

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号
特表2022-515896
(P2022-515896A)

(43)公表日 令和4年2月22日(2022.2.22)

(51)国際特許分類		F I		テーマコード (参考)	
C 0 7 D	471/04 (2006.01)	C 0 7 D	471/04	1 0 8 X	4 C 0 5 0
C 0 7 D	487/04 (2006.01)	C 0 7 D	487/04	1 4 4	4 C 0 6 5
A 0 1 N	43/90 (2006.01)	C 0 7 D	487/04		C S P 4 H 0 1 1
A 0 1 P	7/02 (2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 4	
A 0 1 P	5/00 (2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 3	
		審査請求	未請求	予備審査請求	未請求 (全228頁) 最終頁に続く
(21)出願番号	特願2021-538660(P2021-538660)	(71)出願人	520222106		
(86)(22)出願日	令和1年12月23日(2019.12.23)		シンジェンタ クロップ プロテクション		
(85)翻訳文提出日	令和3年8月30日(2021.8.30)		アクチエンゲゼルシャフト		
(86)国際出願番号	PCT/EP2019/086977		スイス 4 0 5 8 バーゼル ローゼンタ		
(87)国際公開番号	WO2020/141136		ールシュトラーセ 6 7		
(87)国際公開日	令和2年7月9日(2020.7.9)	(74)代理人	100094569		
(31)優先権主張番号	201811049942		弁理士 田中 伸一郎		
(32)優先日	平成30年12月31日(2018.12.31)	(74)代理人	100103610		
(33)優先権主張国・地域又は機関	インド(IN)		弁理士 ▲吉▼田 和彦		
(31)優先権主張番号	201911013486	(74)代理人	100109070		
(32)優先日	平成31年4月3日(2019.4.3)		弁理士 須田 洋之		
(33)優先権主張国・地域又は機関	インド(IN)	(74)代理人	100119013		
(31)優先権主張番号	19160131.9		弁理士 山崎 一夫		
	最終頁に続く	(74)代理人	100123777		
			弁理士 市川 さつき		
			最終頁に続く		

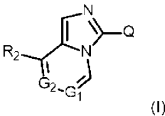
(54)【発明の名称】 硫黄含有置換基を有する殺有害生物的に活性な複素環式誘導体

(57)【要約】

式 (I)

(式中、置換基は、請求項 1 に定義されているとおりである)

の化合物。さらに、本発明は、式 (I) の化合物を含む農芸化学組成物、これらの組成物の調製並びに節足動物及び特に昆虫、軟体動物又はダニ目の代表例を含む動物有害生物を駆除、予防又は防除するための、農業又は園芸における化合物又は組成物の使用に関する。

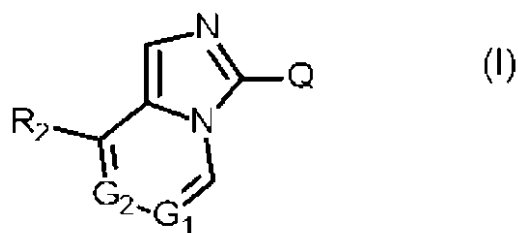


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



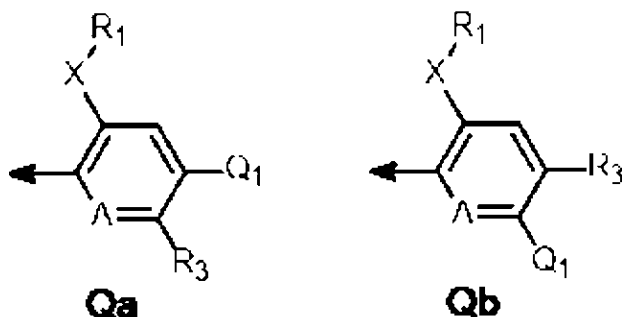
10

(式中、

G₁及びG₂は、相互に独立して、CH又はNであり；R₂は、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル又はC₁～C₆ハロアルコキシであり；

Qは、式Qa及びQb

【化 2】



20

(式中、矢印は、二環式環に対する結合点を示し；

Aは、CH又はNを表し；

Xは、S、SO、SO₂又はSO(NH)であり；R₁は、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル又はC₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルであり；Q₁は、水素、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、-N=S(O)R₆R₇、-C(R₈)=NO(R₉)、-N(R₄)CON(R₄)₂、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジリオキシであるか；又はQ₁は、環炭素原子を介して、前記置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルスルファニル、C₁～C₄アルキルスルフィニル及びC₁～C₄アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1、2又は3個の環ヘテロ原子を含有することができ、ここで、前記環系は、2個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ2個以上の環硫黄原子を含有することができないか；又はQ₁は、環窒素原子を介して、前記置換基Aを含有する前記環に結合されている5員芳香

30

40

50

族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ 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なる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1、2又は3個の環ヘテロ原子を含有し、ここで、前記環系は、少なくとも1個の環窒素原子を含有し、且つ2個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ2個以上の環硫黄原子を含有することができず；

各 R_4 は、独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

R_5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

R_6 及び R_7 は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

R_8 及び R_9 は、相互に独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

R_3 は、水素、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである）

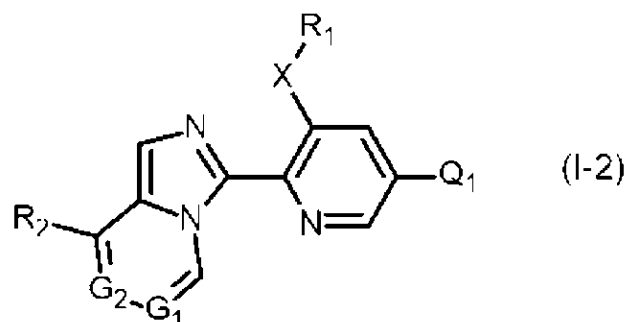
からなる群から選択される基である）

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、互変異性体若しくはN-オキシド。

【請求項2】

式I-2

【化3】



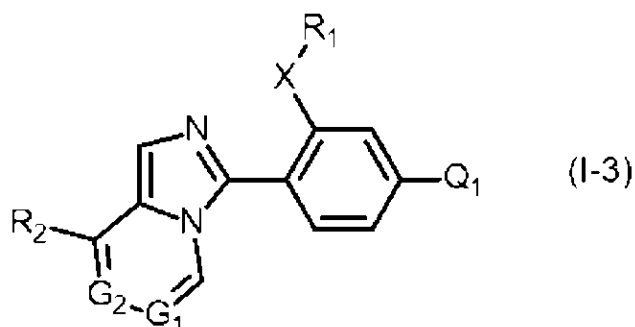
（式中、X、 Q_1 、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 は、請求項1において式Iで定義されているとおりである）

の化合物によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項3】

式I-3

【化4】



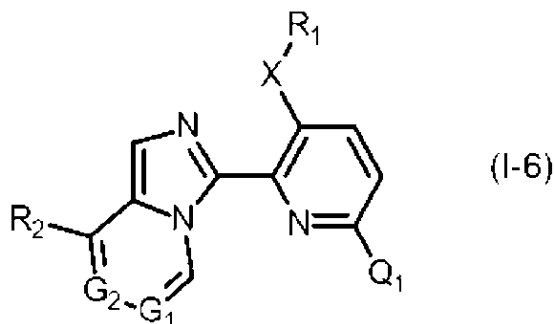
(式中、X、Q₁、R₁、R₂、G₁及びG₂は、請求項1において式Iで定義されているとおりである)

の化合物によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項4】

式I-6

【化5】



10

(式中、X、Q₁、R₁、R₂、G₁及びG₂は、請求項1において式Iで定義されているとおりである)

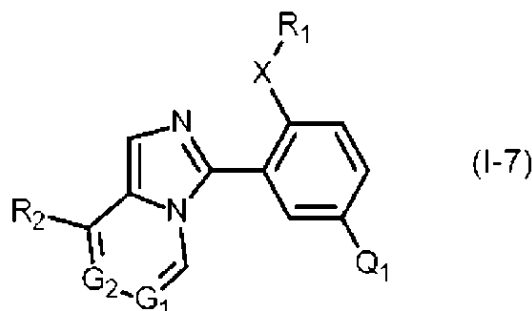
の化合物によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物。

20

【請求項5】

式I-7

【化6】



30

(式中、X、Q₁、R₁、R₂、G₁及びG₂は、請求項1において式Iで定義されているとおりである)

の化合物によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項6】

Q₁は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、シアノイソプロポキシ、トリフルオロエトキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、-N(R₄)CON(R₄)₂であり、その各々において、R₄は、独立して、水素若しくはメチルのいずれかであり、及びR₅は、メチル若しくはシクロプロピルのいずれかであるか、又はQ₁は、-N=S(O)(CH₃)₂、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル、2-ピリジルオキシ、無置換であるか若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルであるか、又はQ₁は、無置換N結合トリアゾリル若しくは無置換C結合ピリミジニルである、請求項2～5のいずれか一項に記載の化合物。

40

【請求項7】

R₂は、C₁～C₆ハロアルコキシであり；好ましくは、R₂は、-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃である、請求項2～6のいずれか一項に記載の化合物。

50

【請求項 8】

G₁は、CHであり、及びG₂は、Nであり；Xは、S、SO₂又はS(O)NHであり；好ましくは、Xは、SO₂又はS(O)NHである、請求項 2～7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

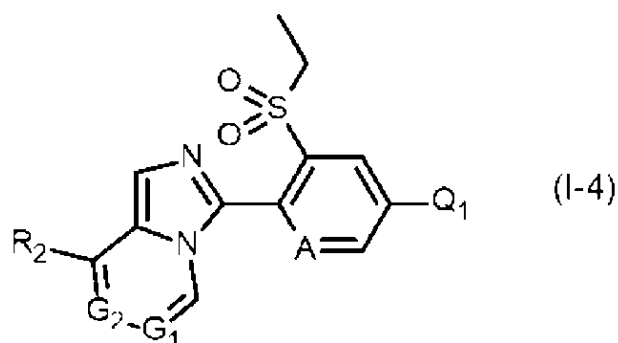
G₁は、CHであり、及びG₂は、CHであり；Xは、S、SO₂又はS(O)NHであり；好ましくは、Xは、SO₂又はS(O)NHである、請求項 2～7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

式 I - 4

10

【化 7】



20

(式中、

Aは、CH又はN、好ましくはNであり；

R₂は、C₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

G₁は、CH又はN、好ましくはCHであり；

G₂は、CH又はNであり；及び

Q₁は、水素、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルコキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅又は-N(R₄)CON(R₄)₂、-N=S(O)R₆R₇、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

30

Q₁は、環窒素原子を介して、前記置換基Aを含有する前記環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q₁は、環窒素原子を介して、前記置換基Aを含有する前記環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

40

各R₄は、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル、好ましくは水素又はメチルであり；

R₅は、C₁～C₆アルキル又はC₃～C₆シクロアルキル、好ましくはメチル又はシクロプロピルであり；及び

R₆及びR₇は、相互に独立して、C₁～C₆アルキル、好ましくはメチルである)

の化合物によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

【請求項 11】

Q₁は、水素、塩素、臭素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、1-シアノシクロブ

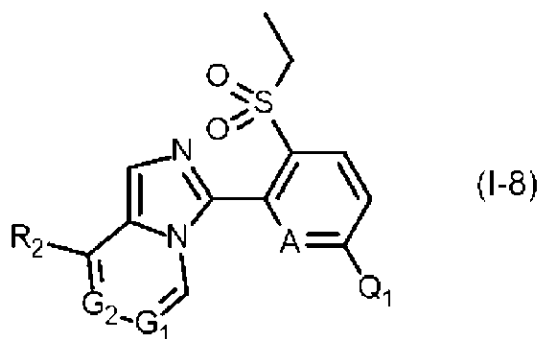
50

ロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CO$ シクロプロピル、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、2-ピリジルオキシ、ピラゾール-1-イル、3-クロロ-ピラゾール-1-イル、3-シアノ-ピラゾール-1-イル又は3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イルである、請求項9に記載の化合物。

【請求項12】

式I-4

【化8】



(式中、

Aは、CH又はN、好ましくはNであり；

R₂は、C₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G₁は、CH又はN、好ましくはCHであり；

G₂は、CH又はN、好ましくはNであり；及び

Q₁は、水素、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、 $-N=S(O)R_6R_7$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

Q₁は、環炭素原子を介して、前記置換基Aを含有する前記環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q₁は、環窒素原子を介して、前記置換基Aを含有する前記環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

各R₄は、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル、好ましくは水素又はメチルであり；

R₅は、C₁～C₆アルキル又はC₃～C₆シクロアルキル、好ましくはメチル又はシクロプロピルであり；及び

R₆及びR₇は、相互に独立して、C₁～C₆アルキル、好ましくはメチルである)

の化合物によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド。

【請求項13】

Q₁は、水素、塩素、臭素、シクロプロピル、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_2CH_3$ 、 $-NHCO$ (シクロプロピル)、 $-N(CH_3)CO$ (シクロプロピル)、 $-N(H)CO$

