.51 (m, 1 H) 6.42 - 6.50 (m, 1 H) 7.41 - 7.53 (m, 3 H) 7.78 (s, 1 H) 7.90 (s, 1 H) 8.07 (s, 1 H) 8.94 (d, J=4.77 Hz, 2 H)

10

20

30

40

【表 1 2 - 1 0】

P26	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-3-(トリフルオロメチ ル)-5-(トリフルオロメチルス ルフィニル)ベンズアミド		0.98	533	1	¹ H NMR (600 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm - 0.21 - -0.10 (m, 1 H) -0.10 - 0.00 (m, 1 H) 0.30 - 0.38 (m, 2 H) 0.70 - 0.79 (m, 1 H) 1.80 (dd, J=6.90, 1.27 Hz, 3 H) 3.07 - 3.18 (m, 1 H) 3.18 - 3.30 (m, 1 H) 6.26 (quin, J=7.04 Hz, 1 H) 7.60 (td, J=4.86, 1.91 Hz, 1 H) 7.81 (s, 1 H) 7.93 (br d, J=4.54 Hz, 1 H) 8.15 (d, J=2.18 Hz, 1 H) 8.22 (br d, J=5.45 Hz, 1 H) 8.88 (d, J=5.08 Hz, 2 H)
P27	6-クロロ-4-(1-シアノ-1-メ チル-エチル)-N-(シクロプロ ピルメチル)-N-[1-(2-ピリミ ジン-2-イル-1,2,4-トリアゾ ール-3-イル)エチル]ピリジ ン-2-カルボキسامイド		0.90	451	1	
P28	4-クロロ-6-(1-シアノ-1-メ チル-エチル)-N-(シクロプロ ピルメチル)-N-[1-(2-ピリミ ジン-2-イル-1,2,4-トリアゾ ール-3-イル)エチル]ピリジ ン-2-カルボキسامイド		0.91	451	1	

10

20

30

40

【表 1 2 - 1 1】

P29	4-クロロ-6-(1-シアノシクロ プロピル)-N-(シクロプロピ ルメチル)-N-[1-(2-ピリミジ ン-2-イル-1,2,4-トリアゾ ール-3-イル)エチル]ピリジン- 2-カルボキサミド		0.88	449	1	
P30	N-(シクロプロピルメチル)- 3-(ジフルオロメチルスルホ ニル)-N-[1-(2-ピリミジン- 2-イル-1,2,4-トリアゾール- 3-イル)エチル]-5-(トリフル オロメチル)ベンズアミド		1.48	531	1	
P31	6-(1-シアノ-1-メチル-エチ ル)-N-(シクロプロピルメチ ル)-N-[1-(2-ピリミジン-2- イル-1,2,4-トリアゾール-3- イル)エチル]-4-(トリフルオ ロメチル)ピリジン-2-カルボ キサミド		0.95	485	1	

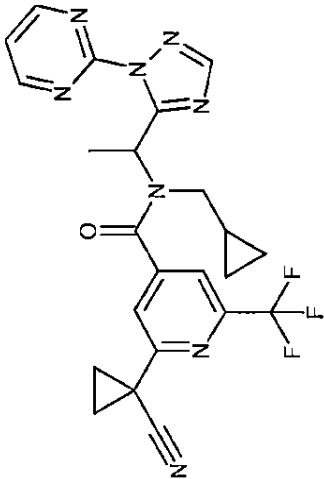
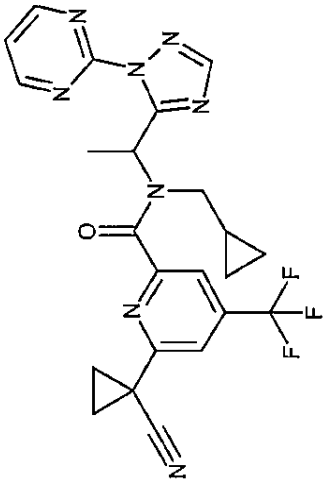
10

20

30

40

【表 1 2 - 1 2】

P32	2-(1-シアノシクロプロピル)- N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-6-(トリフルオロメチ ル)ピリジン-4-カルボキサミ ド		0.96	483	1	
P33	6-(1-シアノシクロプロピル)- N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-4-(トリフルオロメチ ル)ピリジン-2-カルボキサミ ド		0.94	483	1	

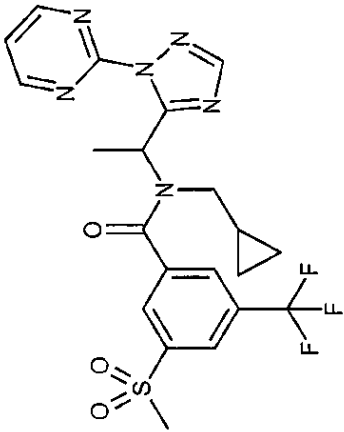
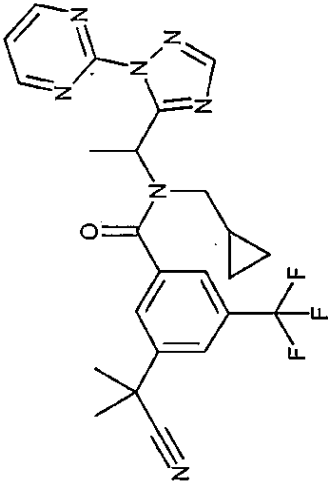
10

20

30

40

【表 1 2 - 1 3】

P34	N-(シクロプロピルメチル)- 3-メチルスルホニル-N-[1- (2-ピリミジン-2-イル-1,2,4- トリアゾール-3-イル)エチ ル]-5-(トリフルオロメチル) ベンズアミド		0.85	495	1	
P35	3-(1-シアノ-1-メチル-エチ ル)-N-(シクロプロピルメチ ル)-N-[1-(2-ピリミジン-2- イル-1,2,4-トリアゾール-3- イル)エチル]-5-(トリフルオ ロメチル)ベンズアミド		0.96	484	1	

10

20

30

40

【表 1 2 - 1 4】

P36	N-(シクロプロピルメチル)-3-(4-フルオロフェニル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.09	511	1	
P37	4-[シクロプロピル(ジフルオロ)メチル]-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]ベンズアミド		0.96	439	1	
P38	N-(シクロプロピルメチル)-3-(1-メチルシクロプロピル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.07	471	1	NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm - 0.05 - 0.03 (m, 1 H) 0.08 (br dd, J=8.9, 4.4 Hz, 1 H) 0.45 (ddt, J=12.7, 8.4, 4.3, 4.3 Hz, 2 H) 0.84 - 0.91 (m, 1 H) 0.92 - 0.98 (m, 4 H) 1.48 (s, 3 H) 1.88 (d, J=7.1 Hz, 3 H) 3.19 (br dd, J=15.0, 6.1 Hz, 1 H) 3.34 (br dd, J=14.9, 6.0 Hz, 1 H) 6.34 (q, J=6.9 Hz, 1 H) 7.25 (s, 1 H) 7.28 (s, 1 H) 7.59 (s, 1 H) 7.69 (t, J=4.8 Hz, 1 H) 8.23 (s, 1 H) 8.95 (d, J=4.9 Hz, 2 H).

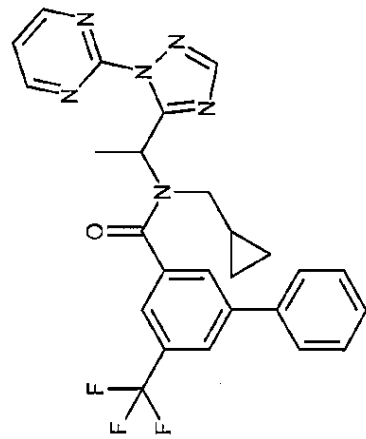
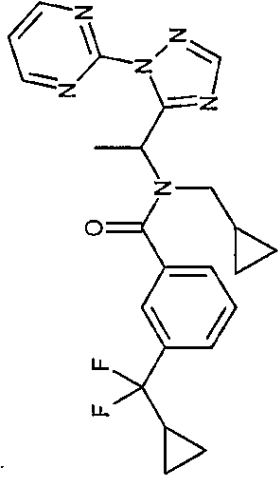
10

20

30

40

【表 1 2 - 1 5】

P39	N-(シクロプロピルメチル)- 3-フェニル-N-[1-(2-ピリミ ジン-2-イル-1,2,4-トリアゾ ール-3-イル)エチル]-5-(ト リフルオロメチル)ベンズアミ ド		1.08	493	1	
P40	3-[シクロプロピル(ジフルオ ロ)メチル]-N-(シクロプロピ ルメチル)-N-[1-(2-ピリミジ ン-2-イル-1,2,4-トリアゾー ール-3-イル)エチル]ベンズア ミド		0.95	439	1	

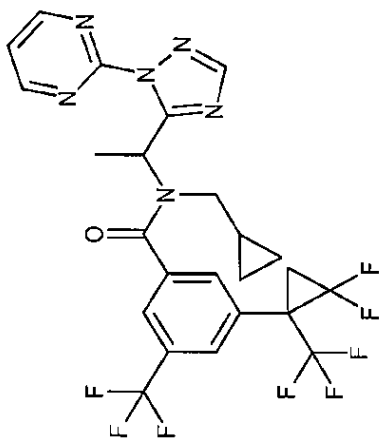
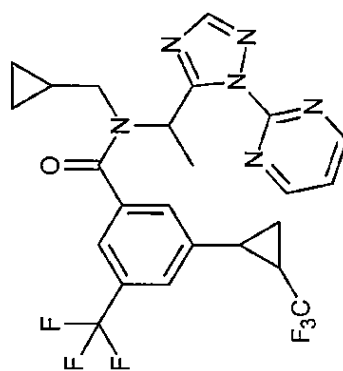
10

20

30

40

【表 1 2 - 1 6】

P41	N-(シクロプロピルメチル)- 3-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフ ルオロメチル)シクロプロピ ル]-N-[1-(2-ピリミジン-2- イル)-1,2,4-トリアゾール-3- イル]エチル]-5-(トリフルオ ロメチル)ベンズアミド		1.06	561	1	
P42	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-3-(トリフルオロメチ ル)-5-[2-(トリフルオロメチ ル)シクロプロピル]ベンズア ミド		1.07	525	1	

¹H NMR (600 MHz, DMSO-d₆) δ ppm -
0.19 - -0.06 (m, 1 H) -0.04 - 0.06 (m, 1
H) 0.27 - 0.41 (m, 2 H) 0.78 (br s, 1 H)
1.29 - 1.35 (m, 1 H) 1.37 - 1.47 (m, 1 H)
1.77 (d, J=6.9 Hz, 3 H) 2.23 - 2.32 (m, 1
H) 2.53 - 2.58 (m, 1 H) 3.12 (br dd,
J=15.1, 6.2 Hz, 1 H) 3.26 (br dd, J=14.8,
5.7 Hz, 1 H) 6.22 (q, J=6.7 Hz, 1H) 7.19
(s, 1 H) 7.23 (s, 1 H) 7.54 (s, 1 H) 7.57
(td, J=4.7, 3.2 Hz, 1 H) 8.12 (s, 1 H) 8.84
(d, J=4.7 Hz, 2 H)

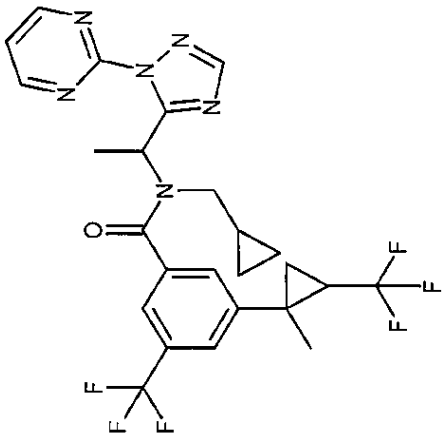
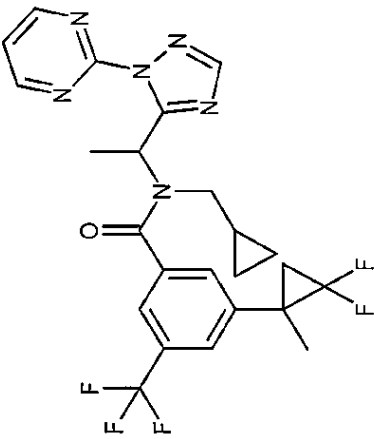
10

20

30

40

【表 1 2 - 1 7】

P43	N-(シクロプロピルメチル)- 3-[1-メチル-2-(トリフルオロ メチル)シクロプロピル]-N- [1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-5-(トリフルオロメチ ル)ベンズアミド		1.10	539	1	
P44	N-(シクロプロピルメチル)- 3-(2,2-ジフルオロ-1-メチル -シクロプロピル)-N-[1-(2- ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリ アゾール-3-イル)エチル]- 5-(トリフルオロメチル)ベン ズアミド		1.04	507	1	

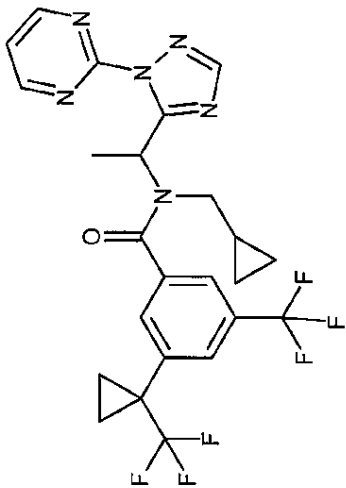
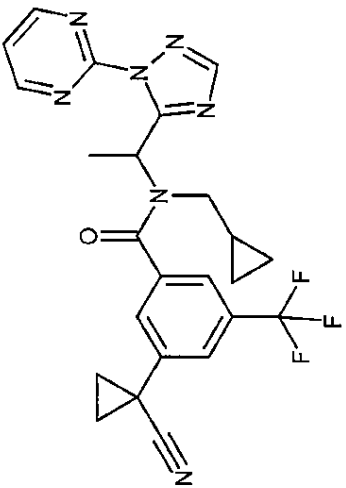
10

20

30

40

【表 1 2 - 1 8】

P45	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-3-(トリフルオロメチ ル)-5-[1-(トリフルオロメチ ル)シクロプロピル]ベンズア ミド		1.09	525	1	
P46	3-(1-シアノシクロプロピル)- N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-5-(トリフルオロメチ ル)ベンズアミド		0.94	482	1	

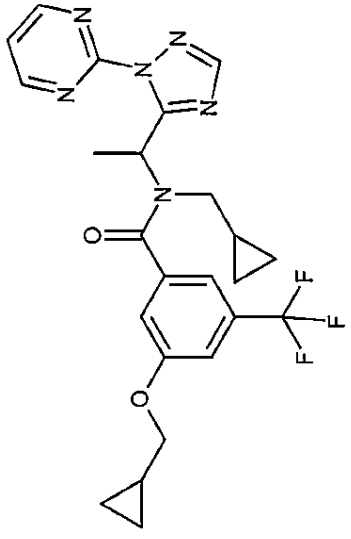
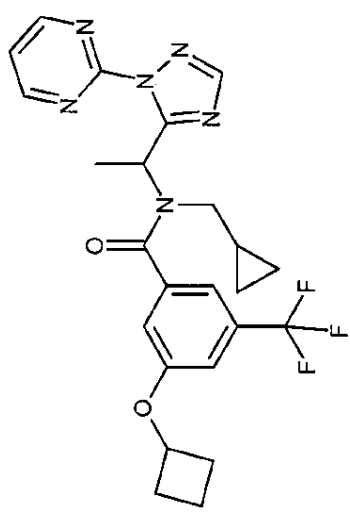
10

20

30

40

【表 1 2 - 1 9】

P47	3-(シクロプロポピルメトキシ)- N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-5-(トリフルオロメチ ル)ベンズアミド		1.07	486	1	
P48	3-(シクロプロトキシ)-N-(シク ロプロピルメチル)-N-[1-(2- ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリ アゾール-3-イル)エチル]- 5-(トリフルオロメチル)ベン ズアミド		1.08	487	1	

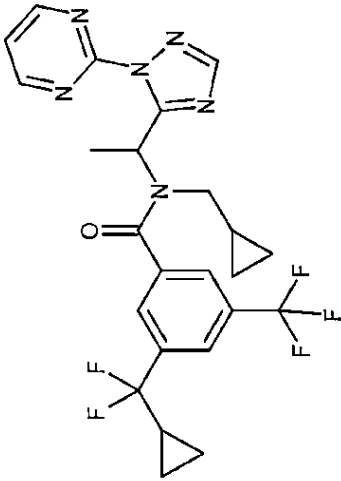
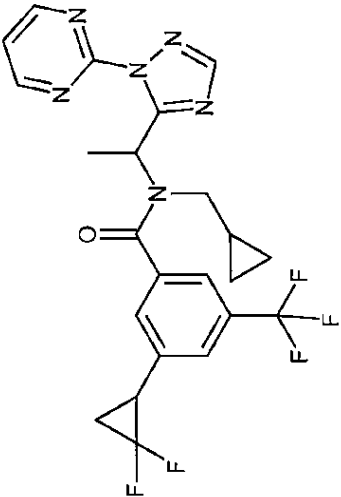
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 0】

P49	3-[シクロプロピル(ジフルオロメチル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.06	507	1	
P50	N-(シクロプロピルメチル)-3-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		0.99	493	1	

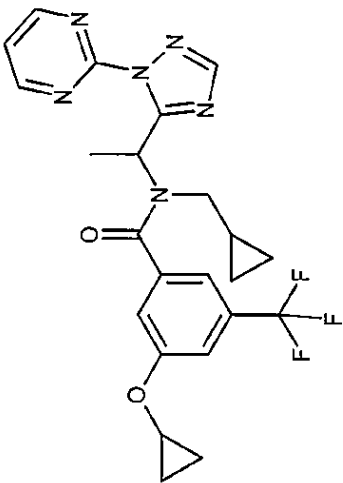
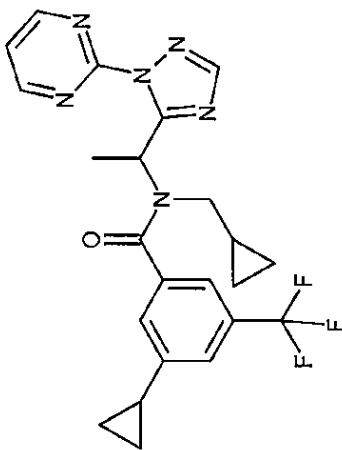
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 1】

P51	3-(シクロプロポキシ)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.02	473	1	
P52	3-(シクロプロピル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.02	457	1	

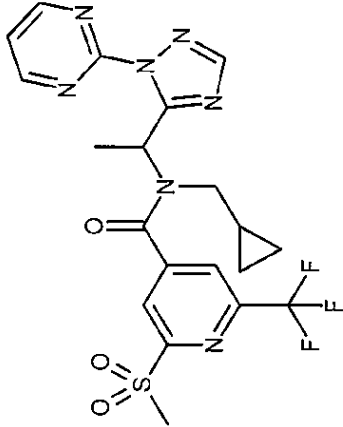
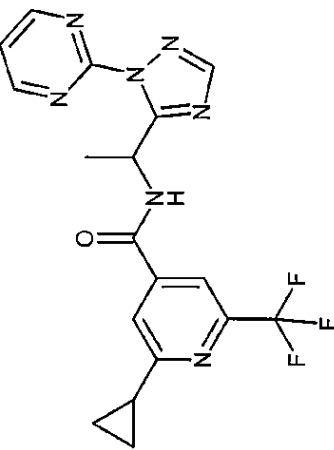
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 2】

P53	N-(シクロプロピルメチル)- 2-メチルスルホニル-N-[1- (2-ピリミジン-2-イル-1,2,4- トリアゾール-3-イル)エチ ル]-6-(トリフルオロメチル) ピリジン-4-カルボキサミド		0.85	496	1	¹ H NMR (600 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm - 0.11 - 0.07 (m, 2 H) 0.39 (ddt, J=12.97, 8.65, 4.45, 4.45 Hz, 2 H) 0.76 - 0.86 (m, 1 H) 1.80 (d, J=6.90 Hz, 3 H) 3.18 (br s, 2 H) 3.34 (s, 3 H) 6.15 - 6.27 (m, 1 H) 7.62 (s, 1 H) 7.96 (s, 1 H) 8.01 - 8.05 (m, 1 H) 8.14 - 8.17 (m, 1 H) 8.87 - 8.94 (m, 2 H)
P54	2-シクロプロピル-N-[1-(2- ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリ アゾール-3-イル)エチル]- 6-(トリフルオロメチル)ピリジ ン-4-カルボキサミド		0.92	404	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.9 (d, J=5.13 Hz, 2 H) 8.1 (s, 1 H) 7.7 - 7.8 (m, 3 H) 7.4 (t, J=4.95 Hz, 1 H) 6.4 - 6.6 (m, 1 H) 2.1 - 2.2 (m, 1 H) 1.7 (d, J=6.60 Hz, 3 H) 1.2 - 1.3 (m, 3 H) 1.1 - 1.2 (m, 4 H).

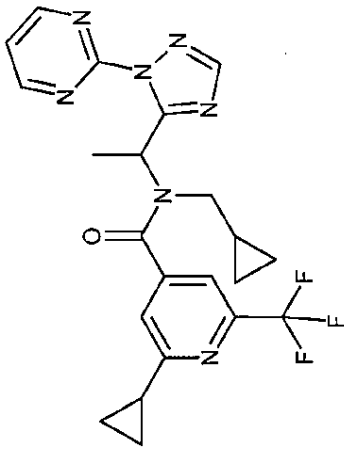
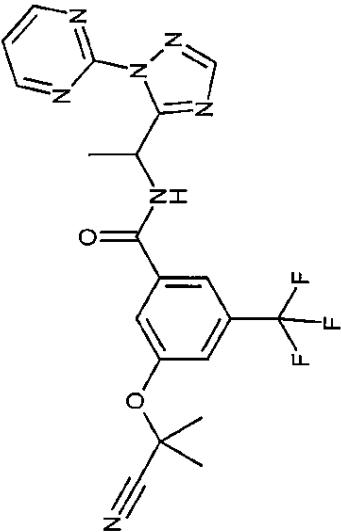
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 3】

P55	2-シクロプロピル-N-(シクロ プロピルメチル)-N-[1-(2-ピ リミジン-2-イル-1,2,4-トリア ゾール-3-イル)エチル]-6- (トリフルオロメチル)ピリジン -4-カルボキサミド		1.01	458	1	
P56	3-(1-シアノ-1-メチル-エト キシ)-N-[1-(2-ピリミジン- 2-イル-1,2,4-トリアゾール- 3-イル)エチル]-5-(トリフル オロメチル)ベンズアミド		0.89	446	1	188 - 190 / 1H NMR (400 MHz, DMSO) δ ppm 1.65 (d, J=6.97Hz, 3 H) 1.74 (s, 6 H) 6.01 (t, J=6.97 Hz, 1 H) 7.55 - 7.70 (m, 2 H) 7.84 (s, 1 H) 8.00 (s, 1 H) 8.18 (s, 1 H) 8.99 (d, J=5.14 Hz, 2 H) 9.39 (d, J=7.34 Hz, 1 H)

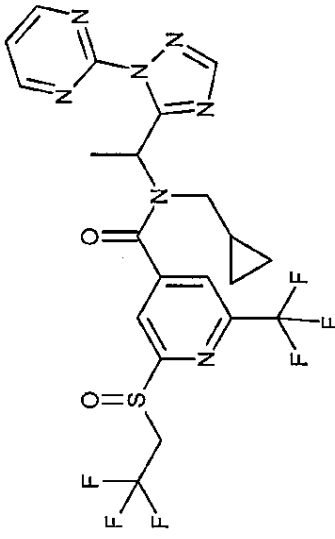
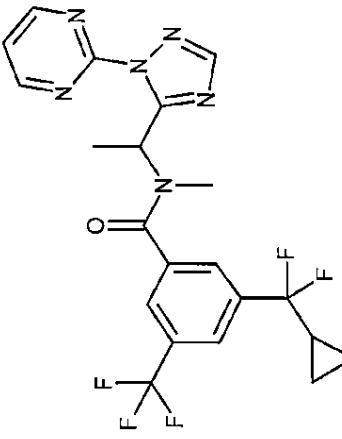
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 4】

P57	N-(シクロプロピルメチル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル) エチル]-2-(2,2,2-トリフルオ ロエチルスルフィニル)-6-(ト リフルオロメチル)ピリジン- 4-カルボキサミド		0.95	548	1	¹ H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm - 0.20 - 0.12 (m, 2 H) 0.21 - 0.52 (m, 2 H) 0.77 (br s, 1 H) 1.78 (d, J=6.90 Hz, 3 H) 3.01 - 3.40 (m, 2 H) 4.00 - 4.15 (m, 1 H) 4.18 - 4.30 (m, 1 H) 6.18 (br d, J=1.09 Hz, 1 H) 7.60 (t, J=4.81 Hz, 1 H) 7.76 - 7.85 (m, 1 H) 7.95 (d, J=13.62 Hz, 1 H) 8.14 (s, 1 H) 8.89 (t, J=4.18 Hz, 2 H)
P58	3-[シクロプロピル(ジフルオ ロ)メチル]-N-メチル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4- トリアゾール-3-イル)エチ ル]-5-(トリフルオロメチル) ベンズアミド		0.97	467	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl3) δ ppm 1.43 - 1.90 (m, 7 H) 2.93 - 3.43 (m, 4 H) 6.62 - 6.81 (m, 1 H) 7.70 - 7.84 (m, 2 H) 7.88 - 8.00 (m, 1 H) 8.02 - 8.30 (m, 3 H) 8.65 - 8.85 (m, 1 H)