10

20

30

40

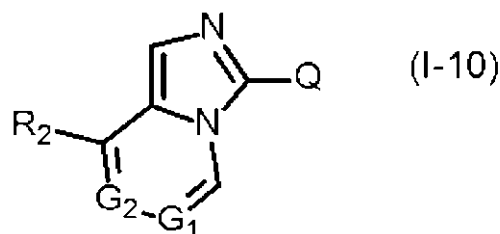
50

NH₂、-N(H)CONH(CH₃)、-N(H)CON(CH₃)₂、-N(CH₃)CONH₂、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CON(CH₃)₂、-N(CH₃)COCH₂CH₃、-N(CH₃)₂又は(オキサゾリジン-2-オン)-3-イルであるか；又はQ₁は、無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1,2,4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである、請求項11に記載の化合物。

【請求項14】

式I-10

【化9】



10

(式中、

R₂は、C₁~C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

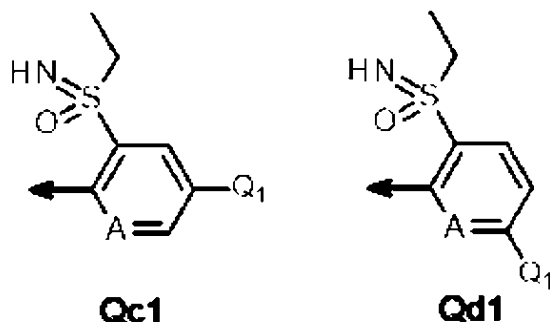
20

G₁は、CH又はN、好ましくはCHであり；

G₂は、CH又はNであり；及び

Qは、式Qc1及びQd1

【化10】



30

(式中、矢印は、二環式環に対する結合点を示し；

Aは、CH又はN、好ましくはNであり；及び

Q₁は、水素、ハロゲン、C₃~C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃~C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁~C₆アルキル、C₁~C₆シアノアルコキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅又は-N(R₄)CON(R₄)₂であり、その各々において、R₄は、独立して、水素又はC₁~C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅は、C₁~C₆アルキル又はC₃~C₆シクロアルキル（好ましくはメチル又はシクロプロピル）、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、Q₁は、水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(シクロプロピル)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであるか；又は

40

Q₁は、無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1,2,4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである)

50

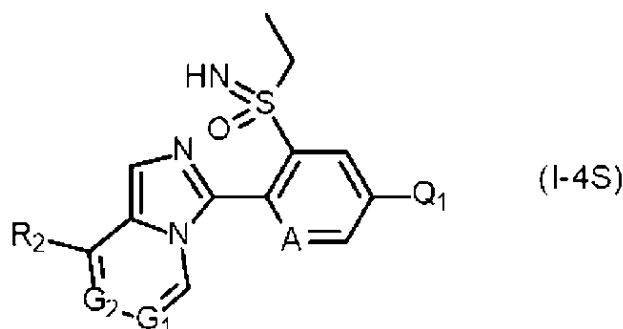
からなる群から選択される基である)

の化合物によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 15】

式 I - 4 S

【化 11】



10

(式中、

A は、CH 又は N、好ましくは N であり；

R₂ は、C₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは -OCH₂CF₂CHF₂ 又は -OCH₂CF₂CF₃ であり；

G₁ は、CH 又は N、好ましくは CH であり；

G₂ は、CH 又は N であり；及び

Q₁ は、水素、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換された C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換された C₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅ 又は -N(R₄)CON(R₄)₂、-N=S(O)R₆R₇、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は 2-ピリジルオキシであるか；又は

Q₁ は、環炭素原子を介して、前記置換基 A を含有する前記環に結合されている 5 員～6 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び C₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1 又は 2 個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q₁ は、環窒素原子を介して、前記置換基 A を含有する前記環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び C₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2 又は 3 個の環窒素原子を含有し；

各 R₄ は、独立して、水素又は C₁～C₄アルキル、好ましくは水素又はメチルであり；

R₅ は、C₁～C₆アルキル又は C₃～C₆シクロアルキル、好ましくはメチル又はシクロプロピルであり；及び

R₆ 及び R₇ は、相互に独立して、C₁～C₆アルキル、好ましくはメチルである)

の化合物によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N-オキシド。

【請求項 16】

3-(6-クロロ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン(化合物 P1)；

3-(6-クロロ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン(化合物 P2)；

3-(5-ブromo-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン(化合物 P3)；

3-(5-ブromo-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン(化合物 P4)；

50

- 3 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 5) ;
- 3 - (3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 6) ;
- 3 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 7) ;
- 3 - (3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 8) ;
- 1 - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 尿素 (化合物 P 9) ; 10
- 5 - エチルスルホニル - N - メチル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] ピリジン - 2 - アミン (化合物 P 10) ;
- N - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 2 - ピリジル] - N - メチル - アセトアミド (化合物 P 11) ;
- 3 - [3 - エチルスルホニル - 6 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 2 - ピリジル] - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 12) ; 20
- N - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] - N - メチル - アセトアミド (化合物 P 13) ;
- 1 - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 2 - ピリジル] - 1, 3 - ジメチル - 尿素 (化合物 P 14) ;
- 1 - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 15) ;
- 2 - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] - 2 - メチル - プロパンニトリル (化合物 P 16) ; 30
- [5 - エチルスルファニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] イミノ - ジメチル - オキソ - λ^6 - スルファン (化合物 P 17) ;
- [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] イミノ - ジメチル - オキソ - λ^6 - スルファン (化合物 P 18) ;
- 3 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (2 - ピリジルオキシ) - 2 - ピリジル] - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 19) ; 40
- 3 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (2 - ピリジルオキシ) - 2 - ピリジル] - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 20) ;
- 3 - (5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 21) ;
- 3 - (5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 22) ; 50

1 - [5 - エチルスルファニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 2 3) ;

2 - [5 - エチルスルファニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] - 2 - メチル - プロパンニトリル (化合物 P 2 4) ;

3 - (3 - エチルスルホニル - 6 - ピリミジン - 2 - イル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピラジン (化合物 P 2 5) ;

3 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン (化合物 P 2 6) ;

3 - (3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン (化合物 P 2 7) ;

2 - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] - 2 - メチル - プロパンニトリル (化合物 P 2 8) ;

3 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン (化合物 P 2 9) ;

3 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン (化合物 P 3 0) ;

5 - エチルスルホニル - N - メチル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン - 3 - イル] ピリジン - 2 - アミン (化合物 P 3 1) ;

3 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (2 - ピリジルオキシ) - 2 - ピリジル] - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン (化合物 P 3 2) ;

3 - [3 - エチルスルホニル - 6 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 2 - ピリジル] - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン (化合物 P 3 3) ;

3 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン (化合物 P 3 4) ;

1 - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 3 5) ;

3 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (2 - ピリジルオキシ) - 2 - ピリジル] - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン (化合物 P 3 6) ;

N - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン - 3 - イル] - 2 - ピリジル] - N - メチル - アセトアミド (化合物 P 3 7) ;

N - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン - 3 - イル] - 2 - ピリジル] - N - メチル - シクロプロパンカルボキサミド (化合物 P 3 8) ;

N - [5 - エチルスルホニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン - 3 - イル] - 3 - ピリジル] - N - メチル - アセトアミド (化合物 P 3 9) ;

3 - (5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5 - a] ピリジン (化合物 P 4 0) ;

N - [5 - エチルスルファニル - 6 - [8 - (2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロ

10

20

30

40

50

ポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン-3-イル] - 3-ピリジル] - N-メチル-アセトアミド (化合物 P 41) ;

3- (5-シクロプロピル-3-エチルスルファニル-2-ピリジル) - 8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン (化合物 P 42) ;

3- (5-ブromo-3-エチルスルホニル-2-ピリジル) - 8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン (化合物 P 43) ;

[5-エチルスルファニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン-3-イル] - 3-ピリジル] イミノ-ジメチル-オキソ-λ⁶-スルファン (化合物 P 44) ;

[5-エチルスルホニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン-3-イル] - 3-ピリジル] イミノ-ジメチル-オキソ-λ⁶-スルファン (化合物 P 45) ;

2- [5-エチルスルファニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン-3-イル] - 3-ピリジル] - 2-メチル-プロパンニトリル (化合物 P 46) ;

2- [[5-エチルスルホニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン-3-イル] - 3-ピリジル] オキシ] - 2-メチル-プロパンニトリル (化合物 P 47) ;

2- [[5-エチルスルファニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン-3-イル] - 3-ピリジル] オキシ] - 2-メチル-プロパンニトリル (化合物 P 48) ;

2- [[5- (エチルスルホニイミドイル) - 6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン-3-イル] - 3-ピリジル] オキシ] - 2-メチル-プロパンニトリル (化合物 P 49) ;

2- [[5-エチルスルファニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] - 3-ピリジル] オキシ] - 2-メチル-プロパンニトリル (化合物 P 50) ;

2- [[5-エチルスルホニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] - 3-ピリジル] オキシ] - 2-メチル-プロパンニトリル (化合物 P 51) ;

2- [[5- (エチルスルホニイミドイル) - 6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] - 3-ピリジル] オキシ] - 2-メチル-プロパンニトリル (化合物 P 52) ; 及び

1- [5-エチルスルファニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピリジン-3-イル] - 3-ピリジル] シクロプロパンカルボニトリル (化合物 P 53)

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 17】

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 ~ 16 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N-オキシドと、任意に助剤又は希釈剤とを含む組成物。

【請求項 18】

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 ~ 16 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N-オキシド或いは請求項 14 に記載の組成物を適用する工程を含む方法。

【請求項 19】

昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、

10

20

30

40

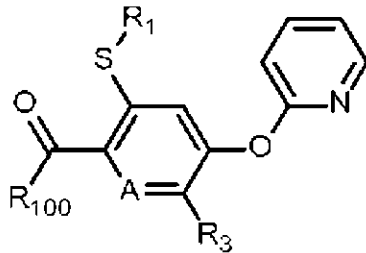
50

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、請求項 17 に記載の組成物で処理する工程を含む方法。

【請求項 20】

式 X I V

【化 12】



(XIV)

10

(式中、

R_1 、 R_3 及び A は、請求項 1 において式 I で定義されているとおりであり、及び R_{100} は、OH、クロロ又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシである)

の化合物。

【発明の詳細な説明】

20

【技術分野】

【0001】

本発明は、硫黄置換基を含有する、殺有害生物的に活性である、特に殺虫的に活性である複素環式誘導体、それらの調製のためのプロセス、そ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) の代表例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】

殺有害生物作用を有するヘテロ環式化合物は、公知であり、例えば国際公開第 2013191112 号、国際公開第 2018174170 号及び国際公開第 2018199121 0 号に記載されている。

30

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

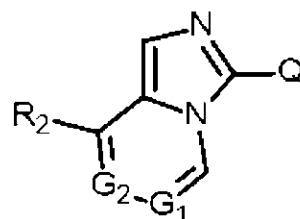
【0003】

意外なことに、ここで、硫黄含有置換基を備える特定の新規な殺有害生物活性誘導体が殺有害生物剤として好ましい特性を有することが見出された。

【0004】

本発明は、従って、式 I

【化 1】



(I)

40

(式中、

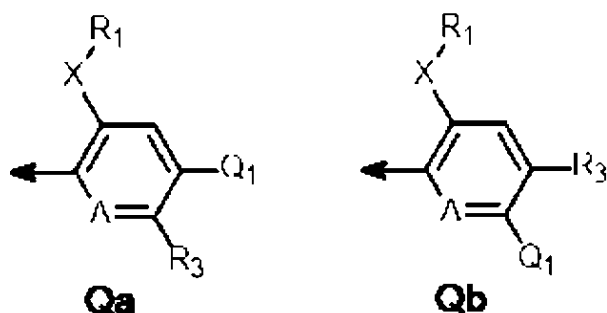
G_1 及び G_2 は、相互に独立して、CH 又は N であり；

50

R₂は、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル又はC₁～C₆ハロアルコキシであり；

Qは、式Q a 及びQ b

【化 2】



10

(式中、矢印は、二環式環に対する結合点を示し；

Aは、CH又はNを表し；

Xは、S、SO、SO₂又はSO(NH)であり；

R₁は、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル又はC₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルであり；

20

Q₁は、水素、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、-N=S(O)R₆R₇、-C(R₈)=NO(R₉)、-N(R₄)CON(R₄)₂、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

Q₁は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルスルファニル、C₁～C₄アルキルスルフィニル及びC₁～C₄アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1、2又は3個の環ヘテロ原子を含有することができ、ここで、前記環系は、2個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ2個以上の環硫黄原子を含有することができないか；又は

30

Q₁は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルスルファニル、C₁～C₄アルキルスルフィニル及びC₁～C₄アルキルスルホニルからなる群から選択される置換基によって単置換若しくは多置換されており；及び前記環系は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される1、2又は3個の環ヘテロ原子を含有し、ここで、前記環系は、少なくとも1個の環窒素原子を含有し、且つ2個以上の環酸素原子を含有することができず、且つ2個以上の環硫黄原子を含有することができず；

40

各R₄は、独立して、水素、C₁～C₄アルキル又はC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₅は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル又はC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₆及びR₇は、相互に独立して、C₁～C₆アルキル又はC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₈及びR₉は、相互に独立して、水素、C₁～C₆アルキル又はC₁～C₆ハロアルキルであり；

R₃は、水素、ハロゲン又はC₁～C₄アルキルである)

50

からなる群から選択される基である)

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、互変異性体若しくは N-オキシドを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0005】

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-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。

10

20

【0006】

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-オキシドとしての酸化型形態又は例えば農学的に使用可能な塩形態といった塩形態である。

【0007】

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、“Heterocyclic N-oxides”, A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991 といった書籍に記載されている。

30

【0008】

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。

【0009】

置換基自体がさらに置換されていると記載されている場合、これは、それらが1つ以上の同等の又は異なる置換基、例えば1~4つの置換基を有することを意味する。通常、3つ以下のこのような任意の置換基が同時に存在する。2つ以下のこのような置換基が同時に存在することが好ましい（すなわち、この基は、1又は2つの記載されている置換基によって置換されている）。追加の置換基がシクロアルキル又はフェニルなどのより大きい基である場合、このような任意の置換基の一方のみが存在することが最も好ましい。例えば、アルキルといった基が置換されていると記載されている場合、これは、例えば、アルキルチオ中のアルキルといった他の基の一部である基を含む。

40

【0010】

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基を指し、例えばメチル、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-

50

1-メチルプロピル又は1-エチル-2-メチルプロピルといった基のいずれか1つである。

【0011】

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、直鎖又は分岐不飽和アルキル基を指し、例えばビニル、アリル、ホモアリル、ブター-1-エンイル及びブター-2-エンイルである。適切な場合、アルケニル鎖は、(E)配置又は(Z)配置のいずれかのものであり得る。

【0012】

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基を指し（上記のとおり）、ここで、これらの基中における水素原子のいくつか又はすべては、フッ素、塩素、臭素及び／又はヨウ素で置き換えられ得、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romo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romoプロピル、3-ブromo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romoメチル)-2-ブromoエチル、4-フルオロブチル、4-クロロブチル、4-ブromoブチル又はノナフルオロブチルの1つである。「 $C_1 \sim C_2$ -フルオロアルキル」という用語によれば、1、2、3、4又は5つのフッ素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -アルキル基を指し、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つである。

【0013】

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個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し（上記のとおり）、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-ジメチルエトキシのいずれか1つである。

【0014】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルコキシ」という用語は、フッ素、塩素、臭素及び／又はヨウ素で部分的又は完全に置換されている上記の $C_1 \sim C_n$ アルコキシ基を指し、すなわち例えばクロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブromoエトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、2,3-ジフルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、2-ブromoプロポキシ、3-ブromoプロポキシ、3,3,3-トリフルオロプロポキシ、3,3,3-トリクロロプロポキシ、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ、ヘプタ

フルオロプロポキシ、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエトキシ、1-(クロロメチル)-2-クロロエトキシ、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエトキシ、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ又は4-ブロモブトキシのいずれか1つである。

【0015】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルファニル」という用語は、硫黄原子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基を指し（上記のとおり）、すなわち例えばメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、1-メチルエチルチオ、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ、2-メチルプロピルチオ又は1, 1-ジメチルエチルチオのいずれか1つである。

【0016】

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、スルフィニル基の硫黄原子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基を指し（上記のとおり）、すなわち例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、1-メチルエチルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、1-メチルプロピルスルフィニル、2-メチルプロピルスルフィニル、1, 1-ジメチル-エチルスルフィニル、n-ペンチルスルフィニル、1-メチルブチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、3-メチル-ブチルスルフィニル、1, 1-ジメチルプロピルスルフィニル、1, 2-ジメチルプロピルスルフィニル、2, 2-ジメチルプロピルスルフィニル又は1-エチルプロピルスルフィニルのいずれか1つである。

【0017】

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、スルホニル基の硫黄原子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基を指し（上記のとおり）、すなわち例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、1-メチルプロピルスルホニル、2-メチルプロピルスルホニル又はt-ブチルスルホニルのいずれか1つである。

【0018】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルスルファニル」という用語は、フッ素、塩素、臭素及び／又はヨウ素で部分的又は完全に置換されている上記の $C_1 \sim C_n$ アルキルチオ基を指し、すなわち例えばフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、ブロモジフルオロメチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2-クロロエチルチオ、2-ブロモエチルチオ、2-ヨードエチルチオ、2, 2-ジフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリクロロエチルチオ、2-クロロ-2-フルオロエチルチオ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチルチオ、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、2-フルオロプロピルチオ、3-フルオロプロピルチオ、2-クロロプロピルチオ、3-クロロプロピルチオ、2-ブロモプロピルチオ、3-ブロモプロピルチオ、2, 2-ジフルオロプロピルチオ、2, 3-ジフルオロプロピルチオ、2, 3-ジクロロプロピルチオ、3, 3, 3-トリフルオロプロピルチオ、3, 3, 3-トリクロロプロピルチオ、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピルチオ、ヘプタフルオロプロピルチオ、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチルチオ、1-(クロロメチル)-2-クロロエチルチオ、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエチルチオ、4-フルオロブチルチオ、4-クロロブチルチオ又は4-ブロモブチルチオのいずれか1つである。

【0019】

「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルスルフィニル」及び「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルスルホニル」という用語は、上記の基であるが、それぞれ酸化状態1又は2の硫黄を有するものを指す。

【0020】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルコキシカルボニル」という用語は、カルボニル基の炭素原子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

10

20

30

40

50

岐アルコキシ基を指し（上記のとおり）、すなわちメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロポキシカルボニル、1-メチルエトキシカルボニル、 n -ブトキシカルボニル、1-メチルプロポキシカルボニル、2-メチルプロポキシカルボニル又は1, 1-ジメチルエトキシカルボニルのいずれか1つである。

【0021】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルアミノカルボニル」という用語は、そのアミノ鎖がカルボニル基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基を指し（上記のとおり）、例えば N -メチルホルムアミド、 N -エチルホルムアミド、 N -プロピルホルムアミド、 N -ブチルホルムアミド及び N -sec-ブチルホルムアミドである。

10

【0022】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -ジアルキルアミノカルボニル」という用語は、そのアミノ鎖がカルボニル基を介して結合している、1～ n 個の炭素原子を有する2つの直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し（上記のとおり）、例えば N , N -ジメチルホルムアミド、 N -エチル- N -メチル-ホルムアミド、 N -イソプロピル- N -メチル-ホルムアミド、 N -エチル- N -プロピル-ホルムアミド、 N -エチル- N -イソプロピル-ホルムアミド及び N -イソブチル- N -メチル-ホルムアミドである。

【0023】

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、シアノ基で置換されている、1～ n 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し（上記のとおり）、例えばシアノメチレン、シアノエチレン、1, 1-ジメチルシアノメチル、シアノメチル、シアノエチル及び1-ジメチルシアノメチルである。

20

【0024】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル」又は「 $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」（ n は、1～6の整数である）などの用語の前の接頭辞「 $C_1 \sim C_n$ アルキル」は、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル又は $C_1 \sim C_n$ アルコキシによって置換されている直鎖又は分岐飽和アルキル基を指す。 $C_1 \sim C_n$ アルコキシ- $C_1 \sim C_n$ アルキルの例は、例えば、メトキシメチル、メトキシエチル及び1-メチルメトキシメチルである。 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_n$ アルキルの例は、シクロプロピル- $C_1 \sim C_4$ アルキル及びシクロプロピルメチルである。

30

【0025】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_6$ 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3～6員シクロアルキル基を指す。

【0026】

ハロゲンとは、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の組み合わせでハロゲンにも適用される。

【0027】

本発明に関連して、置換基の定義における「単置換又は多置換」は、典型的には、置換基の化学構造に応じて単置換～5回置換、より好ましくは単置換、二置換又は三置換を意味する。

40

【0028】

本発明に関連して、場合により、「 Q_1 は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、…」及び「 Q_1 は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、…」という句は、場合により式Qa又は式Qbに表されているとおり、置換基 Q_1 の基Qに対する特定の実施形態における結合に係る様式を指す。

【0029】

本発明に関連して、「 Q_1 は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、…」及び前記環系は、1、2又は3個の環ヘテロ原

50

子を含むことができ．．．」の例は、特にこれらに限定されないが、フェニル、ピリジニル及びピリミジニル；好ましくはフェニル、２－ピリジニル、３－ピリジニル、４－ピリジニル、ピリミジニル－２－イル、ピリミジニル－４－イル及びピリミジニル－５－イルである。

【００３０】

本発明に関連して、「Ｑ_１は、環窒素原子を介して、置換基Ａを含む環に結合されている５員芳香族環系であり、．．．及び前記環系は、１、２又は３個の環ヘテロ原子を含む．．．」の例は、特にこれらに限定されないが、ピラゾリル、ピロリル、イミダゾリル及びトリアゾリル；好ましくはピロール－１－イル、ピラゾール－１－イル、トリアゾール－２－イル、１，２，４－トリアゾール－１－イル、トリアゾール－１－イル及びイミダゾール－１－イルである。

10

【００３１】

本発明に係る特定の実施形態が以下に記載のとおり提供される。

【００３２】

実施形態１は、上記に定義されている、式Ⅰの化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはＮ－オキシドを提供する。

【００３３】

実施形態２は、実施形態１に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはＮ－オキシドを提供し、ここで、Ｑは、Ｑ_aであり、且つ以下に記載されているとおり、Ｇ_１、Ｇ_２、Ｒ_２、Ａ、Ｘ、Ｒ_１、Ｑ_１、Ｒ_４、Ｒ_５、Ｒ_６、Ｒ_７、Ｒ_８、Ｒ_９及びＲ_３の好ましい値を有する。

20

【００３４】

実施形態３は、実施形態１に係る化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはＮ－オキシドを提供し、ここで、Ｑは、Ｑ_bであり、且つ以下に記載されているとおりＧ_１、Ｇ_２、Ｒ_２、Ａ、Ｘ、Ｒ_１、Ｑ_１、Ｒ_４、Ｒ_５、Ｒ_６、Ｒ_７、Ｒ_８、Ｒ_９及びＲ_３の好ましい値を有する。

【００３５】

実施形態１～３に関して、Ｇ_１、Ｇ_２、Ｒ_２、Ａ、Ｘ、Ｒ_１、Ｑ_１、Ｒ_４、Ｒ_５、Ｒ_６、Ｒ_７、Ｒ_８、Ｒ_９及びＲ_３の好ましい値は、これらのいずれかの組み合わせにおいて、以下に記載されているとおりである。

【００３６】

好ましくは、Ｇ_１及びＧ_２の一方は、Ｎである。

30

【００３７】

Ｇ_１及びＧ_２が共にＮである場合が同様に好ましい。

【００３８】

Ｇ_１及びＧ_２が共にＣＨである場合が同様に好ましい。

【００３９】

最も好ましくは、Ｇ_１は、ＣＨであり、及びＧ_２は、Ｎであるか；又はＧ_１及びＧ_２は、共にＣＨである。

【００４０】

好ましくは、Ｒ_２は、ハロゲン、Ｃ_１～Ｃ_６ハロアルキル又はＣ_１～Ｃ_６ハロアルコキシである。

40

【００４１】

より好ましくは、Ｒ_２は、Ｃ_１～Ｃ_６ハロアルコキシである。

【００４２】

最も好ましくは、Ｒ_２は、－ＯＣＨ_２ＣＦ_２ＣＨＦ_２又は－ＯＣＨ_２ＣＦ_２ＣＦ_３である。

【００４３】

好ましくは、Ａは、Ｎである。

【００４４】

好ましくは、Ｘは、Ｓ、ＳＯ_２又はＳ（Ｏ）ＮＨである。

【００４５】

50

より好ましくは、Xは、 SO_2 又は $\text{S}(\text{O})\text{NH}$ である。

【0046】

最も好ましくは、Xは、 SO_2 である。

【0047】

好ましくは、 R_1 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル又は $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル- $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルである。

【0048】

より好ましくは、 R_1 は、エチル又はシクロプロピルメチルである。

【0049】

最も好ましくは、 R_1 は、エチルである。

10

【0050】

好ましくは、 Q_1 は、水素、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ シアノアルコキシ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $-\text{N}(\text{R}_4)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{COR}_5$ 又は $-\text{N}(\text{R}_4)\text{CON}(\text{R}_4)_2$ 、 $-\text{N}=\text{S}(\text{O})\text{R}_6\text{R}_7$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

Q_1 は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

20

Q_1 は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有する。

【0051】

より好ましくは、 Q_1 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、シアノイソプロポキシ、トリフルオロエトキシ、 $-\text{N}(\text{R}_4)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{COR}_5$ 、 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{CON}(\text{R}_4)_2$ であり、その各々において、 R_4 は、独立して、水素若しくはメチルのいずれかであり、及び R_5 は、メチル若しくはシクロプロピルのいずれかであるか、又は Q_1 は、 $-\text{N}=\text{S}(\text{O})(\text{CH}_3)_2$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル、2-ピリジルオキシ、無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾールであるか、又は Q_1 は、無置換N結合トリアゾール又は無置換C結合ピリミジンである。