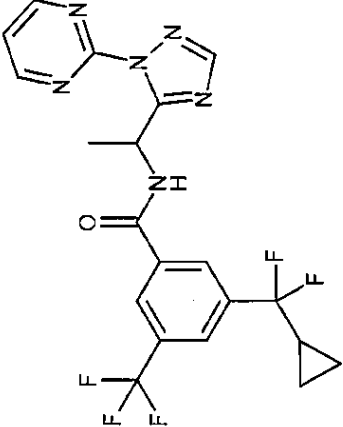
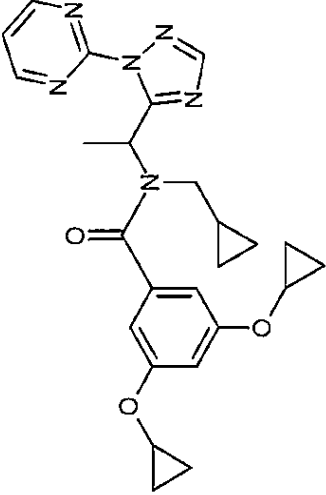
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 5】

P59	3-[シクロプロピル(ジフルオロ)メチル]-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.09	453	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.95 (2 H, d, J=4.77 Hz), 8.20 (1 H, s), 8.16 (1 H, s), 8.09 (1 H, s), 7.95 (1 H, s), 7.57 (1 H, d, J=7.70 Hz), 7.44 (1 H, t, J=4.77 Hz), 6.45 - 6.53 (1 H, m), 1.74 (3 H, d, J=6.97 Hz), 1.45 - 1.60 (1 H, m), 0.82 - 0.88 (2 H, m), 0.77 - 0.80 (2 H, m).
P60	3,5-ビス(シクロプロポキシ)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]ベンズアミド		0.99	461	1	

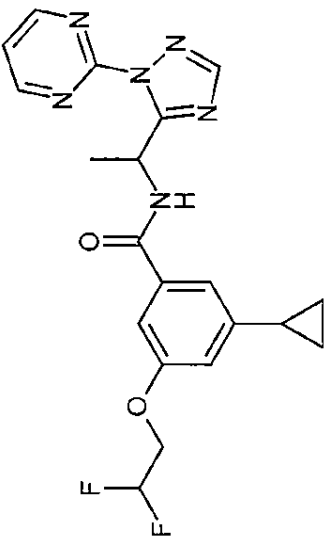
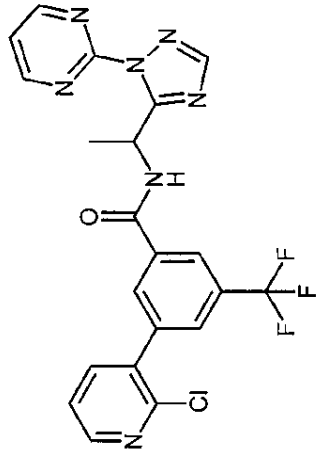
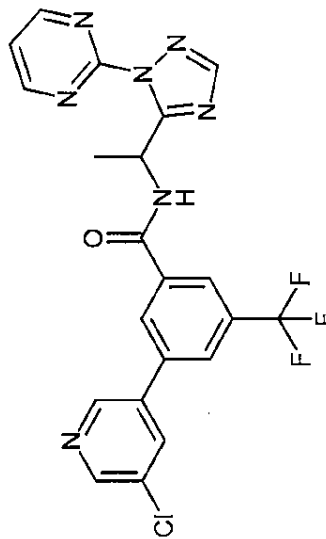
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 6】

P61	3-(シクロプロピル-5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]ベンズアミド		0.88	415	1	128-132/ 1H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 0.66 - 0.78 (m, 2 H) 0.87 - 1.12 (m, 2 H) 1.69 (d, J=6.97 Hz, 3 H) 1.91 (tt, J=8.34, 5.04 Hz, 1 H) 4.09 - 4.24 (m, 2 H) 5.90 - 6.24 (m, 1 H) 6.41 - 6.49 (m, 1 H) 6.73 - 6.77 (m, 1 H) 7.13 - 7.19 (m, 2 H) 7.40 (t, J=4.95 Hz, 1 H) 7.43 - 7.51 (m, 1 H) 8.05 (s, 1 H) 8.91 (d, J=4.77 Hz, 2 H)
P62	3-(2-クロロ-3-ピリジジル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		0.91	474	1	
P63	3-(5-クロロ-3-ピリジジル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		0.95	474	1	

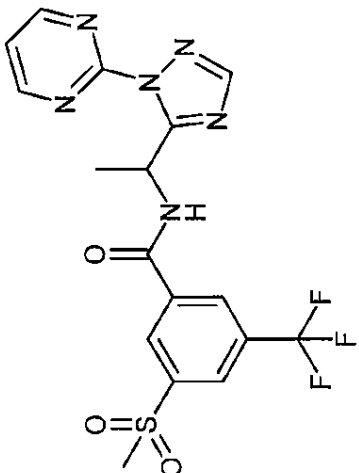
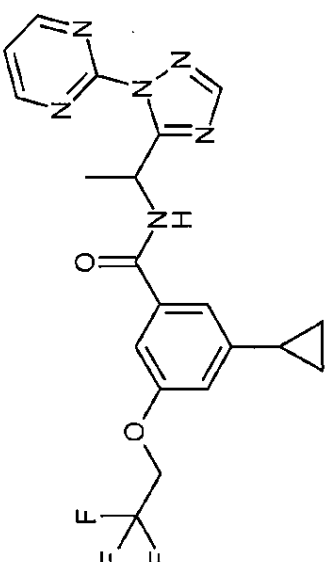
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 7】

P64	3-メチルスルホニル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		0.77	441	1	200-210	
P65	3-シクロプロピル-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ベンズアミド		0.94	433	1		

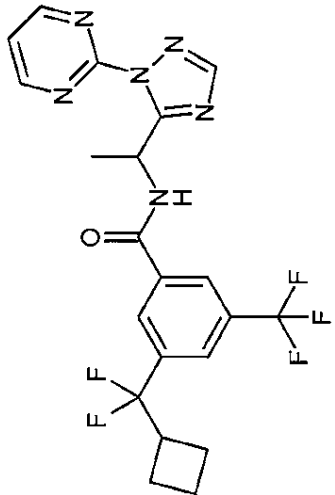
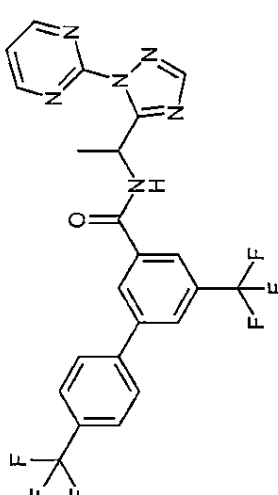
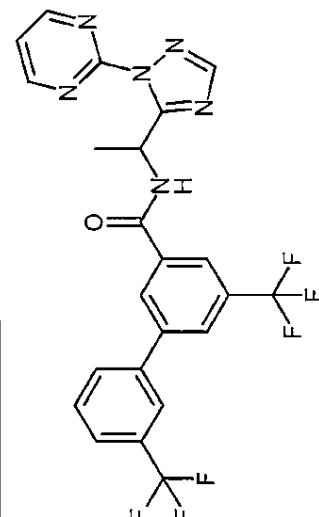
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 8】

P66	3-[シクロブチル(ジフルオロメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド]		1.06	467	1	
P67	N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド		1.11	507	1	
P68	N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド		1.10	507	1	

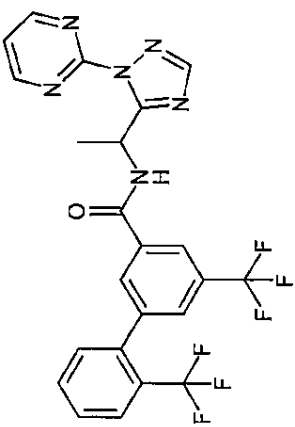
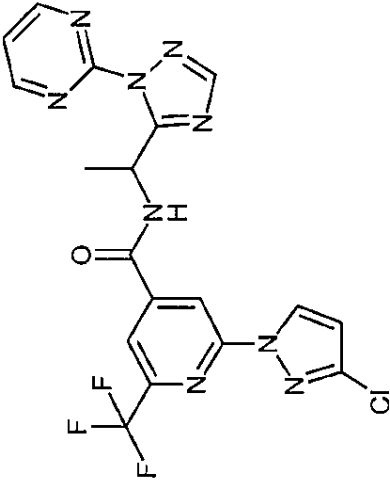
10

20

30

40

【表 1 2 - 2 9】

P69	N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド		1.07	507	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.73 (d, J=6.60 Hz, 3 H) 6.43 - 6.53 (m, 1 H) 7.35 - 7.39 (m, 1 H) 7.40 - 7.44 (m, 1 H) 7.47 - 7.54 (m, 1 H) 7.52 (br d, J=8.07 Hz, 1 H) 7.55 - 7.61 (m, 1 H) 7.62 - 7.68 (m, 1 H) 7.77 (s, 1 H) 7.82 (d, J=7.34 Hz, 1 H) 7.97 (s, 1 H) 8.05 - 8.08 (m, 1 H) 8.15 (s, 1 H) 8.94 (d, J=4.77 Hz, 2 H).
P70	2-(3-クロロピラゾール-1-イル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボキサミド		0.97	464	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.75 (d, J=6.6 Hz, 3 H) 6.43 - 6.53 (m, 2 H) 7.46 (t, J=4.8 Hz, 1 H) 7.86 - 7.93 (m, 1 H) 8.02 (d, J=1.1 Hz, 1 H) 8.09 (s, 1 H) 8.45 (d, J=0.7 Hz, 1 H) 8.60 (d, J=2.9 Hz, 1 H) 8.90 - 9.07 (m, 2 H)

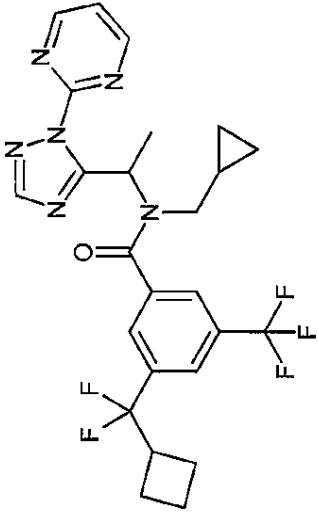
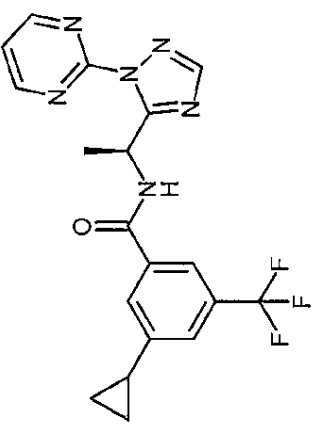
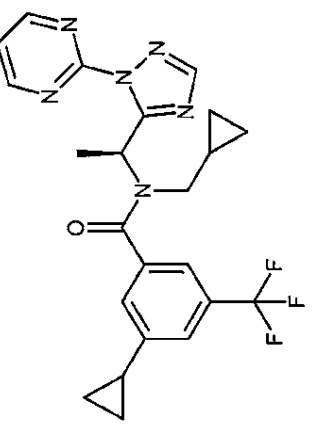
10

20

30

40

【表 1 2 - 3 0】

P71	3-[シクロプロピル(ジフルオロメチル)-N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.14	521	1		
P72	3-シクロプロピル-N-[(1S)-1-(2-ピリミジン-2-イル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		0.93	403	1		¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.94 - 2.01 (m, 2 H) 2.21 - 2.30 (m, 2 H) 2.90 (d, J=6.75 Hz, 3 H) 3.14 - 3.24 (m, 1 H) 7.62 - 7.67 (m, 1 H) 8.58 - 8.62 (m, 2 H) 8.68 (br d, J=7.92 Hz, 1 H) 8.89 (s, 1 H) 8.99 (s, 1 H) 9.26 (s, 1 H) 10.11 (d, J=4.70 Hz, 2 H)
P73	3-シクロプロピル-N-(シクロプロピルメチル)-N-[(1S)-1-(2-ピリミジン-2-イル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.02	457	1		

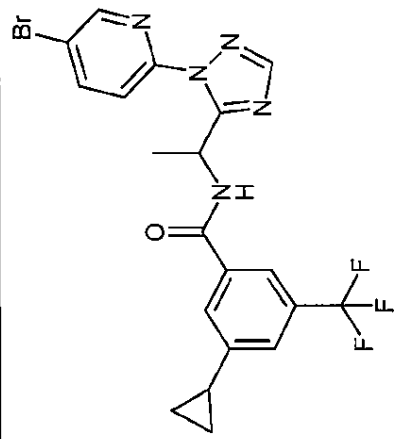
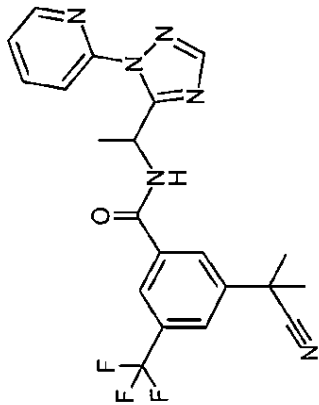
10

20

30

40

【表 1 2 - 3 1】

P74	N-[1-[2-(6-ブromo-2-ピリジ ル)-1,2,4-トリアゾール-3-イ ル]エチル]-3-シクロプロピ ル-5-(トリフルオロメチル)ベ ンズアミド		5.24	482	4		190-195/ 1H NMR (DMSO-d6, 400 MHz): δ 9.20 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.30 (dd, J = 6.4 Hz, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.81 (m, 2H), 7.62 (d, J = 19.2 Hz, 2H), 5.99 - 5.92 (m, 1H), 2.12-2.06 (m, 1H), 1.62 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 1.05 - 1.01 (m, 2H), 1.01 - 0.78 (m, 2H).
P75	3-(1-シアノ-1-メチル-エチ ル)-N-[1-[2-(2-ピリジル)- 1,2,4-トリアゾール-3-イル] エチル]-5-(トリフルオロメチ ル)ベンズアミド		4.84	429	4		130-135

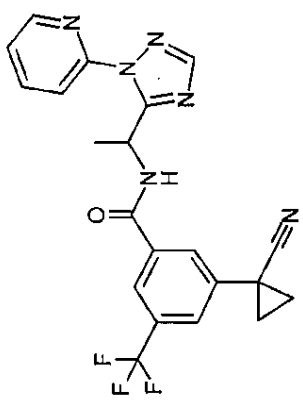
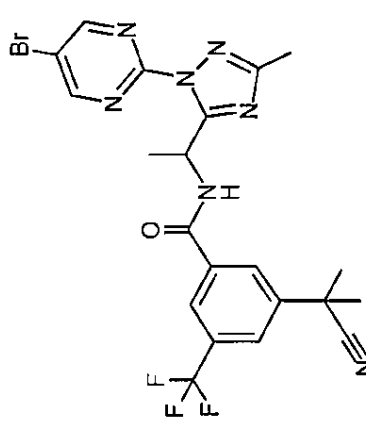
10

20

30

40

【表 1 2 - 3 2】

P76	3-(1-シアノシクロプロピル)- N-[1-[2-(2-ピリジル)- 1,2,4-トリアゾール-3-イル] エチル]-5-(トリフルオロメチ ル)ベンズアミド		7.77	427	4	175-178
P77	N-[1-[2-(5-ブロモピリミジン -2-イル)-5-メチル-1,2,4-ト リアゾール-3-イル]エチル]- 3-(1-シアノ-1-メチル-エチ ル)-5-(トリフルオロメチル) ベンズアミド		4.78	522	4	195-200/ 1H NMR (DMSO-d6, 400 MHz): δ 9.40 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 9.13 (s, 2H), 8.17 (d, J = 22.0 Hz, 2H), 7.98 (s, 1H), 6.0 - 5.96 (t, 1H), 2.33 (s, 3H), 1.75 (s, 6H), 1.63 (d, J = 6.8 Hz, 3H).

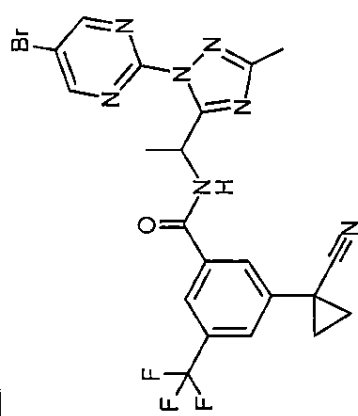
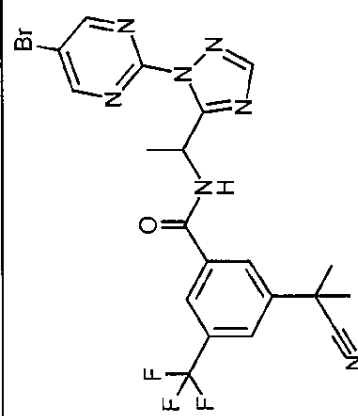
10

20

30

40

【表 1 2 - 3 3】

P78	N-[1-[2-(5-ブromoピリミジン-2-イル)-5-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		7.77	520	4	190-193
P79	N-[1-[2-(5-ブromoピリミジン-2-イル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		4.84	508	4	145-150

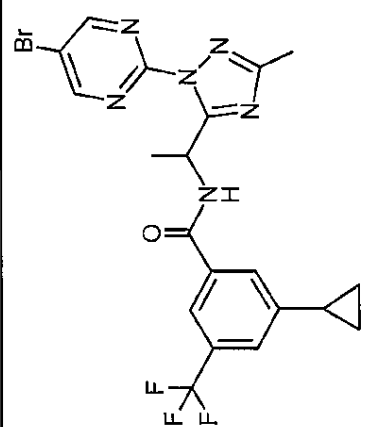
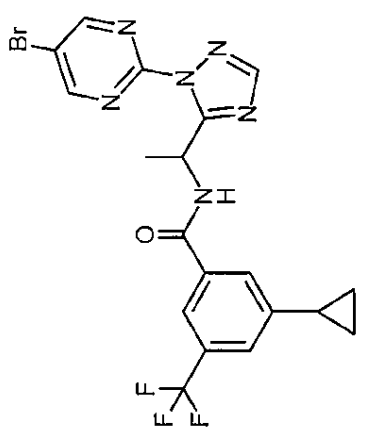
10

20

30

40

【表 1 2 - 3 4】

P80	N-[1-[2-(5-ブロモピリミジン-2-イル)-5-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		5.03	495	4	200-205
P81	N-[1-[2-(5-ブロモピリミジン-2-イル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		4.97	481	4	155-160

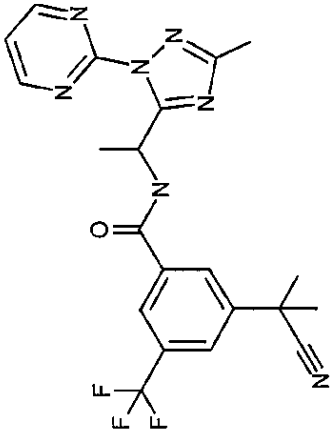
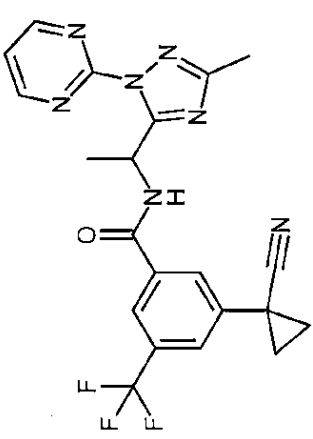
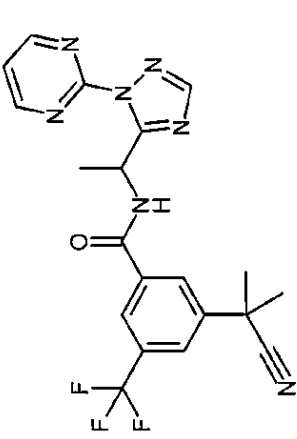
10

20

30

40

【表 1 2 - 3 5】

P82	3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-N-[1-(5-メチル-2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		4.73	444	4	180-185
P83	3-(1-シアノシクロプロピル)-N-[1-(5-メチル-2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		7.63	442	4	115-120
P84	3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		4.70	430	4	145-150

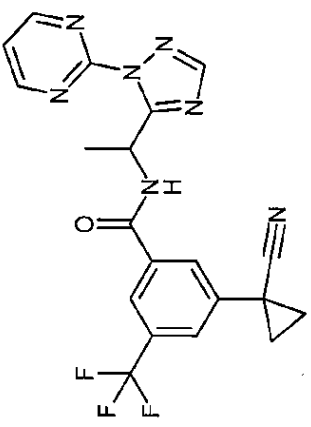
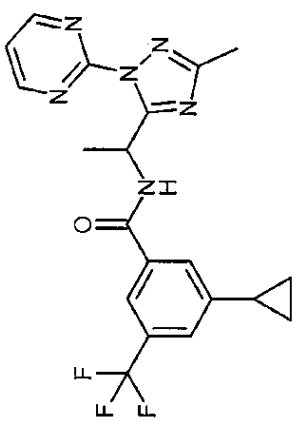
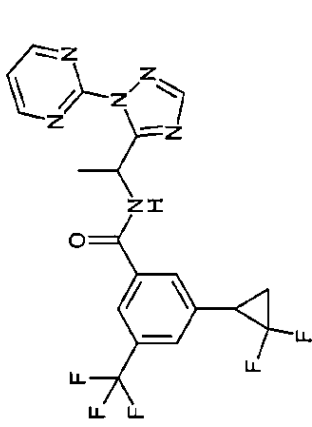
10

20

30

40

【表 1 2 - 3 6】

P85	3-(1-シアノシクロプロピル)- N-[1-(2-ピリミジン-2-イル- 1,2,4-トリアゾール-3-イル)- エチル]-5-(トリフルオロメチ ル)ベンズアミド		7.63	428	4	100-105	
P86	3-シクロプロピル-N-[1-(5- メチル-2-ピリミジン-2-イル -1,2,4-トリアゾール-3-イル)- エチル]-5-(トリフルオロメチ ル)ベンズアミド		7.11	417	4	75-80	
P87	3-(2,2-ジフルオロシクロプロ ピル)-N-[1-(2-ピリミジン- 2-イル-1,2,4-トリアゾール- 3-イル)エチル]-5-(トリフル オロメチル)ベンズアミド		7.71	439	4	123-125	

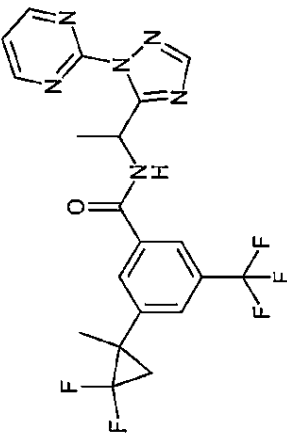
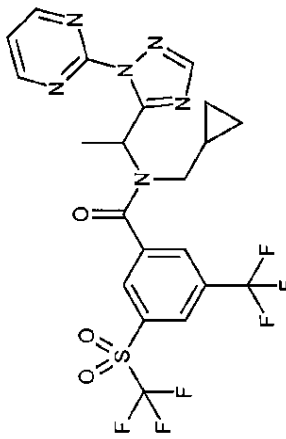
10

20

30

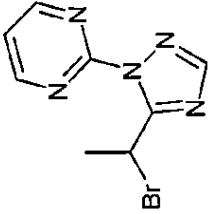
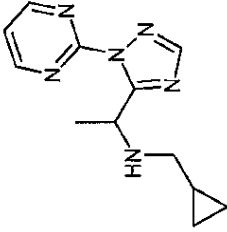
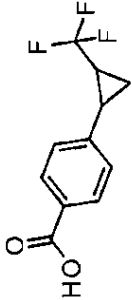
40

【表 1 2 - 3 7】

P88	3-(2,2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		7.74	453	4	166-168
P89	N-(シクロプロピルメチル)-N-[1-(2-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)ベンズアミド		1.03	549	1	¹ H NMR (600 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm -0.19 - -0.10 (m, 1 H) -0.06 (br dd, J=8.81, 4.27 Hz, 1 H) 0.29 - 0.39 (m, 2 H) 0.71 - 0.78 (m, 1 H) 1.78 (d, J=6.90 Hz, 3 H) 3.13 (br dd, J=15.26, 6.18 Hz, 1 H) 3.23 (br dd, J=15.26, 5.99 Hz, 1 H) 6.19 - 6.27 (m, 1 H) 7.59 (t, J=4.90 Hz, 1 H) 8.08 - 8.20 (m, 3 H) 8.33 (s, 1 H) 8.87 (d, J=4.90 Hz, 2 H)

【表 1 3 - 1】

表 1: 中間体の表

項目	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (実測値)	方法	NMR
I1	2-[5-(1-プロモエチル)- 1,2,4-トリアゾール-1-イ ル]ピリミジン		0.64	255	1	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃ , ppm): • = 8.90 (d, J=4.8 Hz, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.40 (t, J=4.8 Hz, 1H), 6.41 (q, J=6.9 Hz, 1H), 2.24 (d, J=6.9 Hz, 3H)
I2	N-(シクロプロピルメチ ル)-1-(2-ピリミジン-2-イ ル-1,2,4-トリアゾール-3- イル)エタンアミン		0.19	245	1	¹ H-NMR (400 MHz, CDCl ₃): • = 8.88 (d, J=4.8 Hz, 2H), 8.05-8.05 (m, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.37 (t, J=4.8 Hz, 1H), 4.96 (q, J=7.0 Hz, 1H), 2.55-2.33 (m, 2H), 2.22 (dd, J=7.5, 11.6 Hz, 1H), 1.54 (d, J=7.0 Hz, 3H), 0.96-0.81 (m, 1H), 0.43-0.34 (m, 2H), 0.07-0.09 (m, 2H)
I3	4-[2-(トリフルオロメチル) シクロプロピル]安息香酸		0.90	231	1	