30

【0052】

最も好ましくは、 Q_1 は、水素、塩素、臭素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、 $-\text{NH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CO}$ (シクロプロピル)、 $-\text{N}(\text{H})\text{CONH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)\text{CONH}(\text{CH}_3)$ 、 $-\text{N}=\text{S}(\text{O})(\text{CH}_3)_2$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル、2-ピリジルオキシ、ピラゾール-1-イル、3-クロロ-ピラゾール-1-イル、3-シアノ-ピラゾール-1-イル、3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである。

40

【0053】

好ましくは、各 R_4 は、独立して、水素又は $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキルである。

【0054】

最も好ましくは、各 R_4 は、独立して、水素又はメチルである。

【0055】

好ましくは、 R_5 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル又は $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキルである。

50

【0056】

より好ましくは、 R_5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はシクロプロピルである。

【0057】

最も好ましくは、 R_5 は、メチル又はシクロプロピルである。

【0058】

好ましくは、 R_6 及び R_7 は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0059】

最も好ましくは、 R_6 及び R_7 は、メチルである。

【0060】

好ましくは、 R_8 及び R_9 は、相互に独立して、水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

10

【0061】

最も好ましくは、 R_8 及び R_9 は、相互に独立して、水素又はメチルである。

【0062】

好ましくは、 R_3 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである。

【0063】

より好ましくは、 R_3 は、水素又はメチルである。

【0064】

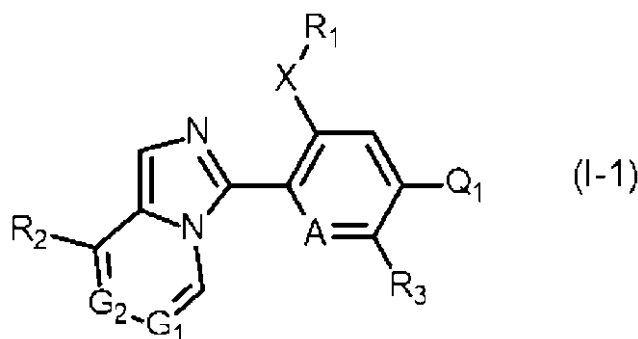
最も好ましくは、 R_3 は、水素である。

【0065】

本発明に係る化合物の1つの群は、式I-1

20

【化3】



30

(式中、 A 、 X 、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 は、式Iの化合物(上記)について定義されているとおりである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドであり、ここで、 Q_1 は、好ましくは、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、 $-N=S(O)R_6R_7$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

40

Q_1 は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q_1 は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

R_3 は、好ましくは、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

50

好ましくは、各 R_4 は、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；
 R_5 は、好ましくは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；及び
 好ましくは、 R_6 及び R_7 は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0066】

A、X、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 の好ましい定義は、式 I の化合物（上記）について定義されているとおりであり、より好ましくは、 Q_1 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、シアノイソプロポキシ、トリフルオロエトキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、 R_4 は、独立して、水素若しくはメチルのいずれかであり、及び R_5 は、メチル若しくはシクロプロピルのいずれかであるか、又は Q_1 は、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、（オキサゾリジン-2-オン）-3-イル、2-ピリジルオキシ、無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されている N 結合ピラゾリルであるか、又は Q_1 は、無置換 N 結合トリアゾリル又は無置換 C 結合ピリミジニルであり；及び R_3 は、水素又はメチル、好ましくは水素である。

10

【0067】

本実施形態に係る化合物の 1 つの群は、A が N である式（I-1）の化合物である、式（I-1 a）の化合物である。

【0068】

本実施形態に係る化合物の他の群は、A が CH である式（I-1）の化合物である、式（I-1 b）の化合物である。

20

【0069】

本実施形態に係る化合物の 1 つの群は、 G_2 が N であり、及び G_1 が CH である式（I-1）の化合物である、式（I-1 c）の化合物である。

【0070】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共に CH である式（I-1）の化合物である、式（I-1 d）の化合物である。

【0071】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 が CH であり、及び G_1 が N である式（I-1）の化合物である、式（I-1 e）の化合物である。

30

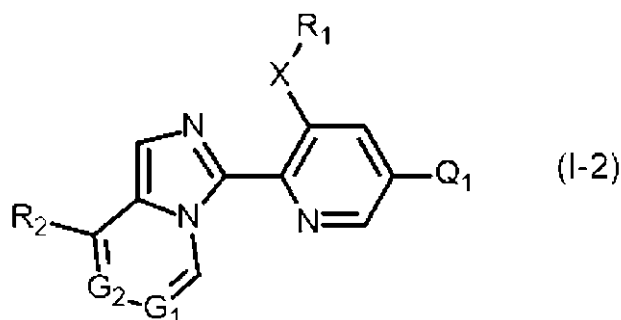
【0072】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共に N である式（I-1）の化合物である、式（I-1 f）の化合物である。

【0073】

本発明に係る化合物の他の群は、式 I-2

【化 4】



40

（式中、X、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 は、式 I の化合物（上記）について定義されているとおりである）

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しく

50

はN-オキシドであり、ここで、 Q_1 は、好ましくは、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、 $-N=S(O)R_6R_7$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

Q_1 は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q_1 は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

好ましくは、各 R_4 は、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R_5 は、好ましくは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；及び

好ましくは、 R_6 及び R_7 は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0074】

X、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 の好ましい定義は、式Iの化合物（上記）について定義されているとおりであり、より好ましくは、 Q_1 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、シアノイソプロポキシ、トリフルオロエトキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、 R_4 は、独立して、水素若しくはメチルのいずれかであり、及び R_5 は、メチル若しくはシクロプロピルのいずれかであるか、又は Q_1 は、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル、2-ピリジルオキシ、無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルであるか、又は Q_1 は、無置換N結合トリアゾリル又は無置換C結合ピリミジニルである。

【0075】

本実施形態に係る化合物の1つの群は、XがS又は SO_2 、好ましくは SO_2 である式(I-2)の化合物である、式(I-2a-1)の化合物である。

【0076】

本実施形態に係る化合物の他の群は、Xが $S(O)NH$ である式(I-2)の化合物である、式(I-2a-2)の化合物である。

【0077】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 R_1 が $C_1 \sim C_4$ アルキル又はシクロプロピル- $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはエチル又はシクロプロピルメチルである式(I-2)の化合物である、式(I-2b-1)の化合物である。

【0078】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 R_1 が $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはエチルである式(I-2)の化合物である、式(I-2b-2)の化合物である。

【0079】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ である式(I-2)の化合物である、式(I-2c)の化合物である。

【0080】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_1 がCHであり、及び G_2 がNであるか、又は G_1 がNであり、及び G_2 がCHであり、好ましくは G_1 がCHであり、及び G_2 がNである式(I-2)の化合物である、式(I-2d)の化合物である。

【0081】

10

20

30

40

50

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共にNである式(I-2)の化合物である、式(I-2e)の化合物である。

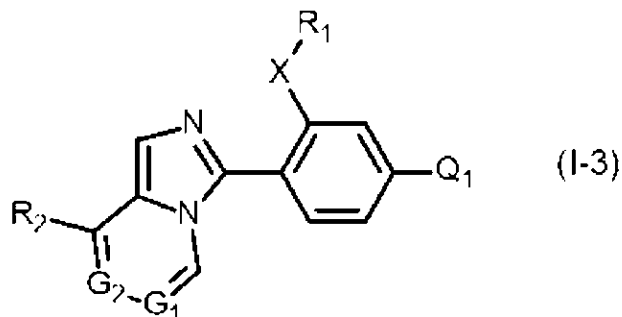
【0082】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共にCHである式(I-2)の化合物である、式(I-2f)の化合物である。

【0083】

本発明に係る化合物の他の群は、式I-3

【化5】



10

(式中、X、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 は、式Iの化合物(上記)について定義されているとおりである)

20

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドであり、ここで、 Q_1 は、好ましくは、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、 $-N=S(O)R_6R_7$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

Q_1 は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

30

Q_1 は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

好ましくは、各 R_4 は、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R_5 は、好ましくは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；及び

好ましくは、 R_6 及び R_7 は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0084】

40

X、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 の好ましい定義は、式Iの化合物(上記)について定義されているとおりであり、より好ましくは、 Q_1 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、シアノイソプロポキシ、トリフルオロエトキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、 R_4 は、独立して、水素若しくはメチルのいずれかであり、及び R_5 は、メチル若しくはシクロプロピルのいずれかであるか、又は Q_1 は、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル、2-ピリジルオキシ、無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルであるか、又は Q_1 は、無置換N結合トリアゾリル又は無置換C結合ピリミジニルである。

50

【0085】

本実施形態に係る化合物の1つの群は、XがS又はSO₂、好ましくはSO₂である式(I-3)の化合物である、式(I-3a-1)の化合物である。

【0086】

本実施形態に係る化合物の他の群は、XがS(O)NHである式(I-3)の化合物である、式(I-3a-2)の化合物である。

【0087】

本実施形態に係る化合物の他の群は、R₁がC₁~C₄アルキル又はシクロプロピル-C₁~C₄アルキル、好ましくはエチル又はシクロプロピルメチルである式(I-3)の化合物である、式(I-3b-1)の化合物である。

10

【0088】

本実施形態に係る化合物の他の群は、R₁がC₁~C₄アルキル、好ましくはエチルである式(I-3)の化合物である、式(I-3b-2)の化合物である。

【0089】

本実施形態に係る化合物の他の群は、R₂がC₁~C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃である式(I-3)の化合物である、式(I-3c)の化合物である。

【0090】

本実施形態に係る化合物の他の群は、G₁がCHであり、及びG₂がNであるか、又はG₁がNであり、及びG₂がCHであり、好ましくはG₁がCHであり、及びG₂がNである式(I-3)の化合物である、式(I-3d)の化合物である。

20

【0091】

本実施形態に係る化合物の他の群は、G₂及びG₁が共にNである式(I-3)の化合物である、式(I-3e)の化合物である。

【0092】

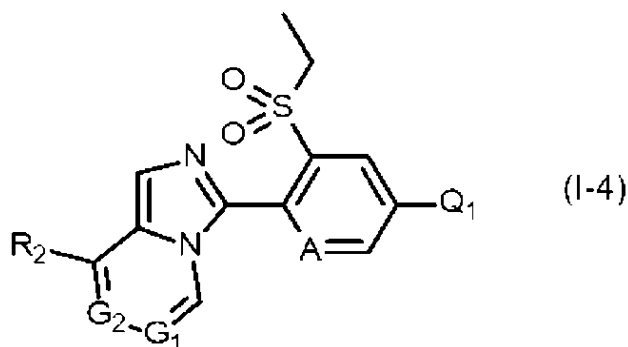
本実施形態に係る化合物の他の群は、G₂及びG₁が共にCHである式(I-3)の化合物である、式(I-3f)の化合物である。

【0093】

本発明に係る化合物の他の群は、式I-4

【化6】

30



40

(式中、

Aは、CH又はN、好ましくはNであり；

R₂は、C₁~C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

G₁は、CH又はN、好ましくはCHであり；

G₂は、CH又はNであり；及び

Q₁は、水素、ハロゲン、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₃~C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃~C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁~C₆アルキル、C₁~C₆シアノアルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ

50

、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、 $-N=S(O)R_6R_7$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

Q_1 は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1\sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q_1 は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1\sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

好ましくは、各 R_4 は、独立して、水素又は $C_1\sim C_4$ アルキル、好ましくは水素又はメチルであり；

R_5 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、好ましくはメチル又はシクロプロピルであり；及び

好ましくは、 R_6 及び R_7 は、相互に独立して、 $C_1\sim C_6$ アルキル、好ましくはメチルである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドである。

【0094】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、AがNである式(I-4)の化合物である、式(I-4-1a)の化合物である。

【0095】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、AがCHである式(I-4)の化合物である、式(I-4-1b)の化合物である。

【0096】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 がNであり、及び G_1 がCHである式(I-4)の化合物である、式(I-4-1c)の化合物である。

【0097】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 及び G_1 が共にCHである式(I-4)の化合物である、式(I-4-1d)の化合物である。

【0098】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 がCHであり、及び G_1 がNである式(I-4)の化合物である、式(I-4-1e)の化合物である。

【0099】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 及び G_1 が共にNである式(I-4)の化合物である、式(I-4-1f)の化合物である。

【0100】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、 Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ シアノアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1\sim C_4$ アルキル(好ましくは水素又はメチル)であり、及び R_5 が $C_1\sim C_6$ アルキル(好ましくはメチル)であるか、又は Q_1 が2-ピリジルオキシ又は $-N=S(O)R_6R_7$ であり、 R_6 及び R_7 が、相互に独立して、 $C_1\sim C_6$ アルキル、好ましくはメチルであるか；又は

Q_1 が、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系が、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1\sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系が2個の環窒素原子を含有し；好ましくは、 Q_1 が、無置換であるか、又はクロロ、シアノ若しくはト

10

20

30

40

50

リフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルである式(I-4)の化合物である、式(I-4a-1)の化合物である。

【0101】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、 Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル(好ましくは水素又はメチル)であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル(好ましくはメチル)、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ又は無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)COシクロプロピル$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ、ピラゾール-1-イル、3-クロロ-ピラゾール-1-イル、3-シアノ-ピラゾール-1-イル又は3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イルである式(I-4)の化合物である、式(I-4a-2)の化合物である。