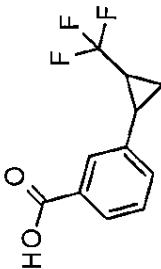
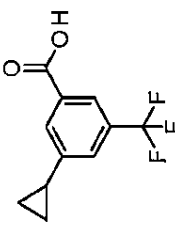
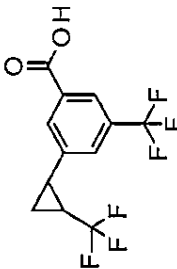
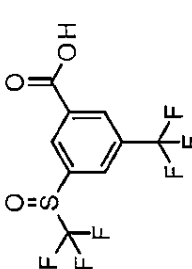
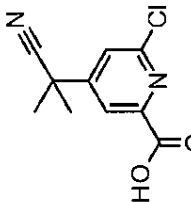
10

20

30

40

【表 1 3 - 2】

14	3-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸		0.91	229 (M-H+)	1	
15	3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		0.96	229 (M-H+)	1	¹ H NMR (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ 13.44 (s, 1H), 7.90 (d, J=21.6 Hz, 2H), 7.69 (s, 1H), 2.20 - 2.13 (m, 1H), 1.08 - 1.03 (m, 2H), 0.83 - 0.79 (m, 2H).
16	3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸		1.00	297 (M-H+)	1	
17	3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルフィニル)安息香酸		0.89	307	1	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm 8.47 (s, 1 H) 8.51 (s, 1 H) 8.64 (s, 1 H) 14.06 (br s, 1 H)
18	6-クロロ-4-(1-シアノ-1-メチル-エチル)ピリジン-2-カルボキシ酸		0.66	225	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.78 (s, 6 H) 7.69 (s, 1 H) 8.18 (d, J=1.47 Hz, 1 H)

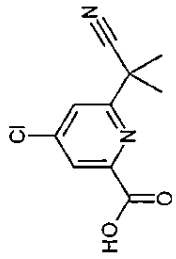
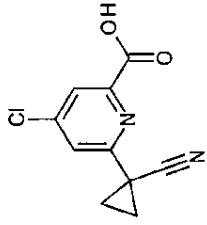
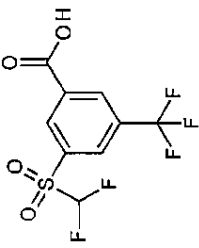
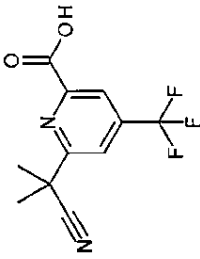
10

20

30

40

【表 1 3 - 3】

19	4-クロロ-6-(1-シアノ-1-メチル-エチル)ピリジン-2-カルボン酸		0.75	225	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.82 (s, 6 H) 7.84 (d, J=1.83 Hz, 1 H) 8.20 (d, J=1.83 Hz, 1 H)
10	4-クロロ-6-(1-シアノシクロプロピル)ピリジン-2-カルボン酸		0.61	223	1	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm 7.50 (t, 1 H) 8.48 (s, 1 H) 8.59 (m, 2 H) 14.28 (br s, 1 H)
11	3-(ジフルオロメチルスルホニル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		1.21 303 (M-H ⁺)		1	
12	6-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボン酸		0.80 257 (M-H ⁺)		1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ -d) δ ppm 8.46 (1 H, s), 8.06 (1 H, s), 1.88 (6 H, s)

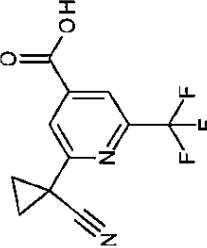
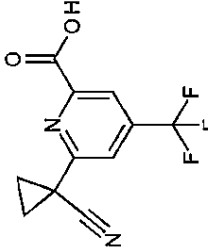
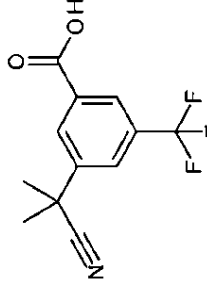
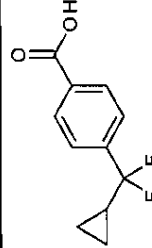
10

20

30

40

【表 1 3 - 4】

I13	2-(1-シアノシクロプロピル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸					¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm: 1.76 - 1.83 (m, 2 H) 1.96 - 2.03 (m, 2 H) 8.07 (d, J = 1.10 Hz, 1 H) 8.17 (s, 1 H) 13.35 - 15.45 (m, 1 H).
I14	6-(1-シアノシクロプロピル)-4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボン酸		0.79	257	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 9.74 - 10.27 (1 H, br s), 8.37 (1 H, m), 8.17 (1 H, m), 1.97 - 2.04 (2 H, m), 1.88 - 1.96 (2 H, m).
I15	3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸					¹ H NMR (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ 13.6 (brs, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.14 (d, J = 9.2 Hz, 2H), 1.78 (s, 6H).
I16	4-[シクロプロピル(ジフルオロ)メチル]安息香酸		0.88	211 (M-H ⁺)	1	

10

20

30

40

【表 1 3 - 5】

117	3-(1-メチルシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		1.02	243	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.17 (1 H, m), 8.16 (1 H, m), 7.74 (1 H, m), 1.48 (3 H, s), 0.91 ~ 0.98 (2 H, m), 0.79 ~ 0.90 (2 H, m).
118	3-[シクロプロピル(ジフルオロメチル)安息香酸		0.87	211 (M-H ⁺)	1	
119	3-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		1.01	333 (M-H ⁺)	1	
120	3-[1-メチル-2-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		1.05	311 (M-H ⁺)	1	

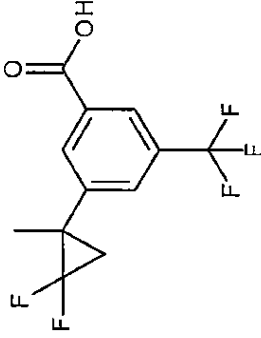
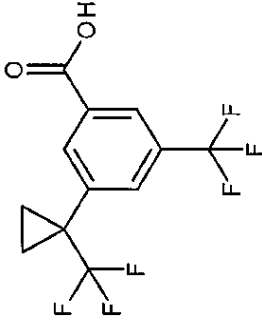
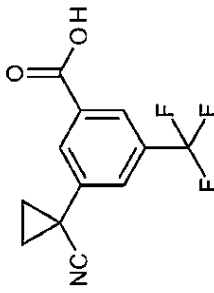
10

20

30

40

【表 1 3 - 6】

121	3-(2,2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		0.98 279 (M-H ⁺)	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.31 (1 H, s), 8.26 (1 H, s), 7.83 (1 H, s), 1.75 - 1.81 (1 H, m), 1.60 (3 H, m), 0.54 - 1.60 (1 H, m).
122	3-(トリフルオロメチル)-5-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]安息香酸		1.03 297 (M-H ⁺)	1	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.10 - 1.18 (m, 2 H) 1.21 - 1.35 (m, 1 H) 1.47 - 1.54 (m, 2 H) 7.98 (s, 1 H) 8.34 - 8.42 (m, 2 H)
123	3-(1-シアノシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		0.85 254 (M-H ⁺)	1	

10

20

30

40

【表 1 3 - 7】

124	3-(シクロプロピルメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		1.00	259 (M-H ⁺)	1	
125	3-(シクロブトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		1.03	261	1	
126	3-[3-(シクロプロピル)オロメチル]-5-(トリフルオロメチル)安息香酸					¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃ , ppm): δ = 10.70 - 12.60 (1 H, br s), 8.48 (1 H, s), 8.45 (1 H, s), 8.05 (1 H, m), 1.46 - 1.58 (1 H, m), 0.80 - 0.88 (2 H, m), 0.73 - 0.79 (2 H, m).
127	3-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		0.91	267	1	

10

20

30

40

【表 1 3 - 8】

128	3-(シクロプロポキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		0.95	245 (M-H ⁺)	1	
129	2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸		0.94	232	1	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm: 0.94 - 1.03 (m, 2 H), 1.06 - 1.15 (m, 2 H), 2.37 - 2.46 (m, 1 H), 7.88 (d, J=1.10 Hz, 1 H), 8.05 (d, J=0.73 Hz, 1 H), 13.89 - 14.33 (m, 1 H).
130	3-(1-シアノ-1-メチル-エトキシ)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		0.92	272 (M-H ⁺)	1	
131	3,5-ビス(シクロプロポキシ)安息香酸		0.91	233 (M-H ⁺)	1	

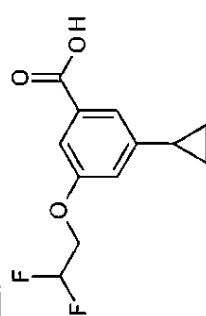
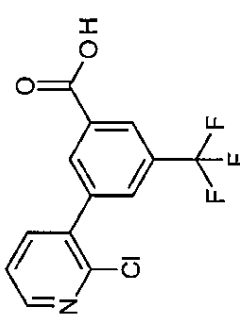
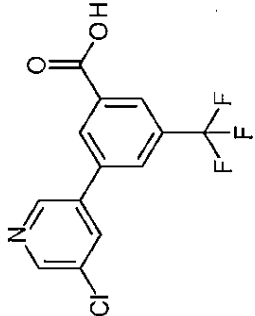
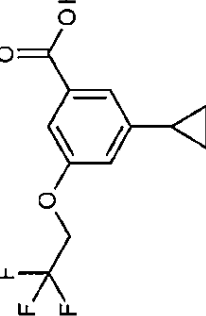
10

20

30

40

【表 1 3 - 9】

132	3-シクロプロピル-5-(2,2-ジフルオロエトキシ)安息香酸		0.91	241 (M-H ⁺)	1	¹ H NMR (400 MHz, DMSO) δ ppm 0.70 - 0.77 (m, 2 H) 0.94 - 1.00 (m, 2 H) 1.95 - 2.06 (m, 1 H) 4.36 (td, J=14.76, 3.48 Hz, 2 H) 6.21 - 6.54 (m, 1 H) 6.91 - 6.97 (m, 1 H) 7.26 (dd, J=2.38, 1.28 Hz, 1 H) 7.31 (t, J=1.28 Hz, 1 H) 11.73 - 13.25 (m, 1 H)
133	3-(2-クロロ-3-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		0.93	302	1	¹ H NMR (400 MHz, DMSO) δ ppm 7.57 - 7.61 (m, 1 H) 8.03 - 8.07 (m, 1 H) 8.16 - 8.20 (m, 1 H) 8.24 - 8.27 (m, 1 H) 8.29 - 8.32 (m, 1 H) 8.50 - 8.55 (m, 1 H) 13.64 - 13.77 (m, 1 H)
134	3-(5-クロロ-3-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		0.97	302	1	¹ H NMR (400 MHz, DMSO) δ ppm 8.22 - 8.26 (m, 1 H) 8.42 - 8.45 (m, 1 H) 8.48 (s, 1 H) 8.53 (s, 1 H) 8.71 - 8.74 (m, 1 H) 8.97 - 9.02 (m, 1 H) 13.63 - 13.78 (m, 1 H)
135	3-シクロプロピル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)安息香酸		0.98	259 (M-H ⁺)	1	

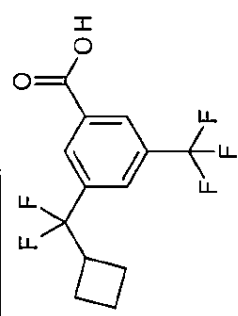
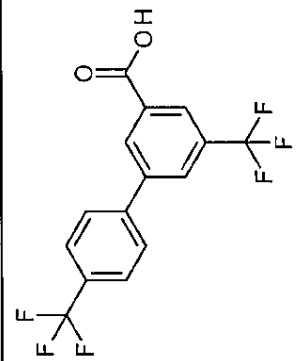
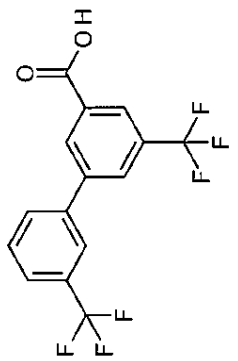
10

20

30

40

【表 1 3 - 1 0】

136	3-[シクロブチル(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸		1.06 293 (M-H ⁺)	1	
137	3-(トリフルオロメチル)-5-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]安息香酸		1.15 333 (M-H ⁺)	1	¹ H NMR (400 MHz, 溶剤) δ ppm 7.87 (d, J=8.44 Hz, 2 H) 8.06 (d, J=8.44 Hz, 2 H) 8.23 (s, 1 H) 8.34 (s, 1 H) 8.49 (s, 1 H) 13.72 (br s, 1 H)
138	3-(トリフルオロメチル)-5-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]安息香酸		1.08 333 (M-H ⁺)	1	

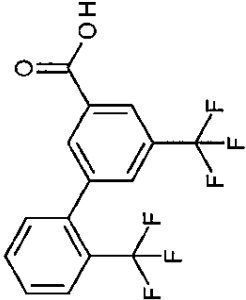
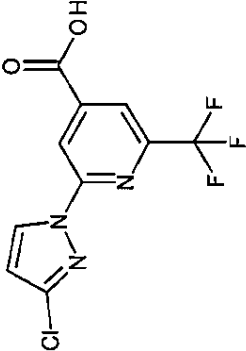
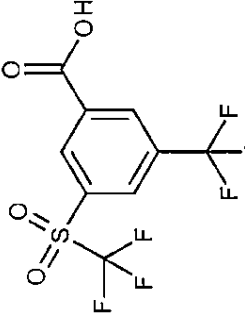
10

20

30

40

【表 1 3 - 1 1】

139	3-(トリフルオロメチル)-5-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]安息香酸		1.11	333 (M-H ⁺)	1	¹ H NMR (400 MHz, 溶剤) δ ppm 7.53 - 7.57 (m, 1 H) 7.68 - 7.74 (m, 1 H) 7.77 - 7.84 (m, 1 H) 7.89 - 7.93 (m, 1 H) 7.95 - 7.99 (m, 1 H) 8.11 - 8.14 (m, 1 H) 8.24 - 8.27 (m, 1 H) 13.71 (br s, 1 H)
140	2-(3-クロロピラゾール-1-イル)-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-カルボン酸		0.96	292	1	¹ H NMR (400 MHz, DMSO) δ ppm 13.9 - 15.0 (m, 1 H) 8.7 (d, J=2.57 Hz, 1 H) 8.4 (s, 1 H) 8.1 (d, J=1.10 Hz, 1 H) 6.8 (d, J=2.57 Hz, 1 H)
141	3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルホニル)安息香酸		0.98	321 (M-H ⁺)	1	¹ H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ ppm: 8.68 (s, 2 H) 8.71 - 8.76 (m, 1 H) 13.33 - 15.22 (m, 1 H).

本発明に係る組成物の活性は、他の殺虫的、殺ダニ的及び／又は殺真菌的に活性な成分を加えることによってかなり範囲が拡大され、一般的な状況に適合され得る。式 I の化合物と、他の殺虫的、殺ダニ的及び／又は殺真菌的に活性な成分との混合物が、より広い意味で相乗活性として記載されることもあるさらなる意外な利点も有し得る。例えば、植物によるより良好な耐容性、減少した植物毒性、昆虫がそれらの異なる発育段階で防除され得ること又はそれらの製造中、例えば粉碎若しくは混合中、それらの貯蔵中又はそれらの使用中におけるより良好な挙動がある。

【0406】

本明細書における有効成分への好適な添加剤は、例えば、以下の種類の有効成分が代表例である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼若ホルモン、ホルム
10
アミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、プレスロイド、塩素化炭化水素、アシル尿素、ピリジルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオニコチノイド及びバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 調製物。

【0407】

式 I の化合物と、有効成分との以下の混合物が好ましい（「TX」という略語は、「表 A-1～A-64 及び表 P に定義される化合物から選択される 1 つの化合物」を意味する）：

石油（代替名）（628）+ TX からなる物質の群から選択される補助剤、

1, 1-ビス（4-クロロフェニル）-2-エトキシエタノール（IUPAC 名）（910）+ TX、2, 4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート（IUPAC / ケミカルア
20
ブストラクツ名）（1059）+ TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセドアミド（IUPAC 名）（1295）+ TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン（IUPAC 名）（981）+ TX、アバメクチン（1）+ TX、アセキノシル（3）+ TX、アセトプロール [CCN] + TX、アクリナトリン（9）+ TX、アルジカルブ（16）+ TX、アルドキシカルブ（863）+ TX、 α -シベルメトリン（202）+ TX、アミジチオン（870）+ TX、アミドフルメト [CCN] + TX、アミドチオエート（872）+ TX、アミトン（875）+ TX、アミトンシュウ酸水素塩（875）+ TX、アミトラズ（24）+ TX、アラマイト（881）+ TX、三酸化ニヒ素（882）+ TX、AVI 382（化合物コード）+ TX、AZ 60541（化合物コード）
30
+ TX、アジンホス-エチル（44）+ TX、アジンホス-メチル（45）+ TX、アゾベンゼン（IUPAC 名）（888）+ TX、アゾシクロチン（46）+ TX、アゾトエート（889）+ TX、ベノミル（62）+ TX、ベノキサホス（代替名）[CCN] + TX、ベンゾキシメート（71）+ TX、安息香酸ベンジル（IUPAC 名）[CCN] + TX、ピフェナゼート（74）+ TX、ピフェントリン（76）+ TX、ピナパクリル（907）+ TX、プロフェンバレレート（代替名）+ TX、プロモシクレン（918）+ TX、プロモホス（920）+ TX、プロモホス-エチル（921）+ TX、プロモプロピレート（94）+ TX、ブプロフェジン（99）+ TX、ブトカルボキシム（103）+ TX、ブトキシカルボキシム（104）+ TX、ブチルピリダベン（代替名）+ TX、多硫化カルシウム（IUPAC 名）（111）+ TX、カンフェクロル（941）+ TX、
40
カーバノレート（943）+ TX、カルバリル（115）+ TX、カルボフラン（118）+ TX、カルボフェノチオン（947）+ TX、CGA 50'439（開発コード）（125）+ TX、キノメチオナト（126）+ TX、クロルベンシド（959）+ TX、クロルジメホルム（964）+ TX、クロルジメホルム塩酸塩（964）+ TX、クロルフェナピル（130）+ TX、クロルフェネトール（968）+ TX、クロルフェンソン（970）+ TX、クロルフェンスルフィド（971）+ TX、クロルフェンビンホス（131）+ TX、クロロベンジレート（975）+ TX、クロロメブホルム（977）+ TX、クロロメチウロン（978）+ TX、クロロプロピレート（983）+ TX、クロルピリホス（145）+ TX、クロルピリホス-メチル（146）+ TX、クロルチオホス（994）+ TX、シネリン I（696）+ TX、シネリン II（696）+ T
50

X、シネリン (696) + TX、クロフェンテジン (158) + TX、クロサンテル (代替名) [CCN] + TX、クマホス (174) + TX、クロタミトン (代替名) [CCN] + TX、クロトキシホス (1010) + TX、クフラネブ (1013) + TX、シアントエート (1020) + TX、シフルメトフェン (CAS登録番号: 400882-07-7) + TX、シハロトリン (196) + TX、シヘキサチン (199) + TX、シペルメトリン (201) + TX、DCPM (1032) + TX、DDT (219) + TX、デメフィオン (1037) + TX、デメフィオン-O (1037) + TX、デメフィオン-S (1037) + TX、デメトン (1038) + TX、デメトン-メチル (224) + TX、デメトン-O (1038) + TX、デメトン-O-メチル (224) + TX、デメトン-S (1038) + TX、デメトン-S-メチル (224) + TX、デメトン-S-メチルスルホン (1039) + TX、ジアフェンチウロン (226) + TX、ジアリホス (1042) + TX、ジアジノン (227) + TX、ジクロフルアニド (230) + TX、ジクロルボス (236) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジコホル (242) + TX、ジクロトホス (243) + TX、ジエノクロル (1071) + TX、ジメHOOKS (1081) + TX、ジメトエート (262) + TX、ジナクチン (代替名) (653) + TX、ジネクス (1089) + TX、ジネクス-ジクレキシ (1089) + TX、ジノブトン (269) + TX、ジノカップ (270) + TX、ジノカップ-4 [CCN] + TX、ジノカップ-6 [CCN] + TX、ジノクトン (1090) + TX、ジノペントン (1092) + TX、ジノスルホン (1097) + TX、ジノテルボン (1098) + TX、ジオキサチオン (1102) + TX、ジフェニルスルホン (IUPAC名) (1103) + TX、ジスルフィラム (代替名) [CCN] + TX、ジスルホトン (278) + TX、DNOC (282) + TX、ドフェナピン (1113) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エンドスルファン (294) + TX、エンドチオン (1121) + TX、EPN (297) + TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エチオン (309) + TX、エトエート-メチル (1134) + TX、エトキサゾール (320) + TX、エトリムホス (1142) + TX、フェナザフロル (1147) + TX、フェナザキン (328) + TX、酸化フェンブタスズ (330) + TX、フェノチオカルブ (337) + TX、フェンプロパトリン (342) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンピロキシメート (345) + TX、フェンソン (1157) + TX、フェントリファニル (1161) + TX、フェンバレレート (349) + TX、フィプロニル (354) + TX、フルアクリピリム (360) + TX、フルアズロン (1166) + TX、フルベンジミン (1167) + TX、フルシクロクスロン (366) + TX、フルシトリネート (367) + TX、フルエネチル (1169) + TX、フルフェノクスロン (370) + TX、フルメトリン (372) + TX、フルオルベンシド (1174) + TX、フルバリネート (1184) + TX、FMC 1137 (開発コード) (1185) + TX、ホルメタネート (405) + TX、塩酸ホルメタネート (405) + TX、ホルモチオン (1192) + TX、ホルムパラネート (1193) + TX、 γ -HCH (430) + TX、グリオジン (1205) + TX、ハルフェンブロックス (424) + TX、ヘプテノホス (432) + TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート (IUPAC/ケミカルアブストラクト名) (1216) + TX、ヘキシチアゾクス (441) + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、イソカルボホス (代替名) (473) + TX、イソプロピルO- (メトキシアミノチオホスホリル) サリチレート (IUPAC名) (473) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ジャスモリン I (696) + TX、ジャスモリン II (696) + TX、ヨードフェンホス (1248) + TX、リンダン (430) + TX、ルフェヌロン (490) + TX、マラチオン (492) + TX、マロノベン (1254) + TX、メカルバム (502) + TX、メホスホラン (1261) + TX、メスルフェン (代替名) [CCN] + TX、メタクリホス (1266) + TX、メタミドホス (527) + TX、メチダチオン (529) + TX、メチオカルブ (530) + TX、メトミル (531) + TX、臭化メチル (537) + TX、メトルカルブ (550) + TX、メビンホス (556) + TX、メキサカルベート (1290)