10

【0102】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

20

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がNであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル(好ましくは水素又はメチル)であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル(好ましくはメチル)、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4)の化合物である、式(I-4b)の化合物である。

30

【0103】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

40

G_2 がNであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 及び R_5 が、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル(好ましくは共にメチル)、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素若しくは臭素(より好ましくは臭素)、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4)の化合物である、式(I-4c)の化合物である。

【0104】

50

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

G₁がNであり；

G₂がCHであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅であり、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル（好ましくはメチル）、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシである式(I-4)の化合物である、式(I-4d)の化合物である。

10

【0105】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

20

G₁がNであり；

G₂がCHであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、-N(R₄)COR₅であり、R₄及びR₅が、相互に独立して、C₁～C₄アルキル（好ましくはメチル）、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは臭素）、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-N(CH₃)COCH₃、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシである式(I-4)の化合物である、式(I-4e)の化合物である。

30

【0106】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

G₁がNであり；

G₂がNであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅であり、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル（好ましくはメチル）、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシである式(I-4)の化合物である、式(I-4f)の化合物である。

40

【0107】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF

50

$2CF_3$ であり；

G_1 がNであり；

G_2 がNであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 及び R_5 が、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくはメチル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは臭素）、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4)の化合物である、式(I-4g)の化合物である。

10

【0108】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がCHであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル（好ましくはメチル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4)の化合物である、式(I-4h)の化合物である。

20

【0109】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がCHであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 及び R_5 が、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくはメチル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは臭素）、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4)の化合物である、式(I-4i)の化合物である。

30

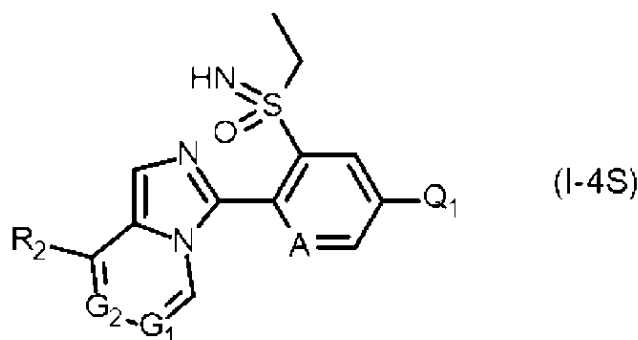
40

【0110】

本発明に係る化合物の他の群は、式I-4S

50

【化 7】



10

(式中、

A は、CH 又は N、好ましくは N であり；

R₂ は、C₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-\text{OCH}_2\text{CF}_2\text{CHF}_2$ 又は $-\text{OCH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ であり；G₁ は、CH 又は N、好ましくは CH であり；G₂ は、CH 又は N であり；及び

Q₁ は、水素、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、 $-\text{N}(\text{R}_4)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}_4)\text{COR}_5$ 又は $-\text{N}(\text{R}_4)\text{CON}(\text{R}_4)_2$ 、 $-\text{N}=\text{S}(\text{O})\text{R}_6\text{R}_7$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

20

Q₁ は、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q₁ は、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

30

好ましくは、各 R₄ は、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル、好ましくは水素又はメチルであり；

R₅ は、C₁～C₆アルキル又はC₃～C₆シクロアルキル、好ましくはメチル又はシクロプロピルであり；及び

好ましくは、R₆ 及び R₇ は、相互に独立して、C₁～C₆アルキル、好ましくはメチルである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドである。

40

【0111】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、A が N である式 (I-4S) の化合物である、式 (I-4S-1a) の化合物である。

【0112】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、A が CH である式 (I-4S) の化合物である、式 (I-4S-1b) の化合物である。

【0113】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、G₂ が N であり、及び G₁ が CH である式 (I-4S) の化合物である、式 (I-4S-1c) の化合物である。

【0114】

50

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 及び G_1 が共にCHである式(I-4S)の化合物である、式(I-4S-1d)の化合物である。

【0115】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 がCHであり、及び G_1 がNである式(I-4S)の化合物である、式(I-4S-1e)の化合物である。

【0116】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 及び G_1 が共にNである式(I-4S)の化合物である、式(I-4S-1f)の化合物である。

【0117】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、 Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル(好ましくは水素又はメチル)であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル(好ましくはメチル)であるか、又は Q_1 が2-ピリジルオキシ又は $-N=S(O)R_6R_7$ であり、 R_6 及び R_7 が、相互に独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、好ましくはメチルであるか；又は

Q_1 が、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系が、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系が2個の環窒素原子を含有し；好ましくは、 Q_1 が、無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Sa-1)の化合物である。

【0118】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、 Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル(好ましくは水素又はメチル)であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル(好ましくはメチル)、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ又は無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ シクロプロピル、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ、ピラゾール-1-イル、3-クロロ-ピラゾール-1-イル、3-シアノ-ピラゾール-1-イル又は3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イルである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Sa-2)の化合物である。

【0119】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がNであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル(好ましくは水素又はメチル)であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル(好

10

20

30

40

50

ましくはメチル)、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり;好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Sb)の化合物である。

【0120】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり;

R_2 が $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり;

G_1 がCHであり;

G_2 がNであり;及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 及び R_5 が、相互に独立して、 $C_1\sim C_4$ アルキル(好ましくは共にメチル)、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり;好ましくは、 Q_1 が水素、塩素若しくは臭素(より好ましくは臭素)、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Sc-1)の化合物である。

10

20

【0121】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり;

R_2 が $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり;

G_1 がCHであり;

G_2 がNであり;及び

Q_1 が $C_1\sim C_6$ シアノアルコキシ、好ましくは1-シアノ-1-メチル-エトキシである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Sc-2)の化合物である。

30

【0122】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり;

R_2 が $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり;

G_1 がNであり;

G_2 がCHであり;及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1\sim C_4$ アルキル(好ましくは水素又はメチル)であり、及び R_5 が $C_1\sim C_6$ アルキル(好ましくはメチル)、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり;好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Sd)の化合物である。

40

【0123】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり;

R_2 が $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF$

50

$2CF_3$ であり；

G_1 がNであり；

G_2 がCHであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 及び R_5 が、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくはメチル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは臭素）、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Se)の化合物である。

10

【0124】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がNであり；

G_2 がNであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル（好ましくはメチル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4Sf)の化合物である、式(I-4Sf)の化合物である。

20

【0125】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がNであり；

G_2 がNであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 及び R_5 が、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくはメチル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは臭素）、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Sg)の化合物である。

30

40

【0126】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がCHであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C$

50

6シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル（好ましくはメチル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Sh)の化合物である。

【0127】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

10

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がCHであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)COR_5$ であり、 R_4 及び R_5 が、相互に独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくはメチル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは臭素）、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Si-1)の化合物である。

20

【0128】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がCHであり；及び

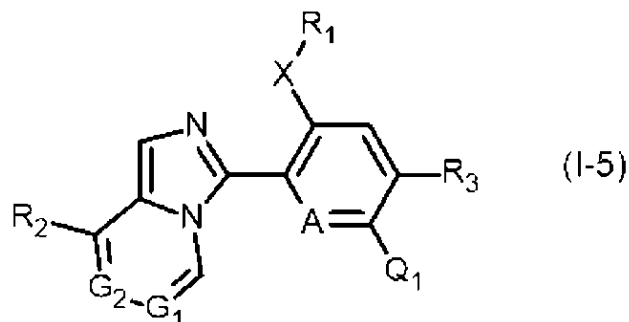
Q_1 が $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、好ましくは1-シアノ-1-メチル-エトキシである式(I-4S)の化合物である、式(I-4Si-2)の化合物である。

30

【0129】

本発明に係る化合物の1つの群は、式I-5

【化8】



40

（式中、A、X、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 は、式Iの化合物（上記）について定義されているとおりである）

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドであり、ここで、 Q_1 は、好ましくは、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロ

50

アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、 $-N=S(O)R_6R_7$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

Q_1 は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q_1 は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

R_3 は、好ましくは、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

好ましくは、各 R_4 は、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R_5 は、好ましくは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；及び

好ましくは、 R_6 及び R_7 は、相互に独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0130】

A、X、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 の好ましい定義は、式Iの化合物（上記）について定義されているとおりであり、より好ましくは、 Q_1 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、シアノイソプロポキシ、トリフルオロエトキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、 R_4 は、独立して、水素若しくはメチルのいずれかであり、及び R_5 は、メチル若しくはシクロプロピルのいずれかであるか、又は Q_1 は、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル、2-ピリジルオキシ、無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルであるか、又は Q_1 は、無置換N結合トリアゾリル又は無置換C結合ピリミジニルであり；及び R_3 は、水素又はメチル、好ましくは水素である。

【0131】

本実施形態に係る化合物の1つの群は、AがNである式(I-5)の化合物である、式(I-5a)の化合物である。

【0132】

本実施形態に係る化合物の他の群は、AがCHである式(I-5)の化合物である、式(I-5b)の化合物である。

【0133】

本実施形態に係る化合物の1つの群は、 G_2 がNであり、及び G_1 がCHである式(I-5)の化合物である、式(I-5c)の化合物である。

【0134】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共にCHである式(I-5)の化合物である、式(I-5d)の化合物である。

【0135】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 がCHであり、及び G_1 がNである式(I-5)の化合物である、式(I-5e)の化合物である。

【0136】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共にNである式(I-5)の化合物である、式(I-5f)の化合物である。

【0137】

本発明に係る化合物の他の群は、式I-6

10

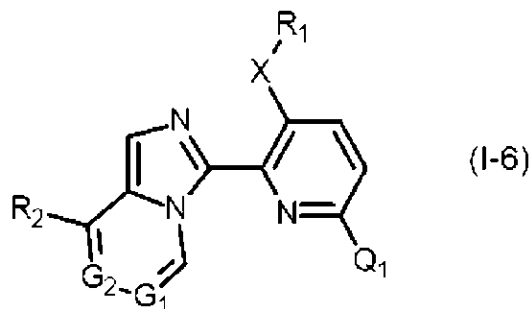
20

30

40

50

【化 9】



10

(式中、X、R₁、R₂、G₁及びG₂は、式Iの化合物(上記)について定義されているとおりである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドであり、ここで、Q₁は、好ましくは、水素、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅又は-N(R₄)CON(R₄)₂、-N=S(O)R₆R₇、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

20

Q₁は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q₁は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

好ましくは、各R₄は、独立して、水素又はC₁～C₄アルキルであり；

30

R₅は、好ましくは、C₁～C₆アルキル又はC₃～C₆シクロアルキルであり；及び

好ましくは、R₆及びR₇は、相互に独立して、C₁～C₆アルキルである。

【0138】

X、R₁、R₂、G₁及びG₂の好ましい定義は、式Iの化合物(上記)について定義されているとおりであり、より好ましくは、Q₁は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、シアノイソプロポキシ、トリフルオロエトキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅、-N(R₄)CON(R₄)₂であり、その各々において、R₄は、独立して、水素若しくはメチルのいずれかであり、及びR₅は、メチル若しくはシクロプロピルのいずれかであるか、又はQ₁は、-N=S(O)(CH₃)₂、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル、2-ピリジルオキシ、無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルであるか、又はQ₁は、無置換N結合トリアゾリル又は無置換C結合ピリミジニルである。

40

【0139】

本実施形態に係る化合物の1つの群は、XがS又はSO₂、好ましくはSO₂である式(I-6)の化合物である、式(I-6a-1)の化合物である。

【0140】

本実施形態に係る化合物の他の群は、XがS(O)NHである式(I-6)の化合物である、式(I-6a-2)の化合物である。

【0141】

50

本実施形態に係る化合物の他の群は、 R_1 が $C_1 \sim C_4$ アルキル又はシクロプロピル- $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはエチル又はシクロプロピルメチルである式(I-6)の化合物である、式(I-6b-1)の化合物である。

【0142】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 R_1 が $C_1 \sim C_4$ アルキル、好ましくはエチルである式(I-6)の化合物である、式(I-6b-2)の化合物である。

【0143】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ である式(I-6)の化合物である、式(I-6c)の化合物である。

10

【0144】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_1 が CH であり、及び G_2 が N であるか、又は G_1 が N であり、及び G_2 が CH であり、好ましくは G_1 が CH であり、及び G_2 が N である式(I-6)の化合物である、式(I-6d)の化合物である。

【0145】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共に N である式(I-6)の化合物である、式(I-6e)の化合物である。

【0146】

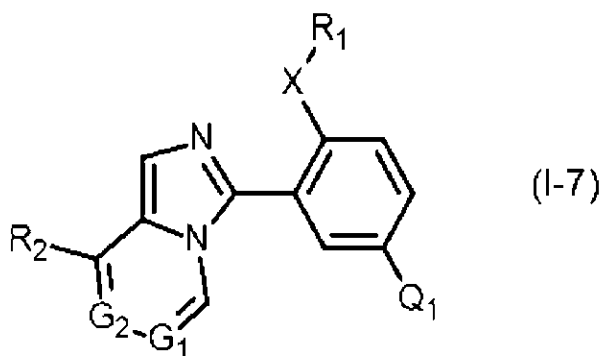
本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共に CH である式(I-6)の化合物である、式(I-6f)の化合物である。