10

20

30

40

50

+TX、ミルベメクチン（557）+TX、ミルベマイシンオキシム（代替名）[CCN]
]+TX、ミパホックス（1293）+TX、モノクロトホス（561）+TX、モルホ
 チオン（1300）+TX、モキシデクチン（代替名）[CCN]+TX、ナレド（56
 7）+TX、NC-184（化合物コード）+TX、NC-512（化合物コード）+T
 X、ニフルリジド（1309）+TX、ニコマイシン（代替名）[CCN]+TX、ニト
 リラカルブ（1313）+TX、ニトリラカルブ1：1塩化亜鉛錯体（1313）+TX
 、NNI-0101（化合物コード）+TX、NNI-0250（化合物コード）+TX
 、オメトエート（594）+TX、オキサミル（602）+TX、オキシデプロホス（1
 324）+TX、オキシジスルホトン（1325）+TX、pp'-DDT（219）+
 TX、パラチオン（615）+TX、ペルメトリン（626）+TX、石油（代替名）（
 628）+TX、フェンカプトン（1330）+TX、フェントエート（631）+TX
 、ホレート（636）+TX、ホサロン（637）+TX、ホスホラン（1338）+T
 X、ホスメット（638）+TX、ホスファミドン（639）+TX、ホキシム（642
 ）+TX、ピリミホス-メチル（652）+TX、ポリクロロテルペン（慣用名）（13
 47）+TX、ポリナクチン（代替名）（653）+TX、プロクロノール（1350）
 +TX、プロフェノホス（662）+TX、プロマシル（1354）+TX、プロパルギ
 ット（671）+TX、プロペタンホス（673）+TX、プロボクサー（678）+T
 X、プロチダチオン（1360）+TX、プロトエート（1362）+TX、ピレトリン
 I（696）+TX、ピレトリンII（696）+TX、ピレトリン（696）+TX、
 ピリダベン（699）+TX、ピリダフェンチオン（701）+TX、ピリミジフェン（
 706）+TX、ピリミテート（1370）+TX、キナルホス（711）+TX、キン
 チオホス（quintiofos）（1381）+TX、R-1492（開発コード）（
 1382）+TX、RA-17（開発コード）（1383）+TX、ロテノン（722）
 +TX、シュラーダン（1389）+TX、セブホス（代替名）+TX、セラメクチン（
 代替名）[CCN]+TX、SI-0009（化合物コード）+TX、ソファミド（14
 02）+TX、スピロジクロフェン（738）+TX、スピロメシフェン（739）+T
 X、SSI-121（開発コード）（1404）+TX、スルフィラム（代替名）[CC
 N]+TX、スルフルアミド（750）+TX、スルホテップ（753）+TX、硫黄（
 754）+TX、SZI-121（開発コード）（757）+TX、ターフルバリネート
 （398）+TX、テブフェンピラド（763）+TX、TEPP（1417）+TX、
 テルバム（代替名）+TX、テトラクロロビンホス（777）+TX、テトラジホン（7
 86）+TX、テトラナクチン（代替名）（653）+TX、テトラスル（1425）+
 TX、チアフェノックス（代替名）+TX、チオカルボキシム（1431）+TX、チオ
 ファノックス（800）+TX、チオメトン（801）+TX、チオキノックス（143
 6）+TX、ツリンギエンシン（代替名）[CCN]+TX、トリアミホス（1441）
 +TX、トリアラテン（1443）+TX、トリアゾホス（820）+TX、トリアズロ
 ン（代替名）+TX、トリクロロホン（824）+TX、トリフェノホス（1455）+
 TX、トリナクチン（代替名）（653）+TX、バミドチオン（847）+TX、バニ
 リプロール[CCN]及びYI-5302（化合物コード）+TXからなる物質の群から
 選択される殺ダニ剤、
 ベトキサジン[CCN]+TX、ジオクタン酸銅（IUPAC名）（170）+TX、硫
 酸銅（172）+TX、シブトリン[CCN]+TX、ジクロン（1052）+TX、ジ
 クロロフェン（232）+TX、エンドタール（295）+TX、フェンチン（347）
 +TX、消石灰[CCN]+TX、ナーバム（566）+TX、キノクラミン（714）
 +TX、キノナミド（1379）+TX、シマジン（730）+TX、酢酸トリフェニル
 スズ（IUPAC名）（347）及び水酸化トリフェニルスズ（IUPAC名）（347
 ）+TXからなる物質の群から選択される殺藻剤、
 アバメクチン（1）+TX、クルホマート（1011）+TX、ドラメクチン（代替名）
 [CCN]+TX、エマメクチン（291）+TX、エマメクチン安息香酸塩（291）
 +TX、エブリノメクチン（代替名）[CCN]+TX、イベルメクチン（代替名）[C

10

20

30

40

50

CN] + TX、ミルベマイシンオキシム（代替名）[CCN] + TX、モキシデクチン（代替名）[CCN] + TX、ピペラジン[CCN] + TX、セラメクチン（代替名）[CCN] + TX、スピノサド（737）及びチオファネート（1435）+ TXからなる物質の群から選択される駆虫剤、

クロラロース（127）+ TX、エンドリン（1122）+ TX、フェンチオン（346）+ TX、ピリジン-4-アミン（IUPAC名）（23）及びストリキニーネ（745）+ TXからなる物質の群から選択される殺鳥剤、

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン（IUPAC名）（1222）+ TX、4-（キノキサリン-2-イルアミノ）ベンゼンスルホンアミド（IUPAC名）（748）+ TX、8-ヒドロキシキノリン硫酸塩（446）+ TX、プロノポール（97）+ TX、ジオクタン酸銅（IUPAC名）（170）+ TX、水酸化銅（IUPAC名）（169）+ TX、クレゾール[CCN] + TX、ジクロロフェン（232）+ TX、ジピリチオン（1105）+ TX、ドジシン（1112）+ TX、フェナミノスルフ（1144）+ TX、ホルムアルデヒド（404）+ TX、ヒドラルガフェン（代替名）[CCN] + TX、カスガマイシン（483）+ TX、塩酸カスガマイシン水和物（483）+ TX、ニッケルビス（ジメチルジチオカルバメート）（IUPAC名）（1308）+ TX、ニトラピリン（580）+ TX、オクチリノン（590）+ TX、オキシリン酸（606）+ TX、オキシテトラサイクリン（611）+ TX、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩（446）+ TX、プロベナゾール（658）+ TX、ストレプトマイシン（744）+ TX、セスキ硫酸ストレプトマイシン（744）+ TX、テクロフタラム（766）+ TX及びチオメルサル（代替名）[CCN] + TXからなる物質の群から選択される殺菌剤、

コカクモンハマキ（*Adoxophyes orana*）GV（代替名）（12）+ TX、アグロバクテリウム・ラジオブakter（*Agrobacterium radiobacter*）（代替名）（13）+ TX、ムチカブリダニ属（*Amblyseius* spp.）（代替名）（19）+ TX、アナグラファ・ファルシフェラ（*Anagrapa falcifera*）NPV（代替名）（28）+ TX、アナグルス・アトムス（*Anagrus atomus*）（代替名）（29）+ TX、アフエリヌス・アブドミナリス（*Aphelinus abdominalis*）（代替名）（33）+ TX、アフジウス・コレマニ（*Aphidius colemani*）（代替名）（34）+ TX、アフイドレテス・アフジミザ（*Aphidoletes aphidimyza*）（代替名）（35）+ TX、オートグラファ・カリフォルニカ（*Autographa californica*）NPV（代替名）（38）+ TX、バチルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）（代替名）（48）+ TX、バチルス・スフェリクス・ネイデ（*Bacillus sphaericus Neide*）（学名）（49）+ TX、バチルス・チューリングゲンシス・ベルリナー（*Bacillus thuringiensis Berliner*）（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種アイザワイ（*Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*）（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種イスラエシス（*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*）（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種ジャポネシス（*Bacillus thuringiensis subsp. japonensis*）（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種クルスターキ（*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*）（学名）（51）+ TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種テネブリオニス（*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*）（学名）（51）+ TX、ビューベリア・バシアナ（*Beauveria bassiana*）（代替名）（53）+ TX、ビューベリア・ブロングニアルティ（*Beauveria brongniartii*）（代替名）（54）+ TX、クリソペラ・カルネア（*Chrysoperla carnea*）（代替名）（151）+ TX、ツマアカオオテントウムシ（*Cryptola*

10

20

30

40

50

emus montrouzieri) (代替名) (178) +TX、コドリング (Cydia pomonella) GV (代替名) (191) +TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) (代替名) (212) +TX、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) (代替名) (254) +TX、オンシツツヤコバチ (Encarsia formosa) (学名) (293) +TX、サバクツヤコバチ (Eretmocerus eremicus) (代替名) (300) +TX、アメリカタバコガ (Helicoverpa zea) NPV (代替名) (431) +TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (Heterorhabdus bacteriophora) 及び H. メギディス (H. megidis) (代替名) (433) +TX、サカハチテントウ (Hippodamia convergens) (代替名) (442) +TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ (Leptomastix dactylopii) (代替名) (488) +TX、マクロロフス・カリギノスス (Macrolophus caliginosus) (代替名) (491) +TX、ヨトウガ (Mamestra brassicae) NPV (代替名) (494) +TX、メタフィカス・ヘルボルス (Metaphycus helvolus) (代替名) (522) +TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリズム (Metarhizium anisopliae var. acridum) (学名) (523) +TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ (Metarhizium anisopliae var. anisopliae) (学名) (523) +TX、マツノキハバチ (Neodiprion sertifer) NPV 及び N. レコンティ (N. lecontei) NPV (代替名) (575) +TX、オリウス属 (Orius spp.) (代替名) (596) +TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus) (代替名) (613) +TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (代替名) (644) +TX、シロイチモジヨトウ (Spodoptera exigua) 多カブシド核多角体病ウイルス (学名) (741) +TX、スタイナーネマ・ビビオニス (Steinernema bibionis) (代替名) (742) +TX、スタイナーネマ・カルボカプサエ (Steinernema carpocapsae) (代替名) (742) +TX、スタイナーネマ・フェルチアエ (Steinernema feltiae) (代替名) (742) +TX、スタイナーネマ・グラッセリ (Steinernema glaseri) (代替名) (742) +TX、スタイナーネマ・リオブラベ (Steinernema riobrave) (代替名) (742) +TX、スタイナーネマ・リオブラビス (Steinernema riobravis) (代替名) (742) +TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (Steinernema scapterisci) (代替名) (742) +TX、スタイナーネマ属 (Steinernema spp.) (代替名) (742) +TX、トリコグラムマ属 (Trichogramma spp.) (代替名) (826) +TX、チフロドロムス・オシデンタリス (Typhlodromus occidentalis) (代替名) (844) 及びバーティシリウム・レカニ (Verticillium lecanii) (代替名) (848) +TX からなる物質の群から選択される生物剤、

ヨードメタン (IUPAC 名) (542) 及び臭化メチル (537) +TX からなる物質の群から選択される土壌滅菌剤、

アフォレート [CCN] +TX、ビスジル (代替名) [CCN] +TX、ブスルファン (代替名) [CCN] +TX、ジフルベンズロン (250) +TX、ジマチフ (代替名) [CCN] +TX、ヘメル [CCN] +TX、ヘンパ [CCN] +TX、メテパ [CCN] +TX、メチオテパ [CCN] +TX、メチルアフォレート [CCN] +TX、モルジド [CCN] +TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] +TX、テパ [CCN] +TX、チオヘンパ (代替名) [CCN] +TX、チオテパ (代替名) [CCN] +TX、トレタミン (代替名) [CCN] 及びウレデパ (代替名) [CCN] +TX からなる物質の群から選択される不妊化剤、

(E) -デカ-5-エン-1-イルアセテート及び (E) -デカ-5-エン-1-オール

(IUPAC名) (222) + TX、(E) -トリデカ-4-エン-1-イルアセテート
 (IUPAC名) (829) + TX、(E) -6-メチルヘプタ-2-エン-4-オール
 (IUPAC名) (541) + TX、(E, Z) -テトラデカ-4, 10-ジエン-1-
 イルアセテート (IUPAC名) (779) + TX、(Z) -ドデカ-7-エン-1-イル
 アセテート (IUPAC名) (285) + TX、(Z) -ヘキサデカ-11-エナール
 (IUPAC名) (436) + TX、(Z) -ヘキサデカ-11-エン-1-イルアセテ
 ート (IUPAC名) (437) + TX、(Z) -ヘキサデカ-13-エン-11-イン
 -1-イルアセテート (IUPAC名) (438) + TX、(Z) -イコサ-13-エン
 -10-オン (IUPAC名) (448) + TX、(Z) -テトラデカ-7-エン-1-
 アール (IUPAC名) (782) + TX、(Z) -テトラデカ-9-エン-1-オール
 (IUPAC名) (783) + TX、(Z) -テトラデカ-9-エン-1-イルアセテ
 ート (IUPAC名) (784) + TX、(7E, 9Z) -ドデカ-7, 9-ジエン-1-
 イルアセテート (IUPAC名) (283) + TX、(9Z, 11E) -テトラデカ-9
 , 11-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (780) + TX、(9Z, 12
 E) -テトラデカ-9, 12-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (781)
 + TX、14-メチルオクタデカ-1-エン (IUPAC名) (545) + TX、4-メ
 チルノナン-5-オール及び4-メチルノナン-5-オン (IUPAC名) (544) +
 TX、 α -マルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、ブレビコミン (代替名) [
 CCN] + TX、コドレルア (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (16
 7) + TX、キュールア (代替名) (179) + TX、ディスパールア (277) + TX
 、ドデカ-8-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (286) + TX、ドデカ-
 9-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (287) + TX、ドデカ-8 + TX、
 10-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (284) + TX、ドミニカルア (代
 替名) [CCN] + TX、4-メチルオクタン酸エチル (IUPAC名) (317) +
 TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロンタリン (代替名) [CCN] +
 TX、ゴシッブルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グラ
 ンドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX
 、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (42
 1) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジェノール (代替名) [CCN] + T
 X、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャポニルア (代替名) (481) + T
 X、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ル
 ープルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名
) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (5
 63) + TX、オクタデカ-2, 13-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (
 588) + TX、オクタデカ-3, 13-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名)
 (589) + TX、オルフルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタルア (代替名)
 (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + T
 X、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX
 、テトラデカ-11-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (785) + TX、トリ
 メドルア (839) + TX、トリメドルア A (代替名) (839) + TX、トリメドル
 ア B₁ (代替名) (839) + TX、トリメドルア B₂ (代替名) (839) + TX、トリ
 メドルア C (代替名) (839) 及びトランク-コール (trunc-call) (代替
 名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、
 2-(オクチルチオ) エタノール (IUPAC名) (591) + TX、ブトピロノキシル
 (933) + TX、ブトキシ (ポリプロピレングリコール) (936) + TX、アジピン
 酸ジブチル (IUPAC名) (1046) + TX、フタル酸ジブチル (1047) + TX
 、コハク酸ジブチル (IUPAC名) (1048) + TX、ジエチルトルアミド [CCN
] + TX、ジメチルカルベート [CCN] + TX、フタル酸ジメチル [CCN] + TX、
 エチルヘキサンジオール (1137) + TX、ヘキサアミド [CCN] + TX、メトキン
 -ブチル (1276) + TX、メチルネオデカンアミド [CCN] + TX、オキサメート

10

20

30

40

50

[CCN] 及びピカリジン [CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫忌避剤
 、
 1-ジクロロ-1-ニトロエタン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1058)
) + TX、1, 1-ジクロロ-2, 2-ビス (4-エチルフェニル) エタン (IUPAC
 名) (1056)、+ TX、1, 2-ジクロロプロパン (IUPAC/ケミカルアブスト
 ラクツ名) (1062) + TX、1, 2-ジクロロプロパン及び1, 3-ジクロロプロペ
 ン (IUPAC名) (1063) + TX、1-ブロモ-2-クロロエタン (IUPAC/
 ケミカルアブストラクツ名) (916) + TX、2, 2, 2-トリクロロ-1- (3, 4-
 ジクロロフェニル) エチルアセテート (IUPAC名) (1451) + TX、2, 2-
 ジクロロビニル 2-エチルスルフィニルエチルメチルルホスフェート (IUPAC名) (1066) + TX、2- (1, 3-ジチオラン-2-イル) フェニルジメチルカルバメート (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1109) + TX、2- (2-ブトキシエトキシ) エチルチオシアネート (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (935) + TX、2- (4, 5-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-2-イル) フェニルメチルカルバメート (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1084) + TX、2- (4-クロロ-3, 5-キシリルオキシ) エタノール (IUPAC名) (986) + TX、2-クロロビニルジエチルホスフェート (IUPAC名) (984) + TX、2-イミダゾリドン (IUPAC名) (1225) + TX、2-イソバレリルインダン-1, 3-ジオン (IUPAC名) (1246) + TX、2-メチル (プロパー 2-イニル) アミノフェニルメチルカルバメート (IUPAC名) (1284) + TX、2-チオシアナトエチルラウレート (IUPAC名) (1433) + TX、3-ブロモ-1-クロロプロパー 1-エン (IUPAC名) (917) + TX、3-メチル-1-フェニルピラゾール-5-イルジメチルカルバメート (IUPAC名) (1283) + TX、4-メチル (プロパー 2-イニル) アミノ-3, 5-キシリルメチルカルバメート (IUPAC名) (1285) + TX、5, 5-ジメチル-3-オキソシクロヘキサ-1-エニルジメチルカルバメート (IUPAC名) (1085) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセフェート (2) + TX、アセタミプリド (4) + TX、アセチオン (代替名) [CCN] + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アクリナトリン (9) + TX、アクリロニトリル (IUPAC名) (861) + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、アルドリル (864) + TX、アレスリン (17) + TX、アロサミジン (代替名) [CCN] + TX、アリキシカルブ (866) + TX、 α -シペルメトリン (202) + TX、 α -エクジソン (代替名) [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX、アミジチオン (870) + TX、アミドチオエート (872) + TX、アミノカルブ (873) + TX、アミトン (875) + TX、アミトンシュウ酸水素塩 (875) + TX、アミトラズ (24) + TX、アナバシン (877) + TX、アチダチオン (883) + TX、AVI 382 (化合物コード) + TX、AZ 60541 (化合物コード) + TX、アザジラクチン (代替名) (41) + TX、アザメチホス (42) + TX、アジンホス-エチル (44) + TX、アジンホス-メチル (45) + TX、アゾトエート (889) + TX、バチルス・チューリゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシ (代替名) (52) + TX、ヘキサフルオロケイ酸バリウム (代替名) [CCN] + TX、多硫化バリウム (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (892) + TX、バルトリン [CCN] + TX、Bayer 22/190 (開発コード) (893) + TX、Bayer 22408 (開発コード) (894) + TX、ベンジオカルブ (58) + TX、ベンフラカルブ (60) + TX、ベンスルタップ (66) + TX、 β -シフルトリン (194) + TX、 β -シペルメトリン (203) + TX、ビフェントリン (76) + TX、バイオアレトリン (78) + TX、バイオアレトリン S-シクロペンテニル異性体 (代替名) (79) + TX、バイオエタノメトリン [CCN] + TX、ビオペルメトリン (908) + TX、ビオレスメトリン (80) + TX、ビス (2-クロロエチル) エーテル (IUPAC名) (909) + TX、ビストリフルロン (83) + TX、ハウ砂 (86) + TX、プロフェンバレレート (代替

10

20

30

40

50

名) + TX、ブロムフェンビンホス (914) + TX、プロモシクレン (918) + TX、
 プロモ-DDT (代替名) [CCN] + TX、プロモホス (920) + TX、プロモホ
 スーエチル (921) + TX、ブフェンカルブ (924) + TX、ブプロフェジン (99
) + TX、ブタカルブ (926) + TX、ブタチオホス (927) + TX、ブトカルボキ
 シム (103) + TX、ブトネート (932) + TX、ブトキシカルボキシム (104)
 + TX、ブチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (109) + TX、ヒ酸カルシ
 ウム [CCN] + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、多硫化カルシウム (I U
 PAC名) (111) + TX、カンフェクロル (941) + TX、カーバノレート (94
 3) + TX、カルバリル (115) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素
 (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (945) + TX、四塩化炭素 (IUPAC
 名) (946) + TX、カルボフェノチオン (947) + TX、カルボスルファン (11
 9) + TX、カルタップ (123) + TX、カルタップ塩酸塩 (123) + TX、セバジ
 ン (代替名) (725) + TX、クロルビシクレン (960) + TX、クロルダン (12
 8) + TX、クロルデコン (963) + TX、クロルジメホルム (964) + TX、クロ
 ルジメホルム塩酸塩 (964) + TX、クロルエトキシホス (129) + TX、クロルフ
 ェナピル (130) + TX、クロルフェンビンホス (131) + TX、クロルフルアズロ
 ン (132) + TX、クロルメホス (136) + TX、クロロホルム [CCN] + TX、
 クロロピクリン (141) + TX、クロルホキシム (989) + TX、クロルプラゾホス
 (990) + TX、クロルピリホス (145) + TX、クロルピリホスーメチル (146
) + TX、クロルチオホス (994) + TX、クロマフェノジド (150) + TX、シネ
 リン I (696) + TX、シネリン I I (696) + TX、シネリン (696) + TX、
 シスーレスメトリン (代替名) + TX、シスメトリン (80) + TX、クロシトリン (代
 替名) + TX、クロエトカルブ (999) + TX、クロサンテル (代替名) [CCN] +
 TX、クロチアニジン (165) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、ヒ酸銅 [C
 CN] + TX、オレイン酸銅 [CCN] + TX、クマホス (174) + TX、クミトエー
 ト (1006) + TX、クロタミトン (代替名) [CCN] + TX、クロトキシホス (1
 010) + TX、クルホマート (1011) + TX、氷晶石 (代替名) (177) + TX
 、CS 708 (開発コード) (1012) + TX、シアノフェンホス (1019) + T
 X、シアノホス (184) + TX、シアントエート (1020) + TX、シクレトリン [C
 CN] + TX、シクロプロトリン (188) + TX、シフルトリン (193) + TX、
 シハロトリン (196) + TX、シベルメトリン (201) + TX、シフェノトリン (2
 06) + TX、シロマジン (209) + TX、サイチオアート (代替名) [CCN] + T
 X、d-リモネン (代替名) [CCN] + TX、d-テトラメトリン (代替名) (788
) + TX、DAEP (1031) + TX、ダゾメット (216) + TX、DDT (219
) + TX、デカルボフラン (1034) + TX、デルタメトリン (223) + TX、デメ
 フィオン (1037) + TX、デメフィオンーO (1037) + TX、デメフィオンーS
 (1037) + TX、デメトン (1038) + TX、デメトンーメチル (224) + TX
 、デメトンーO (1038) + TX、デメトンーOーメチル (224) + TX、デメトン
 ーS (1038) + TX、デメトンーSーメチル (224) + TX、デメトンーSーメチ
 ルスルホン (1039) + TX、ジアフェンチウロン (226) + TX、ジアリホス (1
 042) + TX、ジアミダホス (1044) + TX、ジアジノン (227) + TX、ジカ
 プトン (1050) + TX、ジクロフェンチオン (1051) + TX、ジクロルボス (2
 36) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジクレシル (代替名) [CCN] + TX、
 ジクロトホス (243) + TX、ジシクラニル (244) + TX、ジェルドリン (107
 0) + TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルホスフェート (IUPAC名) (1
 076) + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジロール (代替名) [CCN]
 + TX、ジメフルトリン [CCN] + TX、ジメホックス (1081) + TX、ジメタン
 (1085) + TX、ジメトエート (262) + TX、ジメトリン (1083) + TX、
 ジメチルビンホス (265) + TX、ジメチラン (1086) + TX、ジネクス (108
 9) + TX、ジネクスージクレキシシ (1089) + TX、ジノプロブ (1093) + T

10

20

30

40

50

X、ジノサム（1094）+TX、ジノセブ（1095）+TX、ジノテフラン（271）+TX、ジオフェノラン（1099）+TX、ジオキサベンゾホス（1100）+TX、ジオキサカルブ（1101）+TX、ジオキサチオン（1102）+TX、ジスルホトン（278）+TX、ジチクロホス（1108）+TX、DNOC（282）+TX、ドラメクチン（代替名）[CCN]+TX、DSP（1115）+TX、エクジステロン（代替名）[CCN]+TX、EI 1642（開発コード）（1118）+TX、エマメクチン（291）+TX、エマメクチン安息香酸塩（291）+TX、EMPC（1120）+TX、エンペントリン（292）+TX、エンドスルフアン（294）+TX、エンドチオン（1121）+TX、エンドリン（1122）+TX、EPBP（1123）+TX、EPN（297）+TX、エポフェノナン（1124）+TX、エブリノメクチン（代替名）[CCN]+TX、エスフェンバレレート（302）+TX、エタホス（代替名）[CCN]+TX、エチオフエンカルブ（308）+TX、エチオン（309）+TX、エチプロール（310）+TX、エトエートーメチル（1134）+TX、エトプロホス（312）+TX、ギ酸エチル（IUPAC名）[CCN]+TX、エチルーDD（代替名）（1056）+TX、二臭化エチレン（316）+TX、二塩化エチレン（化学名）（1136）+TX、エチレンオキシド[CCN]+TX、エトフェンプロックス（319）+TX、エトリムホス（1142）+TX、EXD（1143）+TX、ファンファー（323）+TX、フェナミホス（326）+TX、フェナザフロル（1147）+TX、フェンクロルホス（1148）+TX、フェネタカルブ（1149）+TX、フェンフルトリン（1150）+TX、フェニトロチオン（335）+TX、フェノブカルブ（336）+TX、フェノキサクリム（1153）+TX、フェノキシカルブ（340）+TX、フェンピリトリン（1155）+TX、フェンプロパトリン（342）+TX、フェンピラド（代替名）+TX、フェンスルホチオン（1158）+TX、フェンチオン（346）+TX、フェンチオンーエチル[CCN]+TX、フェンバレレート（349）+TX、フィプロニル（354）+TX、フロニカミド（358）+TX、フルベンジアミド（CAS. 登録番号：272451-65-7）+TX、フルコフロン（1168）+TX、フルシクロクスロン（366）+TX、フルシトリネート（367）+TX、フルエネチル（1169）+TX、フルフェネリム[CCN]+TX、フルフェノクスロン（370）+TX、フルフェンプロックス（1171）+TX、フルメトリン（372）+TX、フルバリネート（1184）+TX、FMC 1137（開発コード）（1185）+TX、ホノホス（1191）+TX、ホルメタネート（405）+TX、塩酸ホルメタネート（405）+TX、ホルモチオン（1192）+TX、ホルムパラネート（1193）+TX、ホスメチラン（1194）+TX、ホスピレート（1195）+TX、ホスチアゼート（408）+TX、ホスチエタン（1196）+TX、フラチオカルブ（412）+TX、フレトリン（1200）+TX、γ-シハロトリン（197）+TX、γ-HCH（430）+TX、グアザチン（422）+TX、酢酸グアザチン（422）+TX、GY-81（開発コード）（423）+TX、ハルフェンプロックス（424）+TX、ハロフェノジド（425）+TX、HCH（430）+TX、HEOD（1070）+TX、ヘプタクロル（1211）+TX、ヘプテノホス（432）+TX、ヘテロホス[CCN]+TX、ヘキサフルムロン（439）+TX、HHDN（864）+TX、ヒドラメチルノン（443）+TX、シアン化水素（444）+TX、ハイドロブレン（445）+TX、ヒキンカルブ（1223）+TX、イミダクロプリド（458）+TX、イミプロトリン（460）+TX、インドキサカルブ（465）+TX、コードメタン（IUPAC名）（542）+TX、IPSP（1229）+TX、イサゾホス（1231）+TX、イソベンザン（1232）+TX、イソカルボホス（代替名）（473）+TX、イソドリリン（1235）+TX、イソフェンホス（1236）+TX、イソラン（1237）+TX、イソプロカルブ（472）+TX、イソプロピルO-（メトキシアミノチオホスホリル）サリチレート（IUPAC名）（473）+TX、イソプロチオラン（474）+TX、イソチオエート（1244）+TX、イソキサチオン（480）+TX、イベルメクチン（代替名）[CCN]+TX、ジャスモリンI（696）