20

【0147】

本発明に係る化合物の他の群は、式I-7

【化10】



30

(式中、 X 、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 は、式Iの化合物(上記)について定義されているとおりである)

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくは N -オキシドであり、ここで、 Q_1 は、好ましくは、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ 、 $-N=S(O)R_6R_7$ 、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イル又は2-ピリジルオキシであるか；又は

40

Q_1 は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

Q_1 は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル

50

からなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

好ましくは、各 R_4 は、独立して、水素又は $C_1\sim C_4$ アルキルであり；

R_5 は、好ましくは、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_3\sim C_6$ シクロアルキルであり；及び好ましくは、 R_6 及び R_7 は、相互に独立して、 $C_1\sim C_6$ アルキルである。

【0148】

X 、 R_1 、 R_2 、 G_1 及び G_2 の好ましい定義は、式Iの化合物（上記）について定義されているとおりであり、より好ましくは、 Q_1 は、水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノシクロプロピル、シアノイソプロピル、シアノイソプロポキシ、トリフルオロエトキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、各 R_4 は、独立して、水素若しくはメチルのいずれかであり、及び R_5 は、メチル若しくはシクロプロピルにいずれかであるか、又は Q_1 は、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、（オキサゾリジン-2-オン）-3-イル、2-ピリジルオキシ、無置換であるか、若しくはクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されているN結合ピラゾリルであるか、又は Q_1 は、無置換N結合トリアゾリル又は無置換C結合ピリミジニルである。

10

【0149】

本実施形態に係る化合物の1つの群は、 X が S 又は SO_2 、好ましくは SO_2 である式（I-7）の化合物である、式（I-7a-1）の化合物である。

【0150】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 X が $S(O)NH$ である式（I-7）の化合物である、式（I-7a-2）の化合物である。

20

【0151】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 R_1 が $C_1\sim C_4$ アルキル又はシクロプロピル- $C_1\sim C_4$ アルキル、好ましくはエチル又はシクロプロピルメチルである式（I-7）の化合物である、式（I-7b-1）の化合物である。

【0152】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 R_1 が $C_1\sim C_4$ アルキル、好ましくはエチルである式（I-7）の化合物である、式（I-7b-2）の化合物である。

【0153】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 R_2 が $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ である式（I-7）の化合物である、式（I-7c）の化合物である。

30

【0154】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_1 が CH であり、及び G_2 が N であるか、又は G_1 が N であり、及び G_2 が CH であり、好ましくは G_1 が CH であり、及び G_2 が N である式（I-7）の化合物である、式（I-7d）の化合物である。

【0155】

本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共に N である式（I-7）の化合物である、式（I-7e）の化合物である。

40

【0156】

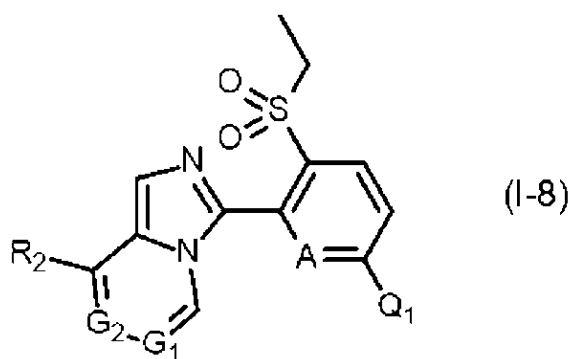
本実施形態に係る化合物の他の群は、 G_2 及び G_1 が共に CH である式（I-7）の化合物である、式（I-7f）の化合物である。

【0157】

本発明に係る化合物の他の群は、式I-8

50

【化 1 1】



10

(式中、

Aは、CH又はN、好ましくはNであり；

R₂は、C₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは－OCH₂CF₂CHF₂又は－OCH₂CF₂CF₃であり；G₁は、CH又はN、好ましくはCHであり；G₂は、CH又はNであり；及び

20

Q₁は、水素、ハロゲン、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、－N(R₄)₂、－N(R₄)COR₅又は－N(R₄)CON(R₄)₂、－N＝S(O)R₆R₇、(オキサゾリジン－2－オン)－3－イル又は2－ピリジルオキシであるか；又は

Q₁は、環炭素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員～6員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、1又は2個の環窒素原子を含有することができるか；又は

30

Q₁は、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系であり、前記環系は、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及びC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系は、2又は3個の環窒素原子を含有し；

好ましくは、各R₄は、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル、好ましくは水素又はメチルであり；

R₅は、C₁～C₆アルキル又はC₃～C₆シクロアルキル、好ましくはメチル又はシクロプロピルであり；及び

好ましくは、R₆及びR₇は、相互に独立して、C₁～C₆アルキル、好ましくはメチルである)

40

のもの又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN－オキシドである。

【0158】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、AがNである式(I-8)の化合物である、式(I-8-1a)の化合物である。

【0159】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、AがCHである式(I-8)の化合物である、式(I-8-1b)の化合物である。

【0160】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、G₂がNであり、及びG₁がCHである式

50

(I-8) の化合物である、式 (I-8-1c) の化合物である。

【0161】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 及び G_1 が共に CH である式 (I-8) の化合物である、式 (I-8-1d) の化合物である。

【0162】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 が CH であり、及び G_1 が N である式 (I-8) の化合物である、式 (I-8-1e) の化合物である。

【0163】

本実施形態に係る化合物の他の好ましい群は、 G_2 及び G_1 が共に N である式 (I-8) の化合物である、式 (I-8-1f) の化合物である。

10

【0164】

本実施形態に係る化合物に係る 1 つのさらなる好ましい群は、 Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル (好ましくは水素又はメチル) であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル (好ましくはメチル又はシクロプロピル) であるか、又は Q_1 が (オキサゾリジン-2-オン)-3-イルであるか；又は

Q_1 が、環炭素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 6 員芳香族環系であり、前記環系が、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系が 2 個の環窒素原子を含有し；好ましくは、 Q_1 が、クロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換され得るピリミジニルであるか；又は

20

Q_1 が、環窒素原子を介して、置換基 A を含有する環に結合されている 5 員芳香族環系であり、前記環系が、無置換であるか、又はハロゲン、シアノ及び $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基によって単置換されており；及び前記環系が 3 個の環窒素原子を含有し；好ましくは、 Q_1 が、無置換であるか、又はクロロ、シアノ若しくはトリフルオロメチルによって単置換されている N 結合トリアゾリルである式 (I-8) の化合物である、式 (I-8a-1) の化合物である。

【0165】

本実施形態に係る化合物に係る 1 つのさらなる好ましい群は、 Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル (好ましくは水素又はメチル) であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル (好ましくはメチル又はシクロプロピル)、(オキサゾリジン-2-オン)-3-イルであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)COCH_2CH_3$ 、 $-NHCO$ (シクロプロピル)、 $-N(CH_3)CO$ (シクロプロピル)、 $-N(H)CONH_2$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(H)CON(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_3)CONH_2$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CON(CH_3)_2$ 又は (オキサゾリジン-2-オン)-3-イルであるか；又は

30

Q_1 が無置換 N 結合トリアゾリル、好ましくは 1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式 (I-8) の化合物である、式 (I-8a-2) の化合物である。

40

【0166】

本実施形態に係る化合物に係る 1 つのさらなる好ましい群は、

A が N であり；

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 が CH であり；

G_2 が N であり；及び

50

Q₁が水素、ハロゲン、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）又は（オキサゾリジン-2-オン）-3-イルであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素、臭素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 又は（オキサゾリジン-2-オン）-3-イルであるか；又は

Q₁が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式（I-8）の化合物である、式（I-8b）の化合物である。

10

【0167】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G₁がCHであり；

G₂がNであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）又は無置換N結合トリアゾリル若しくは無置換ピリミジニルであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは塩素）、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式（I-8）の化合物である、式（I-8c）の化合物である。

20

【0168】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G₁がNであり；

G₂がCHであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）又は（オキサゾリジン-2-オン）-3-イルであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素、臭素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 又は（オキサゾリジン-2-オン）-3-イルであるか；又は

40

Q₁が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イル又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式（I-8）の化合物である、式（I-8d）の化合物である。

【0169】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

50

G₁がNであり；

G₂がCHであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）又は無置換N結合トリアゾリル若しくは無置換ピリミジニルであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは塩素）、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式（I-8）の化合物である、式（I-8e）の化合物である。

10

【0170】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G₁がNであり；

G₂がNであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）又は（オキサゾリジン-2-オン）-3-イルであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素、臭素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 又は（オキサゾリジン-2-オン）-3-イルであるか；又は

20

Q₁が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式（I-8）の化合物である、式（I-8f）の化合物である。

【0171】

30

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G₁がNであり；

G₂がNであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）又は無置換N結合トリアゾリル若しくは無置換ピリミジニルであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは塩素）、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式（I-8）の化合物である、式（I-8g）の化合物である。

40

【0172】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

50

G₁がCHであり；

G₂がCHであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）又は（オキサゾリジン-2-オン）-3-イルであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素、臭素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 又は（オキサゾリジン-2-オン）-3-イルであるか；又は

Q₁が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式（I-8）の化合物である、式（I-8h）の化合物である。

10

【0173】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G₁がCHであり；

G₂がCHであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 、 $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）又は無置換N結合トリアゾリル若しくは無置換ピリミジニルであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは塩素）、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式（I-8）の化合物である、式（I-8i）の化合物である。

20

【0174】

本実施形態に係る化合物に係る1つのさらなる好ましい群は、

AがNであり；

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G₁がCHであり；

G₂がCHであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）又は無置換N結合トリアゾリルであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素若しくは臭素（より好ましくは塩素）、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式（I-8）の化合物である、式（I-8j）の化合物である。

30

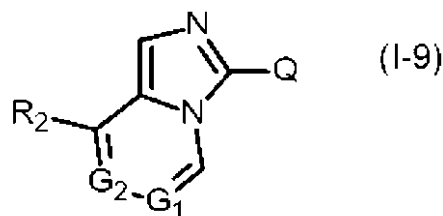
40

【0175】

本発明に係る化合物の際立った群は、式I-9

50

【化 1 2】



10

(式中、

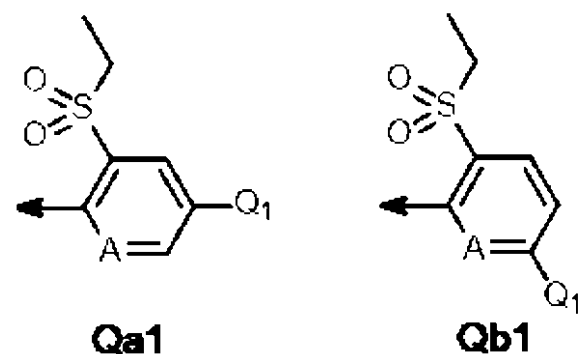
R_2 は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 は、 CH 又は N 、好ましくは CH であり；

G_2 は、 CH 又は N であり；及び

Q は、式 $Qa1$ 及び $Qb1$

【化 1 3】



20

(式中、矢印は、二環式環に対する結合点を示し；

A は、 CH 又は N 、好ましくは N であり；及び

Q_1 は、水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、 R_4 は、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及び R_5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル若しくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 は、水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであるか；又は

Q_1 は、無置換 N 結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである）からなる群から選択される基である）

のものである。

【0 1 7 6】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 が CH であり；

50

G₂がNであり；及び

Qが、式Q a 1及びQ b 1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであるか；又は

Q₁が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式(I-9)の化合物である、式(I-9 a)の化合物である。

【0177】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G₁がCHであり；

G₂がNであり；及び

Qが、式Q a 1及びQ b 1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q₁が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式(I-9)の化合物である、式(I-9 b)の化合物である。

【0178】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G₁がCHであり；

G₂がNであり；及び

Qが、式Q a 1及びQ b 1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q₁が水素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ又は $-N(CH_3)COCH_3$ （QがQ a 1である場合）であるか；又はQ₁が水素、塩素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イル（QがQ b 1である場合）である式(I-9)の化合物である、式(I-9 c-1)の化合物である。

【0179】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

10

20

30

40

50

G_1 がCHであり；

G_2 がNであり；及び

Qが、式Q a 1及びQ b 1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q_1 が水素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ又は $-N(CH_3)COCH_3$ (QがQ a 1である場合)であるか；又は
 Q_1 が水素、塩素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イル (QがQ b 1である場合)である式 (I-9) の化合物である、式 (I-9 c-2) の化合物である。

10

【0180】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がNであり；

G_2 がCHであり；及び

Qが、式Q a 1及びQ b 1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、その各々において、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル (好ましくは水素又はメチル) であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル若しくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル (好ましくはメチル若しくはシクロプロピル)、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであるか；又は

20

Q_1 が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式 (I-9) の化合物である、式 (I-9 d) の化合物である。

30

【0181】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がNであり；

G_2 がCHであり；及び

Qが、式Q a 1及びQ b 1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (シクロプロピル)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式 (I-9) の化合物である、式 (I-9 e) の化合物である。

40

【0182】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$

50

$2CF_3$ であり；

G_1 がNであり；

G_2 がCHであり；及び

Qが、式Qa1及びQb1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q_1 が水素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ又は $-N(CH_3)COCH_3$ (QがQa1である場合) であるか；又は
 Q_1 が水素、塩素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (シクロプロピル)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、
 ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イル (QがQb1である場合) である式 (I-9) の化合物である、式 (I-9f) の化合物である。