10

20

30

40

50

+TX、ジャスモリン I I (696) +TX、ヨードフェンホス (1248) +TX、幼
 若ホルモン I (代替名) [CCN] +TX、幼若ホルモン I I (代替名) [CCN] +T
 X、幼若ホルモン I I I (代替名) [CCN] +TX、ケレバン (1249) +TX、キ
 ノプレノ (484) +TX、λ-シハロトリン (198) +TX、ヒ酸鉛 [CCN] +T
 X、レピメクチン (CCN) +TX、レプトホス (1250) +TX、リンダン (430
) +TX、リリムホス (1251) +TX、ルフエヌロン (490) +TX、リチダチオ
 ン (1253) +TX、m-クメニルメチルカルバメート (IUPAC名) (1014)
 +TX、リン化マグネシウム (IUPAC名) (640) +TX、マラチオン (492)
 +TX、マロノベン (1254) +TX、マジドックス (1255) +TX、メカルバム
 (502) +TX、メカルフォン (1258) +TX、メナゾン (1260) +TX、メ
 ホスホラン (1261) +TX、塩化第一水銀 (513) +TX、メスルフェンホス (1
 263) +TX、メタフルミゾン (CCN) +TX、メタム (519) +TX、メタム
 カリウム (代替名) (519) +TX、メタム-ナトリウム (519) +TX、メタクリ
 ホス (1266) +TX、メタミドホス (527) +TX、フッ化メタンスルホニル (I
 UPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1268) +TX、メチダチオン (529) +
 TX、メチオカルブ (530) +TX、メトクロトホス (1273) +TX、メトミル (5
 31) +TX、メトプレノ (532) +TX、メトキン-ブチル (1276) +TX、
 メトトリン (代替名) (533) +TX、メトキシクロル (534) +TX、メトキシフ
 ェノジド (535) +TX、臭化メチル (537) +TX、メチルイソチオシアネート (5
 43) +TX、メチルクロロホルム (代替名) [CCN] +TX、塩化メチレン [CC
 N] +TX、メトフルトリン [CCN] +TX、メトルカルブ (550) +TX、メトキ
 サジアゾン (1288) +TX、メビンホス (556) +TX、メキサカルベート (12
 90) +TX、ミルベメクチン (557) +TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [C
 CN] +TX、ミバホックス (1293) +TX、ミレックス (1294) +TX、モ
 ノクロトホス (561) +TX、モルホチオン (1300) +TX、モキシデクチン (代
 替名) [CCN] +TX、ナフタロホス (代替名) [CCN] +TX、ナレド (567)
 +TX、ナフタレン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1303) +TX、N
 C-170 (開発コード) (1306) +TX、NC-184 (化合物コード) +TX、
 ニコチン (578) +TX、硫酸ニコチン (578) +TX、ニフルリジド (1309)
 +TX、ニテンピラム (579) +TX、ニチアジン (1311) +TX、ニトリラカル
 ブ (1313) +TX、ニトリラカルブ 1:1 塩化亜鉛錯体 (1313) +TX、NNI
 -0101 (化合物コード) +TX、NNI-0250 (化合物コード) +TX、ノルニ
 コチン (慣用名) (1319) +TX、ノバルロン (585) +TX、ノビフルムロン (5
 86) +TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオ
 エート (IUPAC名) (1057) +TX、O, O-ジエチルO-4-メチル-2-オ
 キソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオエート (IUPAC名) (1074) +T
 X、O, O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオ
 エート (IUPAC名) (1075) +TX、O, O, O', O'-テトラプロピルジチ
 オピロホスフェート (IUPAC名) (1424) +TX、オレイン酸 (IUPAC名)
 (593) +TX、オメトエート (594) +TX、オキサミル (602) +TX、オキ
 シデメトン-メチル (609) +TX、オキシデプロホス (1324) +TX、オキシジ
 スルホトン (1325) +TX、pp'-DDT (219) +TX、パラ-ジクロロベン
 ゼン [CCN] +TX、パラチオン (615) +TX、パラチオン-メチル (616) +
 TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] +TX、ペンタクロロフェノール (623) +
 TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル (IUPAC名) (623) +TX、ペルメトリ
 ン (626) +TX、石油 (代替名) (628) +TX、PH 60-38 (開発コード)
 (1328) +TX、フェンカプトン (1330) +TX、フェノトリン (630) +
 TX、フェントエート (631) +TX、ホレート (636) +TX、ホサロン (637)
 +TX、ホスホラン (1338) +TX、ホスメット (638) +TX、ホスニクロ
 ール (1339) +TX、ホスファミドン (639) +TX、ホスフィン (IUPAC名)

10

20

30

40

50

(640) + TX、ホキシム (642) + TX、ホキシムーメチル (1340) + TX、
 ピリメタホス (1344) + TX、ピリミカルブ (651) + TX、ピリミホスーエチル
 (1345) + TX、ピリミホスーメチル (652) + TX、ポリクロロジシクロペンタ
 ジエン異性体 (IUPAC名) (1346) + TX、ポリクロロテルペン (慣用名) (1
 347) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、カリウムチオシアネート [CCN]
 + TX、プラレトリン (655) + TX、プレコセン I (代替名) [CCN] + TX、プ
 レコセン I I (代替名) [CCN] + TX、プレコセン I I I (代替名) [CCN] + T
 X、プリミドホス (1349) + TX、プロフェノホス (662) + TX、プロフルトリ
 ン [CCN] + TX、プロマシル (1354) + TX、プロメカルブ (1355) + TX
 、プロパホス (1356) + TX、プロペタンホス (673) + TX、プロボクサー (6
 78) + TX、プロチダチオン (1360) + TX、プロチオホス (686) + TX、プ
 ロトエート (1362) + TX、プロトリフェンビュート [CCN] + TX、ピメトロジ
 ン (688) + TX、ピラクロホス (689) + TX、ピラゾホス (693) + TX、ピ
 レスメトリン (1367) + TX、ピレトリン I (696) + TX、ピレトリン I I (6
 96) + TX、ピレトリン (696) + TX、ピリダベン (699) + TX、ピリダリル
 (700) + TX、ピリダフェンチオン (701) + TX、ピリミジフェン (706) +
 TX、ピリミテート (1370) + TX、ピリプロキシフェン (708) + TX、クアッ
 シア (代替名) [CCN] + TX、キナルホス (711) + TX、キナルホスーメチル (1
 376) + TX、キノチオン (1380) + TX、キンチオホス (1381) + TX、
 R-1492 (開発コード) (1382) + TX、ラフォキサニド (代替名) [CCN]
 + TX、レスメトリン (719) + TX、ロテノン (722) + TX、RU 15525
 (開発コード) (723) + TX、RU 25475 (開発コード) (1386) + TX
 、リアニア (代替名) (1387) + TX、リアノジン (慣用名) (1387) + TX、
 サバジラ (代替名) (725) + TX、シュラーダン (1389) + TX、セブホス (代
 替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、SI-0009 (化合物コー
 ド) + TX、SI-0205 (化合物コード) + TX、SI-0404 (化合物コード)
 + TX、SI-0405 (化合物コード) + TX、シラフルオフエン (728) + TX、
 SN 72129 (開発コード) (1397) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + T
 X、シアン化ナトリウム (444) + TX、フッ化ナトリウム (IUPAC/ケミカルア
 ブストラクツ名) (1399) + TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム (1400) +
 TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド (623) + TX、セレン酸ナトリウム (I
 UPAC名) (1401) + TX、ナトリウムチオシアネート [CCN] + TX、ソファ
 ミド (1402) + TX、スピノサド (737) + TX、スピロメシフェン (739) +
 TX、スピロテトラマト (CCN) + TX、スルコフロニ (746) + TX、スルコフロ
 ン-ナトリウム (746) + TX、スルフルアミド (750) + TX、スルホテップ (7
 53) + TX、フッ化スルフルル (756) + TX、スルプロオス (1408) + TX、
 タール油 (代替名) (758) + TX、ターフルバリネート (398) + TX、タジムカ
 ルブ (1412) + TX、TDE (1414) + TX、テブフェノジド (762) + TX
 、テブフェンピラド (763) + TX、テブピリムホス (764) + TX、テフルベンズ
 ロン (768) + TX、テフルトリン (769) + TX、テメホス (770) + TX、T
 EPP (1417) + TX、テラレトリン (1418) + TX、テルバム (代替名) + T
 X、テルブホス (773) + TX、テトラクロロエタン [CCN] + TX、テトラクロル
 ビンホス (777) + TX、テトラメトリン (787) + TX、θ-シペルメトリン (2
 04) + TX、チアクロプリド (791) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、
 チアメトキサム (792) + TX、チクロホス (1428) + TX、チオカルボキシム (1
 431) + TX、チオシクラム (798) + TX、チオシクラムシュウ酸水素塩 (79
 8) + TX、チオジカルブ (799) + TX、チオフアノックス (800) + TX、チオ
 メトン (801) + TX、チオナジン (1434) + TX、チオスルタップ (803) +
 TX、チオスルタップ-ナトリウム (803) + TX、ツリンギエンシン (代替名) [C
 CN] + TX、トルフェンピラド (809) + TX、トラロメトリン (812) + TX、

10

20

30

40

50

トランスフルトリン (813) + TX、トランスペルメトリン (1440) + TX、トリアミホス (1441) + TX、トリアザメート (818) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、トリクロルホン (824) + TX、トリクロルメタホス-3 (代替名) [CCN] + TX、トリクロロナート (1452) + TX、トリフェノホス (1455) + TX、トリフルムロン (835) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、トリプレン (1459) + TX、バミドチオン (847) + TX、バニリプロール [CCN] + TX、ベラトリジン (代替名) (725) + TX、ベラトリン (代替名) (725) + TX、XMC (853) + TX、キシリルカルブ (854) + TX、YI-5302 (化合物コード) + TX、ζ-シベルメトリン (205) + TX、ゼタメトリン (zetamet hr in) (代替名) + TX、リン化亜鉛 (640) + TX、ゾラプロホス (1469) 及び ZXI 8901 (開発コード) (858) + TX、シアントラニリプロール [736994-63-19 + TX、クロラントラニリプロール [500008-45-7] + TX、シエノピラフェン [560121-52-0] + TX、シフルメトフェン [400882-07-7] + TX、ピリフルキナゾン [337458-27-2] + TX、スピネトラム [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX、スピロテトラマト [203313-25-1] + TX、スルホキサフロール [946578-00-3] + TX、フルフィプロール [704886-18-0] + TX、メベルフルトリン [915288-13-0] + TX、テトラメチルフルトリン [84937-88-2] + TX、トリフルメゾピリム (国際公開第2012/092115号に開示される) + TX、フルキサメタミド (国際公開第2007/026965号) + TX、ε-メトフルトリン [240494-71-7] + TX、ε-モンフルオロトリン [1065124-65-3] + TX、フルアザインドリジン [1254304-22-7] + TX、クロプロラレトリン [399572-87-3] + TX、フルキサメタミド [928783-29-3] + TX、シハロジアミド [1262605-53-7] + TX、チオキサザフェン [330459-31-9] + TX、プロフラニリド [1207727-04-5] + TX、フルフィプロール [704886-18-0] + TX、シクラニリプロール [1031756-98-5] + TX、テトラニリプロール [1229654-66-3] + TX、グアジビル (国際公開第2010/060231号に記載) + TX、シクロキサブリド (国際公開第2005/077934号に記載) + TX、スピロピジオン + TX、アフイドピロペン + TX、フルピリミン + TX、モンフルオロトリン + TX、κ-ビフェントリン + TX、κ-テフルトリン + TX、ジクロロメゾチアズ + TX、テトラクロラニリプロール + TX、ベンズピリモキサン + TX;

ビス (トリブチルスズ) オキシド (IUPAC名) (913) + TX、プロモアセトアミド [CCN] + TX、ヒ酸カルシウム [CCN] + TX、クロエトカルブ (999) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、硫酸銅 (172) + TX、フェンチン (347) + TX、リン酸第二鉄 (IUPAC名) (352) + TX、メタアルデヒド (518) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ニクロサミド (576) + TX、ニクロサミド-オールアミン (576) + TX、ペンタクロロフェノール (623) + TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド (623) + TX、タジムカルブ (1412) + TX、チオジカルブ (799) + TX、酸化トリブチルスズ (913) + TX、トリフェンモルフ (1454) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) 及び水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) + TX、ピリプロール [394730-71-3] + TXからなる物質の群から選択される殺軟体動物剤、

AKD-3088 (化合物コード) + TX、1, 2-ジブロモ-3-クロロプロパン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1045) + TX、1, 2-ジクロロプロパン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1062) + TX、1, 2-ジクロロプロパン及び1, 3-ジクロロプロペン (IUPAC名) (1063) + TX、1, 3-ジクロロプロペン (233) + TX、3, 4-ジクロロテトラヒドロチオフエン1, 1-ジオキシド (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1065) + TX、3- (4-クロ

10

20

30

40

50

ロフェニル) - 5-メチルローダニン (IUPAC名) (980) + TX、5-メチル-
 6-チオキソ-1, 3, 5-チアジアジナン-3-イル酢酸 (IUPAC名) (1286)
) + TX、6-イソペンテニルアミノプリン (代替名) (210) + TX、アバメクチン
 (1) + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジ
 カルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、AZ 60541 (化合物
 コード) + TX、ベンクロチアズ [CCN] + TX、ベノミル (62) + TX、ブチルピ
 リダベン (代替名) + TX、カズサホス (109) + TX、カルボフラン (118) + T
 X、二硫化炭素 (945) + TX、カルボスルファン (119) + TX、クロロピクリン
 (141) + TX、クロルピリホス (145) + TX、クロエトカルブ (999) + TX
 、サイトカイニン (代替名) (210) + TX、ダゾメット (216) + TX、DBC P
 (1045) + TX、DCIP (218) + TX、ジアミダホス (1044) + TX、ジ
 クロフェンチオン (1051) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジメトエート (2
 62) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + T
 X、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN]
 + TX、エトプロホス (312) + TX、二臭化エチレン (316) + TX、フェナミホ
 ス (326) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンスルホチオン (1158)
 + TX、ホスチアゼート (408) + TX、ホスチエタン (1196) + TX、フルフラ
 ール (代替名) [CCN] + TX、GY-81 (開発コード) (423) + TX、ヘテロ
 ホス [CCN] + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、イサミドホス
 (1230) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イベルメクチン (代替名) [CC
 N] + TX、キネチン (代替名) (210) + TX、メカルフォン (1258) + TX、
 メタム (519) + TX、メタム-カリウム (代替名) (519) + TX、メタム-ナト
 リウム (519) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (5
 43) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代
 替名) [CCN] + TX、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucar*
ia) 組成物 (代替名) (565) + TX、NC-184 (化合物コード) + TX、オキ
 サミル (602) + TX、ホレート (636) + TX、ホスファミドン (639) + TX
 、ホスホカルブ [CCN] + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名)
 [CCN] + TX、スピノサド (737) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホ
 ス (773) + TX、テトラクロロチオフエン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名
) (1422) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、チオナジン (1434) +
 TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、キシレノール [C
 CN] + TX、YI-5302 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (210) +
 TX、フルエンシルホン [318290-98-1] + TX、フルオピラム + TX からな
 る物質の群から選択される殺線虫剤、
 エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] 及びニトラピリン (580) + TX からなる物
 質の群から選択される硝化阻害剤、
 アシベンゾラル (6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル (6) + TX、プロベナゾー
 ル (658) 及びオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*)
 抽出物 (代替名) (720) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤、
 2-イソバレリルインダン-1, 3-ジオン (IUPAC名) (1246) + TX、4-
 (キノキサリン-2-イルアミノ) ベンゼンシルホンアミド (IUPAC名) (748)
 + TX、 α -クロロヒドリン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX、
 アンチュ (ant u) (880) + TX、三酸化二ヒ素 (882) + TX、炭酸バリウム
 (891) + TX、ビスチオセミ (912) + TX、プロディファコウム (89) + TX
 、プロマジオロン (91) + TX、プロメタリン (92) + TX、シアン化カルシウム (4
 44) + TX、クロラロース (127) + TX、クロロファシノン (140) + TX、
 コレカルシフェロール (代替名) (850) + TX、クマクロール (1004) + TX、
 クマフリル (1005) + TX、クマテトラリル (175) + TX、クリミジン (100
 9) + TX、ジフェナコウム (246) + TX、ジフェチアロン (249) + TX、ジフ

10

20

30

40

50

ヲシノン (273) + TX、エルゴカルシフェロール (301) + TX、フロクマフェン
 (357) + TX、フルオロアセトアミド (379) + TX、フルプロパダイン (118
 3) + TX、フルプロパダイン塩酸塩 (1183) + TX、 γ -HCH (430) + TX
 、HCH (430) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ヨードメタン (IUPAC
 名) (542) + TX、リンダン (430) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC 名)
 (640) + TX、臭化メチル (537) + TX、ノルボルミド (1318) + TX、
 ホサセチム (1336) + TX、ホスフィン (IUPAC 名) (640) + TX、リン [C
 CN] + TX、ピンドン (1341) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、ピリ
 スロン (1371) + TX、シリロシド (1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN
] + TX、シアン化ナトリウム (444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム (735) +
 TX、ストリキニーネ (745) + TX、硫酸タリウム [CCN] + TX、ワルファリン
 (851) 及びリン化亜鉛 (640) + TX からなる物質の群から選択される殺鼠剤、
 2- (2-ブトキシエトキシ) エチルピペロニレート (IUPAC 名) (934) + TX
 、5- (1, 3-ベンゾジオキソール-5-イル) -3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エ
 ノン (IUPAC 名) (903) + TX、ファルネソール及びネロリドール (代替名) (3
 24) + TX、MB-599 (開発コード) (498) + TX、MGK 264 (開発
 コード) (296) + TX、ピペロニルブトキシド (649) + TX、ピプロタル (1
 343) + TX、プロピル異性体 (1358) + TX、S421 (開発コード) (724
) + TX、セサメクス (1393) + TX、セサモリン (1394) 及びスルホキシド (1
 406) + TX からなる物質の群から選択される共力剤、
 アントラキノン (32) + TX、クロラロース (127) + TX、ナフテン酸銅 [CCN
] + TX、オキシ塩化銅 (171) + TX、ジアジノン (227) + TX、ジシクロペン
 タジエン (化学名) (1069) + TX、グアザチン (422) + TX、酢酸グアザチン
 (422) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ピリジン-4-アミン (IUPAC
 名) (23) + TX、チラム (804) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、ナフ
 テン酸亜鉛 [CCN] 及びジラム (856) + TX からなる物質の群から選択される動物
 忌避剤、
 イマニン (代替名) [CCN] 及びリバビリン (代替名) [CCN] + TX からなる物質
 の群から選択される殺ウイルス剤、
 酸化第二水銀 (512) + TX、オクチリノン (590) 及びチオフアネート-メチル (8
 02) + TX からなる物質の群から選択される傷保護剤、及び
 アザコナゾール (60207-31-0) + TX、ビテルタノール [70585-36-
 3] + TX、ブロムコナゾール [116255-48-2] + TX、シプロコナゾール [9
 4361-06-5] + TX、ジフェノコナゾール [119446-68-3] + TX
 、ジニコナゾール [83657-24-3] + TX、エポキシコナゾール [106325
 -08-0] + TX、フェンブコナゾール [114369-43-6] + TX、フルキン
 コナゾール [136426-54-5] + TX、フルシラゾール [85509-19-9
] + TX、フルトリアホール [76674-21-0] + TX、ヘキサコナゾール [79
 983-71-4] + TX、イマザリル [35554-44-0] + TX、イミベンコナ
 ザール [86598-92-7] + TX、イブコナゾール [125225-28-7] +
 TX、メトコナゾール [125116-23-6] + TX、ミクロブタニル [88671
 -89-0] + TX、ペフラゾエート [101903-30-4] + TX、ペンコナゾー
 ル [66246-88-6] + TX、プロチオコナゾール [178928-70-6] +
 TX、ピリフェノックス [88283-41-4] + TX、プロクロラズ [67747-
 09-5] + TX、プロピコナゾール [60207-90-1] + TX、シメコナゾール
 [149508-90-7] + TX、テブコナゾール [107534-96-3] + TX
 、テトラコナゾール [112281-77-3] + TX、トリアジメホン [43121-
 43-3] + TX、トリアジメノール [55219-65-3] + TX、トリフルミゾー
 ル [99387-89-0] + TX、トリチコナゾール [131983-72-7] + TX
 、アンシミドール [12771-68-5] + TX、フェナリモル [60168-88

10

20

30

40

50

-9] + TX、ヌアリモル [6 3 2 8 4-7 1-9] + TX、ブピリメート [4 1 4 8 3
 -4 3-6] + TX、ジメチリモール [5 2 2 1-5 3-4] + TX、エチリモル [2 3
 9 4 7-6 0-6] + TX、ドデモルフ [1 5 9 3-7 7-7] + TX、フェンプロピジ
 ン [6 7 3 0 6-0 0-7] + TX、フェンプロピモルフ [6 7 5 6 4-9 1-4] + T
 X、スピロキサミン [1 1 8 1 3 4-3 0-8] + TX、トリデモルフ [8 1 4 1 2-4
 3-3] + TX、シプロジニル [1 2 1 5 5 2-6 1-2] + TX、メパニピリム [1 1
 0 2 3 5-4 7-7] + TX、ピリメタニル [5 3 1 1 2-2 8-0] + TX、フェンピ
 クロニル [7 4 7 3 8-1 7-3] + TX、フルジオキシソニル [1 3 1 3 4 1-8 6-1
] + TX、ベナラキシル [7 1 6 2 6-1 1-4] + TX、フララキシル [5 7 6 4 6-
 3 0-7] + TX、メタラキシル [5 7 8 3 7-1 9-1] + TX、R-メタラキシル [10
 7 0 6 3 0-1 7-0] + TX、オフレース [5 8 8 1 0-4 8-3] + TX、オキサジ
 キシル [7 7 7 3 2-0 9-3] + TX、ベノミル [1 7 8 0 4-3 5-2] + TX、カル
 ルベンダジム [1 0 6 0 5-2 1-7] + TX、デバカルブ [6 2 7 3 2-9 1-6] +
 TX、フベリダゾール [3 8 7 8-1 9-1] + TX、チアベンダゾール [1 4 8-7 9
 -8] + TX、クロゾリネート [8 4 3 3 2-8 6-5] + TX、ジクロゾリン [2 4 2
 0 1-5 8-9] + TX、イプロジオン [3 6 7 3 4-1 9-7] + TX、マイクロゾリ
 ン [5 4 8 6 4-6 1-8] + TX、プロシミドン [3 2 8 0 9-1 6-8] + TX、ピ
 ンクロゾリン [5 0 4 7 1-4 4-8] + TX、ボスカリド [1 8 8 4 2 5-8 5-6]
 + TX、カルボキシシン [5 2 3 4-6 8-4] + TX、フェンフラム [2 4 6 9 1-8 0
 -3] + TX、フルトラニル [6 6 3 3 2-9 6-5] + TX、メプロニル [5 5 8 1 4
 -4 1-0] + TX、オキシカルボキシシン [5 2 5 9-8 8-1] + TX、ペンチオピラ
 ド [1 8 3 6 7 5-8 2-3] + TX、チフルザミド [1 3 0 0 0 0-4 0-7] + TX
 、グアザチン [1 0 8 1 7 3-9 0-6] + TX、ドジン [2 4 3 9-1 0-3] [1 1
 2-6 5-2] (遊離塩基) + TX、イミノクタジン [1 3 5 1 6-2 7-3] + TX、
 アゾキシストロビン [1 3 1 8 6 0-3 3-8] + TX、ジモキシストロビン [1 4 9 9
 6 1-5 2-4] + TX、エネステロブリン {Proc. BCPC, Int. Congr
 ., Glasg ow, 2003, 1, 93} + TX、フルオキサストロビン [3 6 1 3 7
 7-2 9-9] + TX、クレソキシム-メチル [1 4 3 3 9 0-8 9-0] + TX、メト
 ミノストロビン [1 3 3 4 0 8-5 0-1] + TX、トリフロキシストロビン [1 4 1 5
 1 7-2 1-7] + TX、オリザストロビン [2 4 8 5 9 3-1 6-0] + TX、ピコキ
 シストロビン [1 1 7 4 2 8-2 2-5] + TX、ピラクロストロビン [1 7 5 0 1 3-
 1 8-0] + TX、フェルバム [1 4 4 8 4-6 4-1] + TX、マンコゼブ [8 0 1 8
 -0 1-7] + TX、マネブ [1 2 4 2 7-3 8-2] + TX、メチラム [9 0 0 6-4
 2-2] + TX、プロピネブ [1 2 0 7 1-8 3-9] + TX、チラム [1 3 7-2 6-
 8] + TX、ジネブ [1 2 1 2 2-6 7-7] + TX、ジラム [1 3 7-3 0-4] + T
 X、カプタホール [2 4 2 5-0 6-1] + TX、カプタン [1 3 3-0 6-2] + TX
 、ジクロフルアニド [1 0 8 5-9 8-9] + TX、フルオロイミド [4 1 2 0 5-2 1
 -4] + TX、ホルベット [1 3 3-0 7-3] + TX、トリルフルアニド [7 3 1-2
 7-1] + TX、ボルドー液 [8 0 1 1-6 3-0] + TX、水酸化銅 [2 0 4 2 7-5
 9-2] + TX、オキシ塩化銅 [1 3 3 2-4 0-7] + TX、硫酸銅 [7 7 5 8-9 8
 -7] + TX、酸化銅 [1 3 1 7-3 9-1] + TX、マンコッパー (manco ppe
 r) [5 3 9 8 8-9 3-5] + TX、オキシシン銅 [1 0 3 8 0-2 8-6] + TX、ジ
 ノカップ [1 3 1-7 2-6] + TX、ニトロタールーイソプロピル [1 0 5 5 2-7 4
 -6] + TX、エディフェンホス [1 7 1 0 9-4 9-8] + TX、イプロベンホス [2
 6 0 8 7-4 7-8] + TX、イソプロチオラン [5 0 5 1 2-3 5-1] + TX、ホス
 ジフェン [3 6 5 1 9-0 0-3] + TX、ピラゾホス [1 3 4 5 7-1 8-6] + TX
 、トルクロホス-メチル [5 7 0 1 8-0 4-9] + TX、アシベンゾラル-S-メチル
 [1 3 5 1 5 8-5 4-2] + TX、アニラジン [1 0 1-0 5-3] + TX、ベンチア
 バリカルブ [4 1 3 6 1 5-3 5-7] + TX、ブラストサイジン-S [2 0 7 9-0 0
 -7] + TX、キノメチオナト [2 4 3 9-0 1-2] + TX、クロロネブ [2 6 7 5-

10

20

30

40

50

77-6] + TX、クロロタロニル [1897-45-6] + TX、シフルフェナミド [180409-60-3] + TX、シモキサニル [57966-95-7] + TX、ジクロロン [117-80-6] + TX、ジクロシメット [139920-32-4] + TX、ジクロメジン [62865-36-5] + TX、ジクロラン [99-30-9] + TX、ジエトフェンカルブ [87130-20-9] + TX、ジメトモルフ [110488-70-5] + TX、SYPLI90 (フルモルフ) [211867-47-9] + TX、ジチアノン [3347-22-6] + TX、エタボキサム [162650-77-3] + TX、エトリジアゾール [2593-15-9] + TX、ファモキサドン [131807-57-3] + TX、フェナミドン [161326-34-7] + TX、フェノキサニル [115852-48-7] + TX、フェンチン [668-34-8] + TX、フェリム
 ゴン [89269-64-7] + TX、フルアジナム [79622-59-6] + TX、フルオピコリド [239110-15-7] + TX、フルスルファミド [106917-52-6] + TX、フェンヘキサミド [126833-17-8] + TX、ホセチルーアルミニウム [39148-24-8] + TX、ヒメキサゾール [10004-44-1] + TX、イプロバリカルブ [140923-17-7] + TX、IKF-916 (シアゾファミド) [120116-88-3] + TX、カスガマイシン [6980-18-3] + TX、メタスルホカルブ [66952-49-6] + TX、メトラフェノン [220899-03-6] + TX、ペンシクロン [66063-05-6] + TX、フタリド [27355-22-2] + TX、ポリオキシシン [11113-80-7] + TX、プロベナ
 ゴール [27605-76-1] + TX、プロパモカルブ [25606-41-1] + TX、プロキンアジド [189278-12-4] + TX、ピロキロン [57369-32-1] + TX、キノキシフェン [124495-18-7] + TX、キントゼン [82-68-8] + TX、硫黄 [7704-34-9] + TX、チアジニル [223580-51-6] + TX、トリアゾキシド [72459-58-6] + TX、トリシクラゾール [41814-78-2] + TX、トリホリン [26644-46-2] + TX、バリダマイシン [37248-47-8] + TX、ゾキサミド (RH7281) [156052-68-5] + TX、マンジプロパミド [374726-62-2] + TX、イソピラザム [881685-58-1] + TX、セダキサン [874967-67-6] + TX、3-
 ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸 (9-ジクロロメチレン-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノ-ナフタレン-5-イル) -ア
 ミド (国際公開第2007/048556号に開示される) + TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸 (3', 4', 5'-トリフルオロ-
 ビフェニル-2-イル) -アミド (国際公開第2006/087343号に開示される) + TX、[(3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS)-3-
 -[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]-1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b-デカヒドロ-6, 12-ジヒドロキシ-4, 6a, 12b-トリメチル-
 11-オキソ-9-(3-ピリジニル)-2H, 11Hナフト[2, 1-b]ピラノ[3, 4-e]ピラン-4-イル]メチル-シクロプロパンカルボキシレート [915972-17-7] + TX及び1, 3, 5-トリメチル-N-(2-メチル-1-オキソプロ
 ピル)-N-[3-(2-メチルプロピル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-メ
 トキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-1H-ピラゾール-4-カル
 ボキサミド [926914-55-8] + TXからなる物質の群から選択される生物学的
 に活性な化合物、ランコトリオン [1486617-21-3] + TX、フロルピラウキ
 シフェン [943832-81-3] + TX、イプフェントリフルコナゾール [1417782-08-1] + TX、メフェントリフルコナゾール [1417782-03-6] + TX、キノフメリン [861647-84-9] + TX、クロロプラレトリン [399572-87-3] + TX、シハロジアミド [1262605-53-7] + TX、フル
 アザインドリジン [1254304-22-7] + TX、フルキサメタミド [928783-29-3] + TX、ε-メトフルトリン [240494-71-7] + TX、ε-モ
 ンフルオロトリン [1065124-65-3] + TX、ピジフルメトフェン [1228

10

20

30

40

50

284-64-7]+TX、κ-ビフェントリン[439680-76-9]+TX、プロフラニド[1207727-04-5]+TX、ジクロロメゾチアズ[1263629-39-5]+TX、ジピメチトロン[16114-35-5]+TX、ピラジフルミド[942515-63-1]+TX及びκ-テフルトリン[391634-71-2]+TX；及び

以下を含む微生物：アシネトバクテールオフィイ (*Acinetobacter lwoffii*)+TX、アクレモニウムアルテルナタム (*Acremonium alternatum*)+TX+TX、アクレモニウムセファロスポリウム (*Acremonium cephalosporium*)+TX+TX、アクレモニウムジオスピリ (*Acremonium diospyri*)+TX、アクレモニウムオブカラバタム (*Acremonium obclavatum*)+TX、アドキソフィイスオラナグラヌロヴィルス (*Adoxophyes orana granulovirus*) (AdoxGV) (Capex (登録商標))+TX、アグロバクテリウムラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) 菌株K84 (Galltrol-A (登録商標))+TX、アルテルナリアアルテルナータ (*Alternaria alternata*)+TX、アルテルナリアカシヤ (*Alternaria cassia*)+TX、アルテルナリアデストルエンス (*Alternaria destruens*) (Smolder (登録商標))+TX、アムペロマイセススキスクアリス (*Ampelomyces quisqualis*) (AQ10 (登録商標))+TX、アスペルギルスフラブス (*Aspergillus flavus*) AF36 (AF36 (登録商標))+TX、アスペルギルスフラブス (*Aspergillus flavus*) NRRL 21882 (Aflaguard (登録商標))+TX、アスペルギルス属の種 (*Aspergillus* spp.)+TX、アウレオバシジウムプルランス (*Aureobasidium pullulans*)+TX、アゾスピリルム属 (*Azospirillum*)+TX、(MicroAZ (登録商標))+TX、TAZO B (登録商標))+TX、アゾトバクター (*Azotobacter*)+TX、アゾトバクタークロオクカム (*Azotobacter chroococcum*) (Azotomeal (登録商標))+TX、アゾトバクターシスツ (*Azotobacter cysts*) (Bionatural Blooming Blossoms (登録商標))+TX、バチルスアミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*)+TX、バチルスセレウス (*Bacillus cereus*)+TX、バチルスキチノスポルス (*Bacillus chitinosporus*) 菌株CM-1+TX、バチルスキチノスポルス (*Bacillus chitinosporus*) 菌株AQ746+TX、バチルスリケニホルミス (*Bacillus licheniformis*) 菌株HB-2 (Biostart (商標) Rhizoboost (登録商標))+TX、バチルスリケニホルミス (*Bacillus licheniformis*) 菌株3086 (EcoGuard (登録商標))+TX、Green Releaf (登録商標))+TX、バチルスシルクランス (*Bacillus circulans*)+TX、バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*) (BioSafe (登録商標))+TX、BioNem-WP (登録商標))+TX、VOTiVO (登録商標))+TX、バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*) 菌株I-1582+TX、バチルスマセランス (*Bacillus macerans*)+TX、バチルスマリスマルツイ (*Bacillus marismortui*)+TX、バチルスメガテリウム (*Bacillus megaterium*)+TX、バチルスマイコイデス (*Bacillus mycoides*) 菌株AQ726+TX、バチルスパピラエ (*Bacillus papillae*) (Milky Spore Powder (登録商標))+TX、バチルスプミルス属の種 (*Bacillus pumilus* spp.)+TX、バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*) 菌株GB34 (Yield Shield (登録商標))+TX、バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*) 菌株AQ717+TX、バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*) 菌株QST 2808 (Sona

ta (登録商標) + TX、Ballad Plus (登録商標) + TX、バチルスス
 ヘリクス (*Bacillus spahericus*) (VectoLex (登録商標)
) + TX、バチルス属の種 (*Bacillus spp.*) + TX、バチルス属の種 (*B
 acillus spp.*) 菌株AQ175 + TX、バチルス属の種 (*Bacillus
 spp.*) 菌株AQ177 + TX、バチルス属の種 (*Bacillus spp.*) 菌
 株AQ178 + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株
 QST 713 (CEASE (登録商標) + TX、Serenade (登録商標) + TX
 、Rhapsody (登録商標) + TX、バチルスサブチリス (*Bacillus s
 ubtilis*) 菌株QST 714 (JAZZ (登録商標) + TX、バチルスサブチ
 リス (*Bacillus subtilis*) 菌株AQ153 + TX、バチルスサブチリス 10
 (*Bacillus subtilis*) 菌株AQ743 + TX、バチルスサブチリス
 (*Bacillus subtilis*) 菌株QST3002 + TX、バチルスサブチリス
 (*Bacillus subtilis*) 菌株QST3004 + TX、バチルスサブチ
 リス var. アミロリクエファシエンス (*Bacillus subtilis var
 . amyloliquefaciens*) 菌株FZB24 (Taegro (登録商標) +
 TX、Rhizopro (登録商標) + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bac
 illus thuringiensis*) Cry 2Ae + TX、バチルスチューリング
 シス (*Bacillus thuringiensis*) Cry1Ab + TX、バチル
 スチューリングエンシスアイザワイ (*Bacillus thuringiensis a
 izawai*) GC 91 (Agree (登録商標) + TX、バチルスチューリング
 シスイスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis israel
 ensis*) (BMP123 (登録商標) + TX、Aquabac (登録商標) + TX、
 VectoBac (登録商標) + TX、バチルスチューリングエンシスクルスターキ (*B
 acillus thuringiensis kurstaki*) (Javelin (登録商標) + TX、Deliver (登録商標) + TX、CryMax (登録商標) + TX、Bonide (登録商標) + TX、Scutella WP (登録商標) + TX、Turilav WP (登録商標) + TX、Astuto (登録商標) + TX、Dipel WP (登録商標) + TX、Biobit (登録商標) + TX、Foray (登録商標) + TX、バチルスチューリングエンシスクルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) BMP 123 (Baritone (登録商標) + TX、バチルスチューリングエンシスクルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) HD-1 (Bioprotec-CAF/3P (登録商標) + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 菌株BD#32 + TX、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 菌株AQ52 + TX、バチルスチューリングエンシス変種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis var. aizawai*) (XenTari (登録商標) + TX、Dipel (登録商標) + TX、バクテリア属の種 (*bacteria spp.*) (GROWMEND (登録商標) + TX、GROW SWEET (登録商標) + TX、Shootup (登録商標) + TX、クラビパクターミシガンシス (*Clavipacter michiganensis*) のバクテリオファージ (AgriPhage (登録商標) + TX、Bakflor (登録商標) + TX、ベアウベリアバッシアナ (*Beauveria bassiana*) (Beaugenic (登録商標) + TX、Brocaril WP (登録商標) + TX、ベアウベリアバッシアナGHA (*Beauveria bassiana GHA*) (Mycotrol ES (登録商標) + TX、Mycotrol O (登録商標) + TX、Botani Guard (登録商標) + TX、ベアウベリアブロングニアルチイ (*Beauveria brongniartii*) (Engerlingspilz (登録商標) + TX、Schweizer Beauveria (登録商標) + TX、Melocont (登録商標) + TX、ポーベリア属の種 (*Beauveria spp.*) + TX、ボトリチスシネリア (*Botrytis cineria*) + TX、ダイズ根粒菌 (*Bradyr* 50

hizobium japonicum) (TerraMax (登録商標)) + TX、ブレバチルスブレビス (*Brevibacillus brevis*) + TX、バチルス
 チューリングゲンシステネブリオニス (*Bacillus thuringiensis tenebrionis*) (Novodor (登録商標)) + TX、Bt Booster
 + TX、バークホルデリアセパシア (*Burkholderia cepacia*) (Deny (登録商標)) + TX、Intercept (登録商標) + TX、Blue Circle (登録商標) + TX、バークホルデリアグラジイ (*Burkholderia gladii*) + TX、バークホルデリアグラジオリ (*Burkholderia gladioli*) + TX、バークホルデリア属の種 (*Burkholderia* spp.) + TX、カナディアンチスルファンガス (*Canadian thistle fungus*) (CBH Canadian Bioherbicide (登録商標)) + TX、カンジダブチリ (*Candida butyri*) + TX、カンジダファマタ (*Candida famata*) + TX、カンジダフルクツス (*Candida fructus*) + TX、カンジダグラブラタ (*Candida glabrata*) + TX、カンジダグイリエルモンディイ (*Candida guilliermondii*) + TX、カンジダメリビオシカ (*Candida melibiosica*) + TX、カンジダオレフィラ (*Candida oleophila*) 菌株 O + TX、カンジダパラプシロシス (*Candida parapsilosis*) + TX、カンジダペリクロサ (*Candida pelliculosa*) + TX、カンジダプルケリマ (*Candida pulcherrima*) + TX、カンジダレウカウフィイ (*Candida reukaufii*) + TX、カンジダサイトアナ (*Candida saitoana*) (Bio-Coat (登録商標)) + TX、Biocure (登録商標) + TX、カンジダサケ (*Candida sake*) + TX、カンジダ属の種 (*Candida* spp.) + TX、カンジダテニウス (*Candida tenuis*) + TX、セデセアドラビサエ (*Cedcea dravisae*) + TX、セルモナスフラビゲナ (*Cellulomonas flavigena*) + TX、カエトミウムコクリオデス (*Chaetomium cochliodes*) (Nova-Cide (登録商標)) + TX、カエトミウムグロボスム (*Chaetomium globosum*) (Nova-Cide (登録商標)) + TX、クロモバクテリウムサブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株 PRAA 4-1T (Grandevo (登録商標)) + TX、クラド
 スポリウムクラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) + TX、クラドスポリウムオキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*) + TX、クラドスポリウムクロロセファルム (*Cladosporium chlorocephalum*) + TX、クラドスポリウム属の種 (*Cladosporium* spp.) + TX、クラドスポリウムテヌイシマム (*Cladosporium tenuissimum*) + TX、クロノスタキスロゼア (*Clonostachys rosea*) (EndoFine (登録商標)) + TX、コレトリカムアクタタム (*Colletotrichum acutatum*) + TX、コニオチリウムミニタ
 ンス (*Coniothyrium minitans*) (Cotans WG (登録商標)) + TX、コニオチリウム属の種 (*Coniothyrium* spp.) + TX、クリプトコッカスアルビダス (*Cryptococcus albidus*) (YIELD PLUS (登録商標)) + TX、クリプトコッカスフミコラ (*Cryptococcus humicola*) + TX、クリプトコッカスインフィルミニアツス (*Cryptococcus infirmo-miniatum*) + TX、クリプトコッカスラウレン
 チイ (*Cryptococcus laurentii*) + TX、クリプトフレビアロイコトレタグラニュロウイルス (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (Cryptex (登録商標)) + TX、クプリアビダスカム
 ピネンシス (*Cupriavidus campinensis*) + TX、シジアボモネラグラニュロウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (CYD-X (登録商標)) + TX、シジアボモネラグラニュロウイルス (*Cydia*

pomonella granulovirus) (Madex (登録商標) + TX、Madex Plus (登録商標) + TX、Madex Max / Carpovirusine (登録商標) + TX、エビコウヤクタケ (Cylindrobasidium laeve) (Stumpout (登録商標) + TX、シリンドロクラジウム属 (Cylindrocladium) + TX、デバリオマイセスハンセニイ (Debaryomyces hansenii) + TX、ドレックスレハワイイネンシス (Drechslera hawaiiensis) + TX、エンテロバクタークロアカ (Enterobacter cloacae) + TX、エンテロバクターイアカ (Enterobacteriaceae) + TX、エントモフトラヴィルレンタ (Entomophthora virulenta) (Vektor (登録商標) + TX、エピコッカムニグラム (Epicoccum nigrum) + TX、エピコッカムプルプラセンズ (Epicoccum purpurascens) + TX、エピコッカム属の種 (Epicoccum spp.) + TX、フィロバシジウムフロリホルム (Filobasidium floriforme) + TX、フザリウムアクミナタム (Fusarium acuminatum) + TX、フザリウムクラミドスポルム (Fusarium chlamydosporum) + TX、フザリウム オキシスポルム (Fusarium oxysporum) (Fusaclean (登録商標) / Biofox C (登録商標) + TX、フザリウムプラリフェラタム (Fusarium proliferatum) + TX、フザリウム属の種 (Fusarium spp.) + TX、グララクトマイセスゲオトリクム (Galactomyces geotrichum) + TX、グリオクラジウムカテヌラタム (Gliocladium catenulatum) (Primastop (登録商標) + TX、Prestop (登録商標) + TX、グリオクラジウムロセウム (Gliocladium roseum) + TX、グリオクラジウム属の種 (Gliocladium spp.) (SoilGard (登録商標) + TX、グリオクラジウムビレンス (Gliocladium virens) (Soilgard (登録商標) + TX、グラニューロウイルス (Granulovirus) (Granupom (登録商標) + TX、ハロバシルスハロフィルス (Halobacillus halophilus) + TX、ハロバシルスリトラリス (Halobacillus litoralis) + TX、ハロバシルストルエペリ (Halobacillus trueperi) + TX、ハロモナス属の種 (Halomonas spp.) + TX、ハロモナススブグラシエスコラ (Halomonas subglaciescola) + TX、ハロビブリオバリアビリス (Halovibrio variabilis) + TX、ハンセニアスポラウバルム (Hanseniaspora uvarum) + TX、オオタバコガ (Helicoverpa armigera) 核多核体ウイルス (Helicoverpa ex (登録商標) + TX、アメリカタバコガ (Helicoverpa zea) 核多角体病ウイルス (Gemstar (登録商標) + TX、イソフラボンーホルモノネチン (Myconate (登録商標) + TX、クロエケラアピクラタ (Kloeckera apiculata) + TX、クロエケラ属の種 (Kloeckera spp.) + TX、ラゲニジウムギガンテウム (Lagenidium giganteum) (Lagindex (登録商標) + TX、オンシツコナジラミ (Lecanicillium longisporum) (Vertiblast (登録商標) + TX、レカニシリウムムスカリウム (Lecanicillium muscarium) (Vertikil (登録商標) + TX、マイマイガ (Lymantria dispar) 核多角体病ウイルス (Disparvirus (登録商標) + TX、マリノコッカスハロフィルス (Marinococcus halophilus) + TX、メイラゲウラコニギイ (Meira geulakonigii) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (Metarhizium anisopliae) (Met52 (登録商標) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (Metarhizium anisopliae) (Destruxin WP (登録商標) + TX、メチニコビアフルチコラ (Metschnikowia fruticola) (Shemer (登録商標) + TX、メチニコビアブル

ケリマ (*Metschnikowia pulcherrima*) +TX、ミクロドキウムジメルム (*Microdochium dimerum*) (Antibot (登録商標)) +TX、ミクロモノスポラコエルレア (*Micromonospora coerulea*) +TX、ミクロスファエロプシスオクラセア (*Microsphaeropsis ochracea*) +TX、ムスコドルアルブス (*Muscudor albus*) 620 (*Muscudor* (登録商標)) +TX、ムスコドルロセウス (*Muscodor roseus*) 菌株A3-5 +TX、ミコルヒザエ属の種 (*Mycorrhizae spp.*) (AMykor (登録商標)) +TX、Root Maximizer (登録商標)) +TX、ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 菌株AARC-0255 (*DiTera* (登録商標)) +TX、BROS PLUS (登録商標) +TX、オフィオストマピリフェルム (*Ophiostoma piliiferum*) 菌株D97 (*Sylvanex* (登録商標)) +TX、パエシロマイセスファリノス (*Paecilomyces farinosus*) +TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (PFR-97 (登録商標)) +TX、PreFeRal (登録商標)) +TX、パエシロマイセスリナシス (*Paecilomyces linacinus*) (Biostat WP (登録商標)) +TX、パエシロマイセスリラシス (*Paecilomyces lilacinus*) 菌株251 (*MeloCon WG* (登録商標)) +TX、パエニバチルスポリミクサ (*Paenibacillus polymyxa*) +TX、パントエアアグロメランス (*Pantoea agglomerans*) (BlightBan C9-1 (登録商標)) +TX、パントエア属の種 (*Pantoea spp.*) +TX、パスツリア属の種 (*Pasteuria spp.*) (Econem (登録商標)) +TX、パスツリアニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) +TX、ペニシリウムオーランチオグリセウム (*Penicillium aurantiogriseum*) +TX、ペニシリウムビライ (*Penicillium billai*) (Jumpstart (登録商標)) +TX、TagTeam (登録商標)) +TX、ペニシリウムブレビコンパクト (*Penicillium brevicompactum*) +TX、ペニシリウムフレクエンタンス (*Penicillium frequentans*) +TX、ペニシリウムグリセオフルバム (*Penicillium griseofulvum*) +TX、ペニシリウムプルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) +TX、ペニシリウム属の種 (*Penicillium spp.*) +TX、ペニシリウムビリディカタム (*Penicillium viridicatum*) +TX、フレビオプシスゲガンテアン (*Phlebiopsis gigantea*) (Rotstop (登録商標)) +TX、リン溶解菌 (*Phosphomeal* (登録商標)) +TX、フィトフトラクリプトギア (*Phytophthora cryptogea*) +TX、フィトフトラパルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Devine (登録商標)) +TX、ピチアアノマラ (*Pichia anomala*) +TX、ピチアグイレルモンディイ (*Pichia guilhermondii*) +TX、ピチアメンプランファイエンス (*Pichia membranaefaciens*) +TX、ピチアオニキス (*Pichia onychis*) +TX、ピチアステピテス (*Pichia stipites*) +TX、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*) +TX、シュードモナスアウレオファシエンス (*Pseudomonas aureofasciens*) (Spot-Less Biofungicide (登録商標)) +TX、シュードモナスセバシア (*Pseudomonas cepacia*) +TX、シュードモナスクロラフィス (*Pseudomonas chloraphis*) (AtEze (登録商標)) +TX、シュードモナスコルゲート (*Pseudomonas corrugate*) +TX、シュードモナスフルオレッセンス (*Pseudomonas fluorescens*) 菌株A506 (BlightBan A506 (登録商標)) +TX、シュードモナスプチダ (*Pseudomonas putida*) +TX、シュードモナスリアクタンス (*Pseudomonas rea*

ctans) + TX、シュードモナス属の種 (*Pseudomonas* spp.) + TX、シュードモナスシリングエ (*Pseudomonas syringae*) (Bio-Save (登録商標)) + TX、シュードモナスビリジフラバ (*Pseudomonas viridiflava*) + TX、蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*) (Zequanox (登録商標)) + TX、シュードジマフロクロッサ (*Pseudozyma flocculosa*) 菌株 PF-A22 UL (Sporodex L (登録商標)) + TX、プッシニアカナリクラタ (*Puccinia canaliculata*) + TX、プッシニアトラスペオス (*Puccinia thlaspeos*) (Wood Warrior (登録商標)) + TX、ピシウムパロエカンドルム (*Pythium paroecandrum*) + TX、ピシウムオリガンドラム (*Pythium oligandrum*) (Polygandron (登録商標)) + TX、Polyversum (登録商標)) + TX、ピシウムペリプロクム (*Pythium periplocum*) + TX、ラネラアクアチリス (*Rhanelia aquatilis*) + TX、ラネラ属の種 (*Rhanelia* spp.) + TX、根粒菌 (Dormal (登録商標)) + TX、Vault (登録商標)) + TX、リゾクトニア属の種 (*Rhizoctonia*) + TX、ロドコッカスグロベルルス (*Rhodococcus globerulus*) 菌株 AQ719 + TX、ロドスポリジウムディオボバタム (*Rhodospiridium diobovatum*) + TX、ロドスポリジウムトルロイデス (*Rhodospiridium toruloides*) + TX、ロドトルラ属の種 (*Rhodotorula* spp.) + TX、ドトルラグルチニス (*Rhodotorula glutinis*) + TX、ロドトルラグラミニス (*Rhodotorula graminis*) + TX、ロドトルラムシラグノサ (*Rhodotorula mucilagnosa*) + TX、ロドトルラルブラ (*Rhodotorula rubra*) + TX、サッカロマイセスセレビスエ (*Saccharomyces cerevisiae*) + TX、サリノコッカスロセウス (*Salinococcus roseus*) + TX、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia minor*) + TX、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia minor*) (SARRITOR (登録商標)) + TX、シタリジウム属の種 (*Scytalidium* spp.) + TX、シタリジウムウレジニコラ (*Scytalidium uredinicola*) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) 核多角体病ウイルス (Spod-X (登録商標)) + TX、Spexit (登録商標)) + TX、セラチアマルセセンス (*Serratia marcescens*) + TX、セラチアプリムシカ (*Serratia plymuthica*) + TX、セラチア属の種 (*Serratia* spp.) + TX、ソルダリアフィミコラ (*Sordaria fimicola*) + TX、エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) 核多核体ウイルス (Littovir (登録商標)) + TX、スポロボロミセスロセウス (*Sporobolomyces roseus*) + TX、ステノトロホモナスマルトフィリア (*Stenotrophomonas maltophilia*) + TX、ストレプトマイセスアヒグロスコピクス (*Streptomyces ahigroscopicus*) + TX、ストレプトマイセスアルバドンカス (*Streptomyces albaduncus*) + TX、ストレプトマイセスエクサホリアテス (*Streptomyces exfoliates*) + TX、ストレプトマイセスガルブス (*Streptomyces galbus*) + TX、ストレプトマイセスグリセオプラヌス (*Streptomyces griseoplanus*) + TX、ストレプトマイセスグリセオビリディス (*Streptomyces griseoviridis*) (Mycostop (登録商標)) + TX、ストレプトマイセスリディクス (*Streptomyces lydicus*) (Actinovate (登録商標)) + TX、ストレプトマイセスリディクス (*Streptomyces lydicus*) WYEC-108 (ActinoGrow (登録商標)) + TX、ストレプトマイセスビオラセウス (*Streptomyces violaceus*) + TX、チレチオプシスミノル (*Tilletiopsis minor*) + TX、チレ