10

【0183】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がNであり；

G_2 がNであり；及び

Qが、式Qa1及びQb1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり、
 その各々において、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル (好ましくは水素又はメチル) であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル若しくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル (好ましくはメチル若しくはシクロプロピル)、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、
 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (シクロプロピル)、
 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであるか；又は

20

Q_1 が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式 (I-9) の化合物である、式 (I-9g) の化合物である。

30

【0184】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がNであり；

G_2 がNであり；及び

Qが、式Qa1及びQb1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (シクロプロピル)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、
 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ、
 ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式 (I-9) の化合物である、式 (I-9h) の化合物である。

40

【0185】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

50

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

G₁がNであり；

G₂がNであり；及び

Qが、式Q a 1及びQ b 1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q₁が水素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-N=S(O)(CH₃)₂、2-ピリジルオキシ又は-N(CH₃)COCH₃(QがQ a 1である場合)であるか；又は
Q₁が水素、塩素、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(シクロプロピル)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イル(QがQ b 1である場合)である式(I-9)の化合物である、式(I-9 i)の化合物である。

10

【0186】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

G₁がCHであり；

G₂がCHであり；及び

Qが、式Q a 1及びQ b 1からなる群から選択される基であり、

20

AがNであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅又は-N(R₄)CON(R₄)₂であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル(好ましくは水素又はメチル)であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル(好ましくはメチル若しくはシクロプロピル)、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(シクロプロピル)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであるか；又は
Q₁が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式(I-9)の化合物である、式(I-9 j)の化合物である。

30

【0187】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

G₁がCHであり；

40

G₂がCHであり；及び

Qが、式Q a 1及びQ b 1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q₁が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CO(シクロプロピル)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N=S(O)(CH₃)₂、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式(I-9)の化合物である、式(I-9 k)の化合物である。

【0188】

50

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 が CH であり；

G_2 が CH であり；及び

Q が、式 $Qa1$ 及び $Qb1$ からなる群から選択される基であり、

A が N であり；及び

Q_1 が水素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ又は $-N(CH_3)COCH_3$ (Q が $Qa1$ である場合)であるか；又は
 Q_1 が水素、塩素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (シクロプロピル)、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、
 ピリジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イル (Q が $Qb1$ である場合)である式(I-9)の化合物である、式(I-9 l-1)の化合物である。

10

【0189】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 が CH であり；

G_2 が CH であり；及び

Q が、式 $Qa1$ 及び $Qb1$ からなる群から選択される基であり、

A が N であり；及び

Q_1 が水素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ又は $-N(CH_3)COCH_3$ (Q が $Qa1$ である場合)であるか；又は
 Q_1 が水素、塩素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ (シクロプロピル)又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イル (Q が $Qb1$ である場合)である式(I-9)の化合物である、式(I-9 l-2)の化合物である。

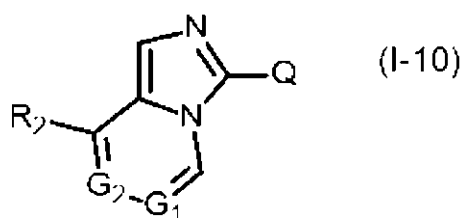
20

【0190】

本発明に係る化合物の他の際立った群は、式I-10

30

【化14】



40

(式中、

R_2 は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

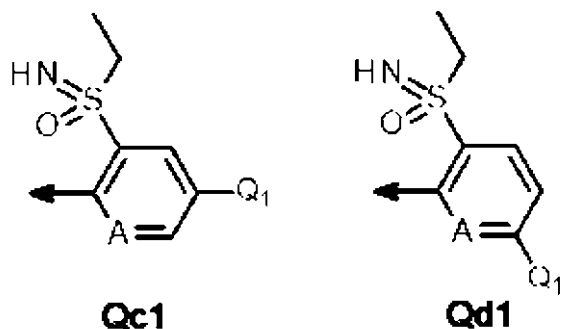
G_1 は、 CH 又は N 、好ましくは CH であり；

G_2 は、 CH 又は N であり；及び

Q は、式 $Qc1$ 及び $Qd1$

50

【化 1 5】



10

(式中、矢印は、二環式環に対する結合点を示し；

Aは、CH又はN、好ましくはNであり；及び

Q₁は、水素、ハロゲン、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅又は-N(R₄)CON(R₄)₂であり、その各々において、R₄は、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅は、C₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、Q₁は、水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(シクロプロピル)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであるか；又は

20

Q₁は、無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである）

からなる群から選択される基である）

のものである。

【0191】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

30

R₂がC₁～C₆ハロアルコキシ、好ましくは-OCH₂CF₂CHF₂又は-OCH₂CF₂CF₃であり；

G₁がCHであり；

G₂がNであり；及び

Qが、式Qc1及びQd1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q₁が水素、ハロゲン、C₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₃～C₆シクロアルキル、シアノによって単置換されたC₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルコキシ、-N(R₄)₂、-N(R₄)COR₅又は-N(R₄)CON(R₄)₂であり、その各々において、R₄が、独立して、水素又はC₁～C₄アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及びR₅がC₁～C₆アルキル若しくはC₃～C₆シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、Q₁が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、-NH(CH₃)、-N(CH₃)COCH₃、-N(CH₃)CO(シクロプロピル)、-N(H)CONH(CH₃)、-N(CH₃)CONH(CH₃)、-N=S(O)(CH₃)₂又は2-ピリジルオキシであるか；又は

40

Q₁が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式(I-10)の化合物である、式(I-10a)の化合物である。

50

【0192】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 が CH であり；

G_2 が N であり；及び

Q が、式 $Qc1$ 及び $Qd1$ からなる群から選択される基であり、

A が N であり；及び

Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式（I-10）の化合物である、式（I-10b）の化合物である。

10

【0193】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 が CH であり；

G_2 が N であり；及び

Q が、式 $Qc1$ 及び $Qd1$ からなる群から選択される基であり、

A が N であり；及び

Q_1 が水素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ又は $-N(CH_3)COCH_3$ （ Q が $Qc1$ である場合）であるか；又は Q_1 が水素、塩素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イル（ Q が $Qd1$ である場合）である式（I-10）の化合物である、式（I-10c）の化合物である。

20

【0194】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 が CH であり；

G_2 が N であり；及び

Q が $Qc1$ であり、

A が N であり；及び

Q_1 が1-シアノ-1-メチル-エトキシである式（I-10）の化合物である、式（I-10d）の化合物である。

30

【0195】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 が CH であり；

G_2 が CH であり；及び

Q が、式 $Qc1$ 及び $Qd1$ からなる群から選択される基であり、

A が N であり；及び

Q_1 が水素、ハロゲン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シアノによって単置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルコキシ、 $-N(R_4)_2$ 、 $-N(R_4)COR_5$ 又は $-N(R_4)CON(R_4)_2$ であり

40

50

、その各々において、 R_4 が、独立して、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル（好ましくは水素又はメチル）であり、及び R_5 が $C_1 \sim C_6$ アルキル若しくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（好ましくはメチル若しくはシクロプロピル）、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであり；好ましくは、 Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 又は2-ピリジルオキシであるか；又は
 Q_1 が無置換N結合トリアゾリル、好ましくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、又は無置換ピリミジニル、好ましくはピリミジン-2-イルである式(I-10)の化合物である、式(I-10e)の化合物である。

10

【0196】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がCHであり；及び

Qが、式Qc1及びQd1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q_1 が水素、塩素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イルである式(I-10)の化合物である、式(I-10f)の化合物である。

20

【0197】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がCHであり；及び

Qが、式Qc1及びQd1からなる群から選択される基であり、

AがNであり；及び

Q_1 が水素、臭素、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノ-1-メチル-エチル、1-シアノ-1-メチル-エトキシ、 $-N=S(O)(CH_3)_2$ 、2-ピリジルオキシ又は $-N(CH_3)COCH_3$ （QがQc1である場合）であるか；又は
 Q_1 が水素、塩素、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)COCH_3$ 、 $-N(CH_3)CO$ （シクロプロピル）、 $-N(H)CONH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)CONH(CH_3)$ 、ピリミジン-2-イル又は1, 2, 4-トリアゾール-1-イル（QがQd1である場合）である式(I-10)の化合物である、式(I-10g)の化合物である。

30

40

【0198】

本実施形態に係る化合物の1つのさらなる際立った群は、

R_2 が $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、好ましくは $-OCH_2CF_2CHF_2$ 又は $-OCH_2CF_2CF_3$ であり；

G_1 がCHであり；

G_2 がCHであり；及び

QがQc1であり、

AがNであり；及び

Q_1 が1-シアノ-1-メチル-エトキシである式(I-10)の化合物である、式(I-10h)の化合物である。

50

【0199】

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、向上した物理化学的特性又は高い生分解性又は環境プロファイル）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。

【0200】

他の態様において、本発明は、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、式（I-1）、（I-2）、（I-3）、（I-4）、（I-5）、（I-6）、（I-7）、（I-8）、（I-9）及び（I-10）の化合物に係る実施形態のいずれかに定義されている式（I）の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシドと、任意に助剤又は希釈剤とを含む組成物を提供する。

10

【0201】

さらなる態様において、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、式（I-1）、（I-2）、（I-3）、（I-4）、（I-5）、（I-6）、（I-7）、（I-8）、（I-9）及び（I-10）の化合物（上記）に係るいずれかの実施形態に定義されている式（I）の化合物又はその農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体若しくはN-オキシド或いは上記に定義されている組成物を適用する工程を含む方法を提供する。

20

【0202】

さらなる態様において、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、繁殖材料又は繁殖材料が植えられている場所を、上記に定義されている組成物で処理する工程を含む方法を提供する。

【0203】

本発明に係る式Iの化合物を調製するためのプロセスは、原理上、当業者に公知の方法により実施される。より具体的には、XがSO（スルホキシド）及び／又はSO₂（スルホン）である式Iの化合物のサブグループは、他の酸化剤の中でも、例えばメタクロロ過安息香酸（mCPBA）、過酸化水素、オキシソ、過ヨウ素酸ナトリウム、次亜塩素酸ナトリウム又は次亜塩素酸t-ブチルなどの試薬を伴う、XがSである対応する式Iのスルフィド化合物の酸化反応により入手され得る。酸化反応は、一般に、溶剤の存在下で実施される。反応において用いられる溶剤の例としては、ジクロロメタン及びクロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素；メタノール及びエタノールなどのアルコール；酢酸；水；並びにこれらの混合物が挙げられる。反応中において用いられる酸化剤の量は、一般に、スルホキシド化合物Iを生成するための1モルのスルフィド化合物Iを基準として1～3モル、好ましくは1～1.2モルであり、好ましくはスルホン化合物Iを生成するための1モルのスルフィド化合物Iを基準として2～2.2モルの酸化剤である。このような酸化反応は、例えば、国際公開第2013/018928号において開示されている。

30

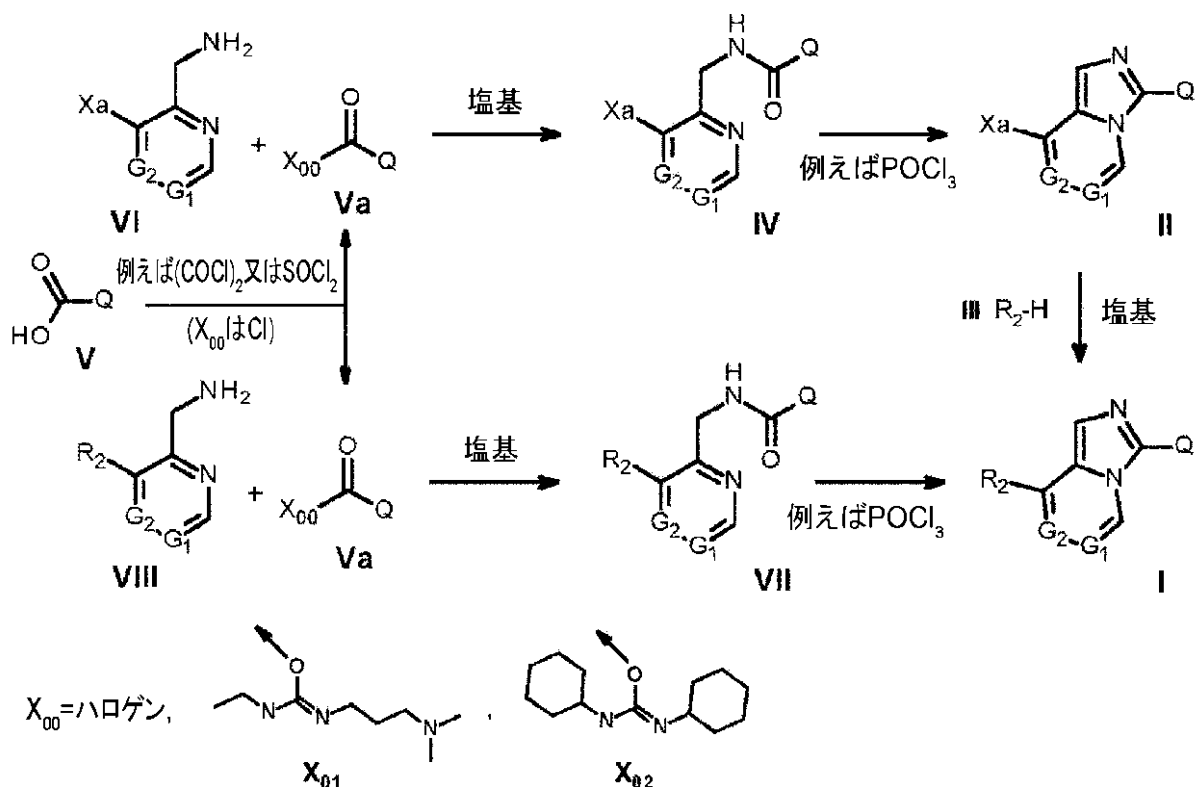
40

【0204】

G₁、G₂、R₂及びQが上記に定義されている式Iの化合物は、
スキーム1

50

【化 1 6】



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水素化ナトリウムなどの塩基の存在下、例えばテトラヒドロフラン、ジオキサン、N，N－ジメチルホルムアミド、N，N－ジメチルアセタミド又はアセトニトリルなどの適切な溶剤中、0～150℃の温度で任意にマイクロ波の照射下において、式II（式中、G₁、G₂及びQは、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xaは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくは塩素である）の化合物と、R₂が式Iに定義されているとおりである式IIIの化合物とを反応させることにより調製可能である（スキーム1）。