チオプシス属の種 (*Tilletiopsis* spp.) +TX、トリコデルマアスペレ
 レルム (*Trichoderma asperellum*) (T34 Biocontrol (登録商標)) +TX、トリコデルマガムシイ (*Trichoderma gams
 ii*) (Tenet (登録商標)) +TX、トリコデルマアトロビリデ (*Trichod
 erma atroviride*) (Plantmate (登録商標)) +TX、トリコ
 デルマハマツム (*Trichoderma hamatum*) TH 382 +TX、トリ
 コデルマハルジアヌムリファイ (*Trichoderma harzianum rif
 ai*) (Mycostar (登録商標)) +TX、トリコデルマハルジアヌム (*Tric
 hoderma harzianum*) T-22 (Trianium-P (登録商標)) +T
 X、PlantShield HC (登録商標) +TX、RootShield (登録商
 標) +TX、Trianium-G (登録商標)) +TX、トリコデルマハルジアヌム (*T
 richoderma harzianum*) T-39 (Trichodex (登録商標
)) +TX、トリコデルマインハマツム (*Trichoderma inhamatum*
) +TX、トリコデルマコニングイ (*Trichoderma koningii*) +T
 X、トリコデルマ属の種 (*Trichoderma* spp.) LC 52 (Senti
 nel (登録商標)) +TX、トリコデルマリグノルム (*Trichoderma li
 gnorum*) +TX、トリコデルマロンギブラキアツム (*Trichoderma l
 ongibrachiatum*) +TX、トリコデルマポリスボルム (*Trichode
 rma polysporum*) (Binab T (登録商標)) +TX、トリコデルマ
 タクシ (*Trichoderma taxi*) +TX、トリコデルマビレンス (*Tric
 hoderma virens*) +TX、トリコデルマビレンス (*Trichoderm
 a virens*) (旧名グリオクラジウムビレンス (*Gliocladium vir
 ens*) GL-21) (SoilGuard (登録商標)) +TX、トリコデルマビリデ
 (*Trichoderma viride*) +TX、トリコデルマビリデ (*Tricho
 derma viride*) 菌株 ICC 080 (Remedier (登録商標)) +T
 X、トリコスポロンブルランス (*Trichosporon pullulans*) +T
 X、トリコスポロン属の種 (*Trichosporon* spp.) +TX、トリコテシ
 ウム属の種 (*Trichothecium* spp.) +TX、トリコテシウムロセウム
 (*Trichothecium roseum*) +TX、アカエガマノホタケ (*Typh
 ula phacorrhiza*) 菌株 94670 +TX、アカエガマノホタケ (*Typ
 hula phacorrhiza*) 菌株 94671 +TX、ウロクラディウムアトラム
 (*Ulocladium atrum*) +TX、ウロクラディウムオウデマンシイ (*Ul
 ocladium oudemansii*) (Botry-Zen (登録商標)) +TX
 、ウスチラゴマイディス (*Ustilago maydis*) +TX、様々な細菌及び補
 助微量栄養素 (Natural II (登録商標)) +TX、様々な真菌 (Millen
 nium Microbes (登録商標)) +TX、ベルチシリウムクラミドスポリウム
 (*Verticillium chlamydosporium*) +TX、ベルチシリウ
 ムレカニイ (*Verticillium lecanii*) (Mycotal (登録商標
)) +TX、Vertalec (登録商標)) +TX、Vip3Aa20 (VIPTera
 (登録商標)) +TX、ビルギバクリルスマリスモルツイ (*Virgibacillu
 s marismortui*) +TX、キサントモナス カムペストリス pv. ポアエ (*Xanthomonas campestris
 pv. Poae*) (Camperico (登録商標)) +TX、ゼノラブダスボビエニイ (*Xenorhabdus bovi
 enii*) +TX、ゼノラブダスネマトフィルス (*Xenorhabdus nemat
 ophilus*) ; 及び
 以下を含む植物抽出物 : 松油 (Retenol (登録商標)) +TX、アザジラクチン (*Plasma Neem Oil* (登録商標) +TX、AzaGuard (登録商標) +
 TX、MeemAzaal (登録商標) +TX、Molt-X (登録商標) +TX、植物性
 の昆虫成長制御剤 (Botanical IGR) (Neemazad (登録商標) +T
 X、Neemix (登録商標)) +TX、ナタネ油 (Lilly Miller Veg

ol (登録商標)) + TX、アメリカアリタソウ (*Chenopodium ambrosioides* near *ambrosioides*) (Requiem (登録商標)) + TX、キク属 (*Chrysanthemum*) 抽出物 (Crisant (登録商標)) + TX、ニーム油の抽出物 (Trilogy (登録商標)) + TX、シソ科植物 (*Labiatae*) の精油 (Botania (登録商標)) + TX、クローブローズマリーペパーミント及びタイム油の抽出物 (Garden insect killer (登録商標)) + TX、グリシンベタイン (Greenstim (登録商標)) + TX、ニンニク + TX、レモングラス油 (GreenMatch (登録商標)) + TX、ニーム油 + TX、イヌハッカ (*Nepeta cataria*) (キャットニップ油) + TX、イヌハッカ (*Nepeta catarina*) + TX、ニコチン + TX、オレガノ油 (Moss Buster (登録商標)) + TX、ゴマ科植物 (*Pedaliaceae*) 油 (Nematon (登録商標)) + TX、除虫菊 + TX、シャボンノキ (*Quillaja saponaria*) (NemaQ (登録商標)) + TX、オオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) (Regalia (登録商標)) + TX、Sakalia (登録商標)) + TX、ロテノン (Eco Roten (登録商標)) + TX、ミカン科植物 (*Rutaceae*) 抽出物 (Soleo (登録商標)) + TX、大豆油 (*Orthoecosense* (登録商標)) + TX、ティーツリー油 (Timorex Gold (登録商標)) + TX、タイム油 + TX、AGNIQUE (登録商標) MMF + TX、Bug Oil (登録商標) + TX、ローズマリーゴマペパーミントタイム及びシナモン抽出物の混合物 (EF 300 (登録商標)) + TX、クローブローズマリー及びペパーミント抽出物の混合物 (EF 400 (登録商標)) + TX、クローブペパーミントニンニク油及びミントの混合物 (Soil Shot (登録商標)) + TX、カオリン (Screen (登録商標)) + TX、褐藻類の貯蔵グルカン (Laminarin (登録商標)) ; 及び

以下のものを含むフェロモン：クロネハイイロヒメハマキ (*blackheaded fireworm*) フェロモン (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone (登録商標)) + TX、コドリング (*Codling Moth*) フェロモン (Paramount dispenser - (CM) / Isomate C-Plus (登録商標)) + TX、グレープベリーモス (*Grape Berry Moth*) フェロモン (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone (登録商標)) + TX、ハマキガ科のガ (*Leafroller*) フェロモン (3M MEC-LR Sprayable Pheromone (登録商標)) + TX、Muscamone (Snip7 Fly Bait (登録商標)) + TX、Starbar Premium Fly Bait (登録商標)) + TX、ナシヒメシンクイ (*Oriental Fruit Moth*) フェロモン (3M oriental fruit moth sprayable pheromone (登録商標)) + TX、スカシバガ科のガ (*Peachtree Borer*) フェロモン (Isomate-P (登録商標)) + TX、トマトピンworm (Tomato Pinworm) フェロモン (3M Sprayable pheromone (登録商標)) + TX、Entostat 粉末 (ヤシの木からの抽出物) (Exosex CM (登録商標)) + TX、(E+TX, Z+TX, Z) - 3+TX、8+TX、11テトラデカトリエニルアセテート + TX、(Z+TX, Z+TX, E) - 7+TX、11+TX、13-ヘキサデカトリエナール + TX、(E+TX, Z) - 7+TX、9-ドデカジエン-1-イルアセテート + TX、2-メチル-1-ブタノール + TX、酢酸カルシウム + TX、Scenturion (登録商標) + TX、Biolure (登録商標) + TX、Check-Mate (登録商標) + TX、ラバンズリルセネシオアート (*Lavandulyl senecioate*) ; 及び

以下を含む生物 (*Macrobials*) : アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) + TX、エルビアブラバチ (*Aphidius ervi*) (*Aphelinus-System* (登録商標)) + TX、アセロファガス・パパイヤ (*Ace*

10

20

30

40

50

rophagus papaya) +TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adalia-System (登録商標)) +TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adaline (登録商標)) +TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Aphidalia (登録商標)) +TX、アゲニアスピス・シトリコラ (Ageniaspis citricola) +TX、アゲニアスピス・フシコリス (Ageniaspis fuscicollis) +TX、アンブリセイウス・アンデルソニ (Amblyseius andersoni) (Anderline (登録商標)) +TX、Andersoni-System (登録商標)) +TX、アンブリセイウス・カリフォルニクス (Amblyseius californicus) (Amblyline (登録商標)) +TX、Spical (登録商標)) +TX、アンブリセイウス・ククメリス (Amblyseius cucumeris) (Thripex (登録商標)) +TX、Bugline cucumeris (登録商標)) +TX、アンブリセイウス・ファラキス (Amblyseius fallacis) (Fallacis (登録商標)) +TX、スワルスキーカブリダニ (Amblyseius swirskii) (Bugline swirskii (登録商標)) +TX、Swirskii-Mite (登録商標)) +TX、ケナガカブリダニ (Amblyseius womersleyi) (WomerMite (登録商標)) +TX、アミツス・ヘスペリヅム (Amitus hesperidum) +TX、アナグルス・アトムス (Anagrus atomus) +TX、アナギルス・フスシベントリス (Anagyrus fusciventris) +TX、アナギルス・カマリ (Anagyrus kamali) +TX、Anagyrus loeckii +TX、アナギルス・シュードコッカス (Anagyrus pseudococchi) (Citripar (登録商標)) +TX、アニセツス・ベネフィクス (Anicetus benefices) +TX、ゾウムシコガネコバチ (Anisopteromalus calandrae) +TX、アントコリス・ネモラリス (Anthocoris nemoralis) (Anthocoris-System (登録商標)) +TX、アブラコバチ (Aphelinus abdominalis) (Apheline (登録商標)) +TX、Aphiline (登録商標)) +TX、アフエリヌス・アシキス (Aphelinus asychis) +TX、アフイジウス・コレマニ (Aphidius colemani) (Ahipar (登録商標)) +TX、エルビアブラバチ (Aphidius ervi) (Ervipar (登録商標)) +TX、アフイジウス・ギフエンシス (Aphidius gifuensis) +TX、アフイジウス・マトリカリアエ (Aphidius matricariae) (Ahipar-M (登録商標)) +TX、アフイドレテス・アフイディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidend (登録商標)) +TX、アフイドレテス・アフイディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidoline (登録商標)) +TX、アフイチス・リングナネンシス (Aphytis lingnanensis) +TX、アフイチス・メリヌス (Aphytis melinus) +TX、アプロストセツス・ヘゲノウイ (Aprostocetus hagenowii) +TX、アセタ・コリアリア (Atheta coriaria) (Staphyline (登録商標)) +TX、マルハナバチ属 (Bombus spp.) +TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Natupol Beehive (登録商標)) +TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Beeline (登録商標)) +TX、Tripol (登録商標)) +TX、セファロノミア・ステファノデリス (Cephalonomia stephanoderis) +TX、チノコルス・ニグリツス (Chilocorus nigritus) +TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysoline (登録商標)) +TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysopa (登録商標)) +TX、クリソペルラ・ルフイラブリス (Chrysoperla rufilabris) +TX、シロスピルス・インゲヌウス (Cirrospilus

10

20

30

40

50

ingenuus) + TX、シロスピルス・クアドリストリアツス (Cirrospilus quadristriatus) + TX、シトロスチクス・フィロクニストイデス (Citrostichus phyllocnistoides) + TX、クロステロセルス・カマエレオン (Closterocherus chamaeleon) + TX、クロステロセルス属 (Closterocherus spp.) + TX、コシドキセノイデス・ペルミヌツス (Coccidoxenoides perminutus) (Planopar (登録商標)) + TX、コッコファグス・コウペリ (Coccophagus cowperi) + TX、コッコファグス・リシムニア (Coccophagus lycimnia) + TX、キアシサムライコマユバチ (Cotesia flavipes) + TX、コナガサムライコマユバチ (Cotesia plutellae) + TX、ツマアカオオテントウムシ (Cryptolaemus montrouzieri) (Cryptobug (登録商標)) + TX、Cryptoline (登録商標)) + TX、キムネタマキスイ (Cybocephalus nipponicus) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) (Minusa (登録商標)) + TX、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) (Diminex (登録商標)) + TX、デルファスツス・カタリナエ (Delphastus catalinae) (Delphastus (登録商標)) + TX、デルファスツス・プシルス (Delphastus pusillus) + TX、ジアカスミモルファ・クラウシイ (Diachasmimorpha krausii) + TX、ジアカスミモルファ・ロンギカウダタ (Diachasmimorpha longicaudata) + TX、ジアバルシス・ジュクンダ (Diaparsis jucunda) + TX、ジアホレンシルツス・アリガレンシス (Diaphorencyrtus aligarhensis) + TX、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) + TX、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) (Miglyphus (登録商標)) + TX、Digline (登録商標)) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) (DacDigline (登録商標)) + TX、Minex (登録商標)) + TX、ディベルシネルプス属 (Diversinervus spp.) + TX、エンカルシア・シトリナ (Encarsia citrina) + TX、オンシツツヤコバチ (Encarsia formosa) (Encarsia max (登録商標)) + TX、Encarline (登録商標)) + TX、En-Strip (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmoceris eremicus) (Enermix (登録商標)) + TX、エンカルシア・グアデロウパエ (Encarsia guadeloupae) + TX、エンカルシア・ハンティエンシス (Encarsia haitiensis) + TX、ホソヒラタアブ (Epsyrphus balteatus) (Syrphidend (登録商標)) + TX、エレットモセリス・シフォニニ (Eretmoceris siphonini) + TX、エレットモセルス・カリフォルニクス (Eretmoceris californicus) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmoceris eremicus) (Ercal (登録商標)) + TX、Eretline e (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmoceris eremicus) (Bemimix (登録商標)) + TX、エレットモセルス・ハヤチ (Eretmoceris hayat) + TX、エレットモセルス・ムンヅス (Eretmoceris mundus) (Bemipar (登録商標)) + TX、Eretline m (登録商標)) + TX、エレットモセルス・シフォニニ (Eretmoceris siphonini) + TX、エキソコムス・クアドリプスツラツス (Exochomus quadripustulatus) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (Feltiella acarisuga) (Spidend (登録商標)) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (Feltiella acarisuga) (Feltiline (登録商標)) + TX、フォピウス・アリスヌス (Fopius arisanus) + TX、フォピウス・セラチチボルス (Fopius ceratitivorus) + TX、ホルモノネチン (Wireless B

ee home (登録商標)) + TX、アリガタシマアザミウマ (Franklinothrips vespiiformis) (Vespop (登録商標)) + TX、ガレンドロムス・オシデンタリス (Galendromus occidentalis) + TX、ゴニオズス・レグネリ (Goniozus legneri) + TX、シマメイガコマユバチ (Habrobracon hebetor) + TX、ナミテントウ (Harmonia axyridis) (HarmoBeetle (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス属 (Heterorhabditis spp.) (Lawn Patrol (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (Heterorhabditis bacteriophora) (NemaShield HB (登録商標)) + TX、Nemaseek (登録商標) + TX、Terranem-Nam (登録商標) + TX、Terranem (登録商標) + TX、Larvanem (登録商標) + TX、B-Green (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nematop (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・メジディス (Heterorhabditis megidis) (Nemasys H (登録商標) + TX、BioNem H (登録商標) + TX、Exhibitline hm (登録商標) + TX、Larvanem-M (登録商標)) + TX、サカハチテントウ (Hippodamia convergens) + TX、ヒポアスピス・アクレイファー (Hypoaspis aculeifer) (Aculeifer-System (登録商標) + TX、Entomite-A (登録商標)) + TX、ヒポアスピス・ミルス (Hypoaspis miles) (Hypoline m (登録商標) + TX、Entomite-M (登録商標)) + TX、ルバリア・レウコスポイデス (Lbalia leucospoides) + TX、レカノイデウス・フロシムス (Lecanoideus floccissimus) + TX、レモファグス・エラブンズス (Lemophagus errabundus) + TX、レプトマスチデア・アブノルミス (Leptomastidea abnormis) + TX、レプトマスチクス・ダクチロピ (Leptomastix dactylopii) (Leptopar (登録商標)) + TX、レプトマスチクス・エポナ (Leptomastix epona) + TX、リンドルス・ロファンタエ (Lindorus lophanthae) + TX、リポレクシス・オレグマエ (Lipolexis oregmae) + TX、ルシリア・カエサル (Lucilia caesar) (Natufly (登録商標)) + TX、リシフレプス・テストケイペス (Lysiphlebus testaceipes) + TX、マクロロフス・カリギノスス (Macrolophus caliginosus) (Mirical-N (登録商標) + TX、Macroline c (登録商標) + TX、Mirical (登録商標)) + TX、メソセイウルス・ロンギペス (Mesoseiulus longipes) + TX、メタフィクス・フラプス (Metaphycus flavus) + TX、メタフィクス・ロウンスブレイ (Metaphycus lounsburyi) + TX、ミクロムス・アングラツス (Micromus angulatus) (Milacewing (登録商標)) + TX、ミクロテリス・フラプス (Microterys flavus) + TX、ムスシディフラクス・ラポトレルス (Muscidifurax raptorellus) 及びスバランギア・カメロニ (Spalangia cameroni) (Biopar (登録商標)) + TX、ネオドリイヌス・チフロシバエ (Neodryinus typhlocybae) + TX、ミヤコカブリダニ (Neoseiulus californicus) + TX、ネオセイウルス・ククメリス (Neoseiulus cucumeris) (THRYPEX (登録商標)) + TX、ネオセイウルス・ファラシス (Neoseiulus fallacis) + TX、ネシディオコリス・テヌイス (Nesideocoris tenuis) (NesidioBug (登録商標) + TX、Nesibug (登録商標)) + TX、オフィラ・アエネセンス (Ophyra aenescens) (Biofly (登録商標)) + TX、シノビハナカメムシ (Orius insidiosus) (Thripor-I (登録商標) + TX、Oriline i (登録商標)) + TX、エルヒメハナカメムシ (Orius laevigatus

) (Thrip or-L (登録商標) +TX、Oriline l (登録商標)) +TX
 、オリウス・マジュスクルス (Orius majusculus) (Oriline
 m (登録商標)) +TX、タイリクヒメハナカメムシ (Orius strigicol
 lis) (Thrip or-S (登録商標)) +TX、パウエシア・ジュニペロルム (P
 auesia juniperorum) +TX、ペディオビウス・ホベオレツス (Pe
 diobius foveolatus) +TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフ
 ロディタ (Phasmarhabditis hermaphrodita) (Nema
 slug (登録商標)) +TX、フィマスティクス・コフエア (Phymastichu
 s coffea) +TX、フィトセイウルス・マクロピルス (Phytoseiulu
 s macropilus) +TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus pe
 rsimilis) (Spidex (登録商標) +TX、Phytoline p (登録
 商標)) +TX、ポディスス・マクリベントリス (Podisus maculiven
 tris) (Podisus (登録商標)) +TX、シューダクテオン・クルバツス (P
 seudacteon curvatus) +TX、シューダクテオン・オブツスス (P
 seudacteon obtusus) +TX、シューダクテオン・トリクスピス (P
 seudacteon tricuspis) +TX、シューダフィクス・マクリペンニ
 ス (Pseudaphycus maculipennis) +TX、シュードレプトマ
 スティクス・メキシカーナ (Pseudleptomastix mexicana) +
 TX、サイラエファグス・ピロスス (Psyllaephagus pilosus) +
 TX、サイタリア・コンコロール (Psytalia concolor) (複合体) +
 TX、クアドラスティクス属 (Quadrastichus spp.) +TX、リゾビ
 ウス・ロファンタエ (Rhyzobius lophanthae) +TX、ベダリアテ
 ントウ (Rodolia cardinalis) +TX、オオクビキレガイ (Rumi
 na decollate) +TX、セミエラケア・ペティオラツス (Semiela
 c her petiolatus) +TX、シトビオン・アベナエ (Sitobion a
 venae) (Ervibank (登録商標)) +TX、スタイナーネマ・カーポブサエ
 (Steinernema carpocapsae) (Nematac C (登録商標
) +TX、Millenium (登録商標) +TX、BioNem C (登録商標) +T
 X、NemAttack (登録商標) +TX、Nemastar (登録商標) +TX、C
 aps anem (登録商標)) +TX、スタイナーネマ・フェルティアエ (Steine
 rnema feltiae) (NemaShield (登録商標) +TX、Nemas
 ys F (登録商標) +TX、BioNem F (登録商標) +TX、Steinern
 ema-System (登録商標) +TX、NemAttack (登録商標) +TX、N
 emaplus (登録商標) +TX、Exhibitline sf (登録商標) +TX
 、Scia-rid (登録商標) +TX、Entonem (登録商標)) +TX、スタイ
 ナーネマ・クラッセイ (Steinernema kraussei) (Nemasys
 L (登録商標) +TX、BioNem L (登録商標) +TX、Exhibitlin
 e srb (登録商標)) +TX、スタイナーネマ・リオブラベ (Steinernem
 a riobrave) (BioVector (登録商標) +TX、BioVektor
 (登録商標)) +TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (Steinernema sc
 apterisci) (Nematac S (登録商標)) +TX、スタイナーネマ属 (S
 teinernema spp.) +TX、スタイナーネマチド属 (Steinern
 ematid spp.) (Guardian Nematodes (登録商標)) +T
 X、ステトルス・プンクチルム (Stethorus punctillum) (Ste
 thorius (登録商標)) +TX、タマリキシア・ラジアタ (Tamarixia r
 adiate) +TX、テトラスティクス・セティファー (Tetrastichus
 setifer) +TX、トリポビウス・セミルテウス (Thripobius sem
 iluteus) +TX、トリムス・シネンシス (Torymus sinensis)
 +TX、タマゴヤドリバチ (Trichogramma brassicae) (Tri
 choline b (登録商標)) +TX、タマゴヤドリバチ (Trichogramm

10

20

30

40

50

a brassicae) (Trichostema (登録商標)) + TX、ヨトウタマゴバチ (Trichogramma evanescens) + TX、トリコグラマ・ミヌツム (Trichogramma minutum) + TX、アワノメイガタマゴバチ (Trichogramma ostriniae) + TX、トリコグラマ・プラトネリ (Trichogramma platneri) + TX、トリコグラマ・プレチオスム (Trichogramma pretiosum) + TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (Xanthopimpla stermator) ; 及び

以下のものを含む他の生物学的製剤：アブシジン酸 + TX、bioSea (登録商標) + TX、コンドロステレウム・プルプレウム (Chondrostereum purpureum) (Chontrol Paste (登録商標)) + TX、コレトリウム・グ
10
レオスポリオイデス (Colletotrichum gloeosporioides) (Collego (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (Cueva (登録商標)) + TX、デルタトラップ (Trapline d (登録商標)) + TX、エルウィニア・アミロボラ (Erwinia amylovora) (ハービン) (ProAct (登録商標)) + TX、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標)) + TX、リン酸第二鉄 (Ferri-phosphate) (Ferramol (登録商標)) + TX、ファネルトラップ (Trapline y (登録商標)) + TX、Gallex (登録商標) + TX、Grower's Secret (登録商標) + TX、ホモブラシノリド (Hom
20
o-brassonolide) + TX、リン酸鉄 (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait (登録商標)) + TX、MCP hailトラップ (Trapline f (登録商標)) + TX、ミクロクトヌス・ヒペロダエ (Microctonus hyperodae) + TX、ミコレプトジスクス・テレストリス (Mycroleptodiscus terrestris) (Des-X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Amino
mite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ (Thripline
30
ams (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム (MilStop (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (Sanova (登録商標)) + TX、ケイ酸カリウム溶液 (Sil-Matrix (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム + チオシアン酸カリウム (Enzicur (登録商標)) + TX、SuffOil-X (登録商標) + TX、クモ毒 + TX、ノセマ・ロクスタエ (Nosema locustae) (Se
40
maspore Organic Grasshopper Control (登録商標)) + TX、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標)) + TX、Rebell Amarillo (登録商標)) + TX 及びトラップ (Takitrapline y + b (登録商標)) + TX ; 又は

以下から選択される生物学的に有効な化合物又は薬剤：プロフルトリネート + TX、ジフロヴィダジン + TX、フロメトキン + TX、フルヘキサホン + TX、コナガ (Plutella xylostella) グラニューロシスウイルス + TX、コドリナガ (Cyd
50
ia pomonella) グラニューロシスウイルス + TX、イミシアホス + TX、ニセアメリカタバコガ (Heliothis virescens) 核多核体ウイルス + TX、ヘリオチスプンクチゲラ (Heliothis punctigera) 核多核体ウイルス + TX、アメリカタバコガ (Helicoverpa zea) 核多核体ウイルス + TX、スポドプテラフルギベルダ (Spodoptera frugiperda) 核多核体ウイルス + TX、コナガ (Plutella xylostella) 核多核体ウイルス + TX、p-シメン + TX、ピフルブミド + TX、ピラフルプロール + TX、QRD 420 + TX、QRD 452 + TX、QRD 460 + TX、テルペノイドブレン
ド + TX、テルペノイド + TX、テトラニリプロール + TX 及び α-テルピネン + TX ; 又は

以下のものなどのコード + TX によって参照される有効物質：コード AE1887196 (BSC-BX60309) + TX、コード NNI-0745 GR + TX、コード IKI-3106 + TX、コード JT-L001 + TX、コード ZNQ-08056 + TX、

10

20

30

40

50

コードIPPA152201+TX、コードHNPC-A9908(CAS:[660411-21-2])+TX、コードHNPC-A2005(CAS:[860028-12-2])+TX、コードJS118+TX、コードZJ 0967+TX、コードZJ 2242+TX、コードJS7119(CAS:[929545-74-4])+TX、コードSN-1172+TX、コードHNPC-A9835+TX、コードHNPC-A9955+TX、コードHNPC-A3061+TX、コードChuanhua 89-1+TX、コードIPP-10+TX、コードZJ 3265+TX、コードJS9117+TX、コードZJ 3757+TX、コードZJ 4042+TX、コードZJ 4014+TX、コードITM-121+TX、コードDPX-RAB55(DKI-2301)+TX、コードNA-89+TX、コードMIE-1209+TX、コードMC I-8007+TX、コードBCS-CL73507+TX、コードS-1871+TX、コードDPX-RDS63+TX、キノフメリン+TX、メフェントリフルコナゾール+TX、フェンピコキサミド+TX、フルインダビル+TX、インビルフルキサム+TX又はインジフルメトビル+TX、イソフルシプラム+TX、ピラプロポイン+TX、フロリルピコキサミド+TX、メチルテトラプロール+TX、イブフルフェノキン+TX、ピリダクロメチル+TX又はクロピリジフル+TX、テトラクロラントラニリプロール+TX、テトラクロラニリプロール+TX、チクロピラゾフロル+TX、フルピリミン+TX又はピリフルラミド+TX、ベンズピリモキサン+TX、ベンズスフィル+TX又はオキサオゾスフィル+TX、エトピラフェン+TX、アシノナビル+TX又はピリノナフェン+TX、オキソトリオン+TX、ビクスロゾン+TX又はクロフェンジゾン+TX又はジクロロキシゾン+TX、シクロピラニル+TX又はピラゾシクロニル+TX又はシクロピラゾニル+TX、 α -プロマジオロン+TX、コードAKD-1193+TX、オキサチアピプロリン+TX、フルオピラム+TX、ペンフルフェン+TX、フルオキソプロサド+TX及びフルピラジフロニル+TX。

10

20

30

40

【0408】

有効成分の後ろの角括弧における参照番号、例えば[3878-19-1]は、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。上記の混合の相手は公知である。有効成分が、“The Pesticide Manual”[The Pesticide Manual-A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; 英国作物保護協議会(The British Crop Protection Council)]に含まれている場合、それらは、特定の化合物について上記において丸括弧中に示される項目番号でその中に記載されており；例えば、「アバメクチン」という化合物は、項目番号(1)で記載されている。「[CCN]」が、上記において特定の化合物に付加されている場合、該当する化合物は、“Compendium of Pesticide Common Names”に含まれており、それは、インターネット上でアクセス可能であり[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, (著作権)1995-2004]；例えば、「アセトプロール」という化合物は、インターネットアドレス：<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>に記載されている。

【0409】

上記の有効成分のほとんどは、上記においていわゆる「一般名」で呼ばれ、関連する「ISO一般名」又は別の「一般名」が、個々の場合に使用される。表記が「一般名」でない場合、代わりに使用される表記の性質が、特定の化合物について丸括弧中に示され；その場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクツ名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」若しくは「開発コード」が使用されるか、又はそれらの表記の1つも使用されず、「一般名」も使用されない場合、「代替名」が用いられる。「CAS登録番号」は、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。

【0410】

表A-1～A-64及び表Pから選択される式Iの化合物と、上記の有効成分との有効

50

成分混合物は、表 A-1～A-64 及び表 P から選択される化合物並びに上記の有効成分を好ましくは 100:1～1:6000、特に 50:1～1:50 の混合比、より特に 20:1～1:20、さらにより特に 10:1～1:10、非常に特に 5:1 及び 1:5 の比率で（2:1～1:2 の比率が特に好ましく、4:1～2:1 の比率が同様に好ましい）、とりわけ 1:1、又は 5:1、又は 5:2、又は 5:3、又は 5:4、又は 4:1、又は 4:2、又は 4:3、又は 3:1、又は 3:2、又は 2:1、又は 1:5、又は 2:5、又は 3:5、又は 4:5、又は 1:4、又は 2:4、又は 3:4、又は 1:3、又は 2:3、又は 1:2、又は 1:600、又は 1:300、又は 1:150、又は 1:35、又は 2:35、又は 4:35、又は 1:75、又は 2:75、又は 4:75、又は 1:6000、又は 1:3000、又は 1:1500、又は 1:350、又は 2:350、又は 4:350、又は 1:750、又は 2:750、又は 4:750 の比率で含む。それらの混合比は、重量基準である。

10

【0411】

上記の混合物は、有害生物を防除する方法に使用され得、この方法は、上記の混合物を含む組成物を有害生物又はその環境に施用する工程を含むが、手術又は治療による人又は動物の身体の治療の方法及び人又は動物の身体において実施される診断方法を除く。

【0412】

表 A-1～A-64 及び表 P から選択される式 I の化合物と、上記の 1 つ又は複数の有効成分とを含む混合物は、例えば、単一のレディミックス形態において、「タンクミックス」など、単一の有効成分の別個の製剤から構成される組み合わせられたスプレー混合物として及び逐次、すなわち数時間又は数日間などのかなり短い期間で次々に施用される場合、単一の有効成分の併用で施用され得る。表 A-1～A-64 及び表 P から選択される式 I の化合物並びに上記の有効成分を施用する順序は、本発明を行うのに重要でない。

20

【0413】

本発明に係る組成物は、安定剤、例えば非エポキシ化又はエポキシ化植物油（例えば、エポキシ化ヤシ油、ナタネ油又は大豆油）、消泡剤、例えばシリコーン油、防腐剤、粘性調節剤、結合剤及び／又は粘着付与剤、肥料又は特定の効果を得るための他の有効成分、例えば殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤又は除草剤などのさらなる固体又は液体助剤も含み得る。

【0414】

本発明に係る組成物は、例えば、固体有効成分を粉砕し、篩にかけ、且つ／又は圧縮することにより、助剤の非存在下において、及び例えば有効成分を 1 つ又は複数の助剤と均質混合し、且つ／又は粉砕することにより、少なくとも 1 つの助剤の存在下においてそれ自体公知の方法で調製される。この組成物の調製のためのこれらの方法及びこれらの組成物の調製のための化合物 I の使用も本発明の主題である。

30

【0415】

この組成物のための施用方法、すなわち噴霧、霧化、散布、はけ塗り、粉衣、拡散又は注ぎかけ（これらは、一般的な状況における意図される目的に合わせて選択されるべきである）など、上記のタイプの有害生物を防除する方法及び上記のタイプの有害生物を防除するための組成物の使用が、本発明の他の主題である。典型的な濃度の比率は、0.1～1000 ppm、好ましくは、0.1～500 ppm の有効成分である。1 ヘクタール当たりの施用量は、一般に、1 ヘクタール当たり 1～2000 g の有効成分、特に 10～1000 g/ha、好ましくは、10～600 g/ha である。

40

【0416】

作物保護の分野における施用の好ましい方法は、植物の茎葉への施用（葉面施用）であり、該当する有害生物による寄生の危険性に合わせて施用頻度及び施用量を選択することができる。代わりに、有効成分は、植物の生息地に液体組成物を灌注することにより、又は固体形態の有効成分を植物の生息地、例えば土壤中に例えば粒剤の形態で導入すること（土壌施用）により、根系（全身作用）を介して植物に到達することができる。水稻植物の場合、このような粒剤は、水田に計量供給され得る。

50

【0417】

本発明の式（I）の化合物及びその組成物は、上記のタイプの有害生物からの、植物繁殖材料、例えば果実、塊茎又は穀粒などの種子又は苗の保護にも好適である。繁殖材料は、植え付けの前にこの化合物で処理され得、例えば、種子は、種まきの前に処理され得る。代わりに、この化合物は、種子仁を液体組成物に浸漬することによって又は固体組成物の層を塗布することによって種子仁に塗付され得る（コーティング）。繁殖材料が施用の場所に植え付けられる場合、この組成物を例えばドリルまき時に畝間に施用することも可能である。植物繁殖材料のためのこれらの処理方法及びこのように処理された植物繁殖材料は、本発明のさらなる主題である。典型的な処理率は、植物及び防除される有害生物／真菌に応じて決まり、一般に、100kgの種子当たり1～200グラム、好ましくは、100kgの種子当たり5～150グラム（100kgの種子当たり10～100グラムなど）である。

10

【0418】

種子という用語は、真正種子、種子片、吸枝、トウモロコシ粒、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽などを含むが、これらに限定されないあらゆる種類の種子及び植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

【0419】

本発明は、式（I）の化合物で被覆若しくは処理されるか又はそれを含有する種子も含む。「で被覆又は処理されるか及び／又はそれを含有する」という用語は、一般に、有効成分が、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部が、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が（再度）植え付けられるとき、有効成分を吸収し得る。一実施形態において、本発明は、式（I）の化合物が付着された植物繁殖材料を利用可能にする。さらに、これにより、式（I）の化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能になる。

20

【0420】

種子処理は、種子粉衣、種子コーティング、種子散布、種子浸漬及び種子ペレットティングなど、当技術分野において公知のすべての好適な種子処理技術を含む。式（I）の化合物の種子処理適用は、種まきの前又は種まき／種子の植え付けの際に噴霧又は種子を散布することなどによる、任意の公知の方法によって行われ得る。

【0421】

生物学的実施例：

30

以下の実施例により本発明を例示する。本発明の特定の化合物は、低施用量で効力が高いことにより公知の化合物と区別可能であり、これは、実施例において概述されている実験手法を用い、必要に応じて例えば50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm又は0.2ppmといったより少ない施用量を用いて、当業者により検証可能である。

【0422】

実施例B1：ジアブロチカバルテアタ（*Diabrotica balteata*）（コーンルートワーム）

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置いたトウモロコシの芽を、吹付けにより、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫を外寄生させた（1ウェル当たり6～10匹）。外寄生の4日後にサンプルを未処理のサンプルと比べて死亡率及び成長阻害について評価した。

40

【0423】

以下の化合物は、200ppmの施用量で2つのカテゴリの少なくとも一方（死亡率又は成長阻害）において少なくとも80%の効果をもたらした：

P16、P24、P25、P26、P29、P30、P31、P32、P33、P34、
P35、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、P49、P50、
P51、P52、P54、P55、P56、P58、P59、P60、P64、P67、

50

P 6 8、P 6 9、P 7 2、P 7 3、P 7 4、P 7 5、P 7 6、P 7 7、P 7 8、P 7 9、
P 8 0、P 8 1、P 8 2、P 8 3、P 8 4、P 8 5、P 8 6、P 8 7、P 8 8、P 8 9。

【0424】

実施例 B 2：ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*) (ネオトロピカルブラウンスティンクバグ (*Neotropical Brown Stink Bug*))

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のダイズの葉に、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉に N 2 若虫を外寄生させた。サンプルを外寄生の 5 日後に未処理のサンプルと比べて死亡率及び成長阻害について評価した。

10

【0425】

以下の化合物は、200 ppm の施用量で 2 つのカテゴリの少なくとも一方（死亡率又は成長阻害）において少なくとも 80 % の効果をもたらした：

P 2 4、P 2 5、P 2 6、P 2 7、P 2 9、P 3 0、P 3 2、P 3 4、P 3 5、P 4 1、
P 4 2、P 4 4、P 4 5、P 4 6、P 4 9、P 5 2、P 5 3、P 5 4、P 5 5、P 5 8、
P 5 9、P 6 1、P 6 4、P 7 2、P 7 3、P 7 7、P 7 8、P 7 9、P 8 0、P 8 1、
P 8 2、P 8 3、P 8 4、P 8 5、P 8 6、P 8 7、P 8 8、P 8 9。

【0426】

実施例 B 3：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) (ミカンキイロアザミウマ (*Western flower thrips*))：摂食／接触活性

20

ヒマワリの葉片を 24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のフランクリエラ属 (*Frankliniella*) 個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の 7 日後に死亡率について評価した。

【0427】

以下の化合物は、少なくとも 80 % の死亡率を 200 ppm の施用量でもたらした：
P 4 5、P 6 4、P 7 2、P 7 8、P 8 3、P 8 5。

【0428】

実施例 B 4：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (ニカメイチュウ)

30

人工餌料の入った 24 ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに L 2 幼虫を外寄生させた (1 ウェル当たり 6 ~ 8 匹)。サンプルを未処理のサンプルと比べて外寄生の 6 日後に死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。カテゴリ (すなわち死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害) の少なくとも 1 つが未処理のサンプルよりも高い場合、テストサンプルによるニカメイガ (*Chilo suppressalis*) の防除がもたらされている。

【0429】

以下の化合物は、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の防除をもたらした：

P 2 5、P 2 6、P 3 2、P 4 2、P 4 3、P 4 9、P 5 0、P 5 8、P 5 9、P 6 1、
P 6 4、P 6 6、P 6 7、P 6 8、P 6 9、P 7 2、P 7 3、P 7 4、P 7 5、P 7 6、
P 7 7、P 7 8、P 7 9、P 8 0、P 8 1、P 8 2、P 8 3、P 8 4、P 8 5、P 8 6、
P 8 7、P 8 8、P 8 9。

40

【0430】

実施例 B 5：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ (*Diamond back moth*))

人工餌料の入った 24 ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、コナガの卵をプラスチック製のステンシル介してゲル吸取り紙上にピペットし、プレートをこれで閉じた。サンプルを外寄生の 8 日後に未処理のサンプルと比べて死亡率及び成

50

長阻害について評価した。

【0431】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で2つのカテゴリの少なくとも一方（死亡率又は成長阻害）において少なくとも80%の効果をもたらした：

P 3、P 5、P 8、P 9、P 15、P 23、P 24、P 25、P 26、P 27、P 29、
P 30、P 31、P 32、P 33、P 34、P 35、P 36、P 38、P 40、P 41、
P 42、P 43、P 44、P 45、P 46、P 47、P 49、P 50、P 51、P 52、
P 54、P 55、P 56、P 58、P 59、P 60、P 61、P 63、P 64、P 67、
P 68、P 69、P 70、P 72、P 73、P 74、P 75、P 76、P 77、P 78、
P 79、P 80、P 81、P 82、P 83、P 84、P 85、P 86、P 87、P 88、
P 89。

10

【0432】

実施例 B 6：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green peach aphid*))：摂食／接触活性

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上にヒマワリの葉片を置き、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の6日後に死亡率について評価した。

【0433】

以下の化合物は、少なくとも80%の死亡率を200 ppmの施用量でもたらした：

P 24、P 26、P 34、P 42、P 46、P 50、P 61、P 64、P 72、P 73、
P 82、P 83、P 85、P 87、P 89。

20

【0434】

実施例 B 7：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green peach aphid*))。浸透移行活性

様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させたエンドウマメの実生の根を、10,000のDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液に直接入れた。サンプルを実生をテスト溶液に入れてから6日後に死亡率について評価した。

【0435】

以下の化合物は、24 ppmのテスト割合で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P 26、P 34、P 35、P 45、P 46、P 64、P 82、P 83、P 84、P 89。

30

【0436】

実施例 B 8：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green peach aphid*))。固有活性

10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト化合物を24 ウェルマイクロタイタープレートにピペットにより適用し、スクロース溶液と混合した。プレートを、伸ばしたParafilmで閉じた。24個の孔が開いたプラスチック製のステンシルをプレート上に置き、外寄生させたエンドウマメの実生をParafilm上に直接置いた。外寄生させたプレートをゲル吸取り紙及び他のプラスチック製のステンシルで閉じ、次いで上下を逆さまにした。サンプルを外寄生の5日後に死亡率について評価した。

40

【0437】

以下の化合物は、12 ppmのテスト割合で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P 21、P 23、P 24、P 25、P 26、P 29、P 30、P 34、P 35、P 42、
P 43、P 45、P 46、P 49、P 50、P 52、P 54、P 55、P 58、P 59、
P 61、P 64、P 72、P 73、P 75、P 77、P 78、P 82、P 83、P 84、
P 85、P 86、P 87、P 88、P 89。

【0438】

実施例 B 9：エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ (*Egyptian cotton leaf worm*))

綿の葉片を24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 pp

50

mのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に5匹のL1幼虫を外寄生させた。サンプルを未処理のサンプルと比べて外寄生の3日後に死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。3つのカテゴリ（すなわち死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害）の少なくとも1つが未処理のサンプルよりも高い場合、テストサンプルによるエジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）の防除がもたらされている。

【0439】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：

P24、P25、P26、P32、P35、P36、P40、P41、P42、P43、
P44、P45、P46、P49、P50、P51、P52、P54、P56、P58、
P59、P61、P64、P68、P69、P70、P72、P73、P74、P75、
P76、P77、P78、P79、P80、P81、P82、P83、P84、P85、
P86、P87、P88、P89。

10

【0440】

実施例B10：エジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）（エジプトヨトウ（*Egyptian cotton leaf worm*））

ピペットにより、テスト化合物を10,000 ppmのDMSOストック溶液から24ウェルプレートに適用し、寒天と混合した。レタスの種子を寒天上に置き、マルチウェルプレートを同様に寒天を含む他のプレートで閉じた。7日後、化合物は、根に吸収され、レタスが蓋プレート中に成長した。次いで、レタスの葉を蓋プレート中に切り取った。スポドプテラ（*Spodoptera*）の卵を、ピペットで、プラスチック製のステンシルを介して湿らせたゲル吸取り紙上にとり、蓋プレートをこれで閉じた。サンプルを未処理のサンプルと比べて外寄生の6日後に死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。

20

【0441】

以下の化合物は、12.5 ppmのテスト割合で3つのカテゴリ（死亡率、摂食阻害又は成長阻害）における少なくとも1つにおいて少なくとも80%の効果をもたらした：

P25、P26、P32、P42、P43、P45、P49、P50、P54、P55、
P58、P59、P85、P87、P89。

【0442】

実施例B11：ハダニ（*Tetranychus urticae*）（ナミハダニ）：摂食／接触活性

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のインゲンマメ葉片に、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に様々な齢数のダニ個体群を外寄生させた。試料を外寄生の8日後の混合個体群（可動状態）における死亡率について評価した。

30

【0443】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：

P27、P34、P62、P79、P83。

【0444】

実施例B12：ネギアザミウマ（*Thrips tabaci*）（タマネギアザミウマ）
摂食／接触活性

ヒマワリの葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアザミウマ個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の6日後に死亡率について評価した。

40

【0445】

以下の化合物は、少なくとも80%の死亡率を200 ppmの施用量でもたらした：

P25、P26、P29、P30、P32、P34、P35、P42、P46、P49、
P50、P52、P89。

50

【0446】

実施例B13：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green Peach Aphid*)) に対する活性：

10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト化合物を液体ハンドリングロボットにより96-ウェルマイクロタイタープレート中に適用し、スクロース溶液と混合した。96-ウェルマイクロタイタープレート上にParafilmを伸ばし、96個の孔が開いたプラスチック製のステンシルをプレート上に置いた。アブラムシをウェル中のParafilm上に直接ふり分けた。外寄生させたプレートをゲル吸取り用厚紙及び第2のプラスチック製のステンシルで閉じ、次いで上下を逆さまにした。サンプルを外寄生の5日後に死亡率について評価した。

10

【0447】

以下の化合物は、少なくとも80%の死亡率を50ppmの施用量でもたらした：

P11、P15、P17、P18、P20、P21、P23、P24、P25、P26、P27、P29、P30、P31、P32、P33、P34、P35、P40、P42、P43、P44、P45、P46、P47、P49、P50、P51、P52、P54、P55、P58、P59、P60、P64、P67、P68、P69、P83、P85、P87、P88、P89。

【0448】

実施例B14：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ (*Diamondback Moth*)) に対する活性：

20

人工餌料を含む96-ウェルマイクロタイタープレートを、液体ハンドリングロボットにより、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液により処理した。乾燥させた後、卵(1ウェル当たり約30個)をネットを付けた蓋に外寄生させ、これを食餌の上方に吊り下げた。卵が付加するとL1幼虫が食餌に降りる。サンプルを外寄生の9日後に死亡率について評価した。

【0449】

以下の化合物は、500ppmの施用量で少なくとも80%の平均死亡率の効果をもたらした：

P1、P2、P3、P4、P5、P9、P15、P20、P21、P23、P24、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P31、P32、P33、P34、P35、P36、P38、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、P47、P48、P49、P50、P51、P52、P54、P55、P58、P59、P60、P70、P71、P89。

30

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2019/067266

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D401/14 A01N43/647 C07D401/04 C07D403/04
ADD.

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)

C07D A01N

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

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

EPO-Internal, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2017/192385 A1 (ELANCO TIERGESUNDHEIT AG [CH]; LILLY CO ELI [US]) 9 November 2017 (2017-11-09) cited in the application the whole document Activity assays and results from page 70 onwards; examples 1-75	1-18
A	WO 2012/080376 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE JOSEPH MARCEL [CH]; HUETE) 21 June 2012 (2012-06-21) the whole document examples A1-A201; B1-B11; C1-C3; D1 -D7	1-18

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

13 September 2019

Date of mailing of the international search report

01/10/2019

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Goss, Ilaria

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2019/067266

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2017192385 A1	09-11-2017	AR 108222 A1 AU 2017261187 A1 BR 112018069578 A2 CA 3023208 A1 CL 2018003021 A1 CN 109311841 A CO 2018011825 A2 EA 201892191 A1 EP 3452460 A1 JP 6370504 B2 JP 2018517716 A KR 20180132100 A TW 201803863 A US 2018186778 A1 US 2019256501 A1 WO 2017192385 A1	01-08-2018 04-10-2018 22-01-2019 09-11-2017 15-02-2019 05-02-2019 22-11-2018 30-04-2019 13-03-2019 08-08-2018 05-07-2018 11-12-2018 01-02-2018 05-07-2018 22-08-2019 09-11-2017
WO 2012080376 A1	21-06-2012	AR 084308 A1 BR 112013014986 A2 CN 103261188 A EP 2651921 A1 US 2013253011 A1 UY 33808 A WO 2012080376 A1	08-05-2013 12-07-2016 21-08-2013 23-10-2013 26-09-2013 31-07-2012 21-06-2012

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード (参考)
A O 1 N	53/14	(2006.01)	A O 1 N	53/14
A O 1 P	9/00	(2006.01)	A O 1 P	9/00
A O 1 P	7/04	(2006.01)	A O 1 P	7/04
A O 1 P	7/02	(2006.01)	A O 1 P	7/02

(81)指定国・地域 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(72)発明者 ガニユパン ジュリアン ダニエル アンリ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 エドモンズ アンドリュー

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 エメリー ダニエル

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ホール ロジャー グラハム

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ヒューター オットマー フランツ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 コリート クリーガー アマンディーヌ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 レンドラー セバスチャン

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 シェーツァー ユルゲン ハリー

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

Fターム(参考) 4C063 AA01 AA05 BB02 BB09 CC41 DD02 DD29 EE03

4H011 AC01 AC04 AE01 BA06 BB09 BB11 BB15 BC07 DA13