【0205】

式II（式中、G₁、G₂及びQは、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xaは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくは塩素である）の化合物は、式IV（式中、G₁、G₂及びQは、式Iにおいて定義されているとおりであり、ここで、Xaは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくは塩素である）の化合物を例えばオキシ塩化リンの存在下、任意にトルエン又はキシレンなどの溶剤又は希釈剤の存在下において、0～180℃、好ましくは20～120℃の温度で環化することにより調製可能である。代わりに、式IVの化合物の環化は、酢酸又はトリフルオロ酢酸中、0～180℃、好ましくは20～150℃の温度で任意にマイクロ波の照射下における加熱によって達成され得る。式IVの化合物の環化は、例えば、メタンスルホン酸又はpara－トルエンスルホン酸p-TsOHといった酸触媒の存在下、N－メチルピロリドン、トルエン又はキシレンなどの不活性溶剤中、25～180℃、好ましくは100～170℃の温度でも達成され得る。

【0206】

式IV（式中、G₁、G₂及びQは、式Iにおいて定義されているとおりであり、ここで、Xaは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくは塩素である）の化合物は、式VI（式中、G₁及びG₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xaは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくは塩素である）の化合物又はその塩（ハロゲン化水素酸塩など、好ましくは塩酸塩、若しくは臭化水素酸塩、若しくはトリフルオロ酢酸塩又はいずれかの他の均等な塩）と、式Va（

式中、Qは、式Iに定義されているとおりであり、ここで、X₀₀は、ハロゲン、好ましくは塩素であるか、又はX₀₀は、X₀₁若しくはX₀₂である）の化合物とをトリエチルアミン、N，N－ジイソプロピル－エチルアミン又はピリジンなどの塩基の存在下、任意に触媒（4－ジメチルアミノピリジンDMAPIなど）の存在下、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、N，N－ジメチル－ホルムアミド、N，N－ジメチルアセタミド、アセトニトリル、酢酸エチル又はトルエンなどの不活性溶剤中、0～50℃の温度で反応させることにより調製可能である。ピリジン及びトリエチルアミンなどの特定の塩基を塩基及び溶剤の両方として好適に採用し得る。

【0207】

Qが式Iに定義されているとおりである式Vaの化合物は、当業者に公知の方法、例えばTetrahedron, 2005, 61(46), 10827-10852に記載のものによる、Qが式Iに定義されているとおりである式Vの化合物の活性化により調製可能である。活性化種Va（式中、Qは、式Iに定義されているとおりであり、及びX₀₀は、ハロゲン、好ましくは塩素である）を形成することが好ましい。例えば、X₀₀がハロゲン、好ましくは塩素である化合物Vaは、触媒量のN，N－ジメチルホルムアミドDMFの存在下、塩化メチレンCH₂Cl₂又はテトラヒドロフランTHFなどの不活性溶剤中、20～100℃、好ましくは25℃の温度における、例えば塩化オキサリル(COCl)₂又は塩化チオニルSOCl₂によるVの処理によって形成される。代わりに、例えば、ピリジン又はテトラヒドロフランTHFなどの不活性溶剤中、任意にトリエチルアミンなどの塩基の存在下、50～180℃の温度における、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又はジシクロヘキシルカルボジイミドDCCによる式Vの化合物の処理で、X₀₀がそれぞれX₀₁又はX₀₂である活性化種Vaが生成される。

【0208】

代わりに、G₁、G₂、R₂及びQが上記に定義されている式Iの化合物は、G₁、G₂、R₂及びQが式Iに定義されているとおりである式VIIの化合物を例えばオキシ塩化リンの存在下において、上記において既述の条件下（化合物IVの化合物IIへの変換）で環化することにより調製され得る。

【0209】

G₁、G₂、R₂及びQが式Iに定義されているとおりである式VIIの化合物は、G₁、G₂及びR₂が式Iに定義されているとおりである式VIIの化合物又はその塩（ハロゲン化水素酸塩など、好ましくは塩酸塩、若しくは臭化水素酸塩、若しくはトリフルオロ酢酸塩又はいずれかの他の均等な塩）と、式Va（式中、Qは、式Iに定義されているとおりであり、ここで、X₀₀は、ハロゲン、好ましくは塩素であるか、又はX₀₀は、X₀₁若しくはX₀₂である）の化合物とを、上記において既述の条件下（化合物VI及びVaの化合物IVへの変換）で反応させることにより調製され得る。

【0210】

R₂が式Iに記載されているとおりである式IIIの化合物；及び式VI（式中、G₁及びG₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、X_aは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくは塩素である）の化合物又はその塩（ハロゲン化水素酸塩など、好ましくは塩酸塩、若しくは臭化水素酸塩、若しくはトリフルオロ酢酸塩又はいずれかの他の均等な塩）；及びQが式Iに定義されているとおりである式Vの化合物は、いずれも公知であり、市販されているか、又は当業者に公知の方法により調製され得る。

10

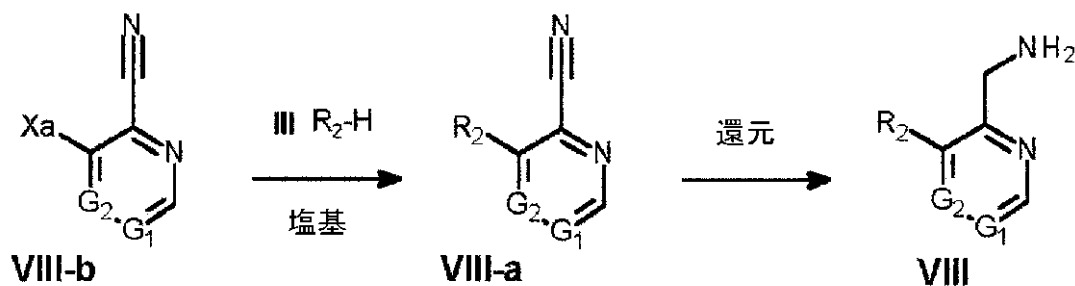
20

30

40

50

【化 1 7】



10

【0 2 1 1】

G₁、G₂及びR₂が式Iに定義されているとおりである式VIIの化合物又はその塩（ハロゲン化水素酸塩など、好ましくは塩酸塩、若しくは臭化水素酸塩、若しくはトリフルオロ酢酸塩又はいずれかの他の均等な塩）は、例えば、触媒水素化などの公知の条件下における、G₁、G₂及びR₂が式Iに定義されているとおりである式VII-aのニトリル化合物の還元により調製可能である。この還元のための触媒としては、ラネーニッケル、パラジウム黒色、パラジウム炭素又は二酸化白金などの金属が挙げられる。水素化条件は、大気圧又は高い水素圧の適用、メタノール又はエタノールなどの溶剤、室温～150℃の温度を含む。

20

【0 2 1 2】

G₁、G₂及びR₂が式Iに定義されているとおりである式VII-aの化合物は、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水素化ナトリウムなどの塩基の存在下、例えばテトラヒドロフラン、ジオキサン、N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルーアセトアミド又はアセトニトリルなどの適切な溶剤中、0～150℃の温度で任意にマイクロ波の照射下において、式VII-b（式中、G₁及びG₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xaは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくはフッ素又は塩素である）の化合物と、R₂が式Iに定義されているとおりである式Iの化合物とを反応させることにより調製可能である。

30

【0 2 1 3】

式VII-b（式中、G₁及びG₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xaは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくはフッ素又は塩素である）の化合物は、いずれも公知であり、市販されているか、又は当業者に公知の方法により調製され得る。

【0 2 1 4】

式I（式中、G₁、G₂及びR₂は、上記に定義されているとおりであり、及びQは、Qbと定義され、ここで、A、Q₁、R₃、X及びR₁は、式Iに定義されているとおりである）の化合物のサブグループは、式I-Qbの化合物（スキーム2）と定義され得る。

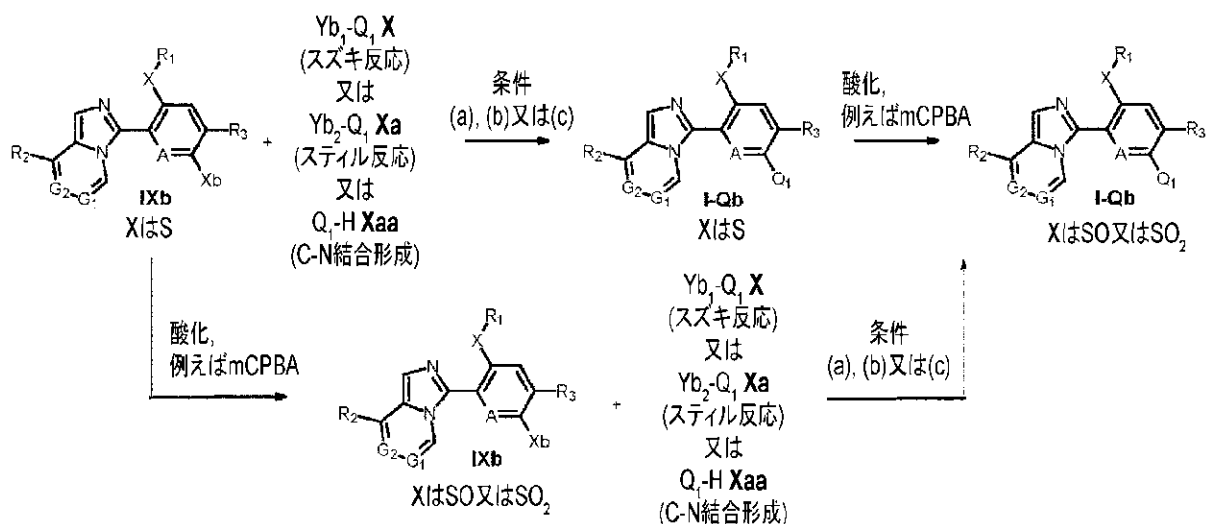
【0 2 1 5】

スキーム2

40

50

【化 18】



10

(a) スズキ反応: Pd 触媒 (例えば、Pd (PPh₃)₄ 又は Pd (dppf) Cl₂)、塩基 (例えば、Na₂CO₃)、溶剤 (例えば、1, 2-ジメトキシエタン/水)、25~180℃。

(b) スティール反応: Pd 触媒 (例えば、Pd (PPh₃)₄ 又は Pd (PPh₃) Cl₂)、溶剤 (例えば、トルエン)、25~180℃。

20

(c) C-N 結合形成: 任意の塩基 (例えば、K₂CO₃ 又は Cs₂CO₃)、任意に銅又はパラジウム触媒の存在下、任意の添加剤 (N, N'-ジメチルエチレンジアミンなど)、任意のリガンド (キサントホスなど)、溶剤 (例えば、ジオキサン、ピリジン又は N, N-ジメチルホルムアミド DMF)、25~180℃。

【0216】

スキーム 2 中の特定の状況において、Q₁が、任意に、環窒素原子を介して、基 A を含有する環に結合されている置換トリアゾールである場合、X が SO 又は SO₂ である式 I-Qb の化合物は、式 I-Xb (式中、A、R₃、R₁、G₁、G₂ 及び R₂ は、式 I に定義されているとおりであり、ここで、X は、SO 又は SO₂ であり、Xb は、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素 (好ましくは塩素若しくは臭素) のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアールー若しくはアルキルスルホネートである) の化合物から、アルコール (例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール又は高沸点直鎖若しくは分岐鎖アルコール)、ジメチルホルムアミド、ピリジン又は酢酸などの溶剤中、任意に水素化ナトリウム、炭酸カリウム K₂CO₃ 又は炭酸セシウム Cs₂CO₃ などの追加の塩基の存在下、任意に例えばヨウ化銅 (I) といった銅触媒の存在下、30~180℃ の温度で任意にマイクロ波の照射下における、Q₁が N 結合トリアゾリルである、任意に置換されていてもよいトリアゾール Q₁-H (これは、適切な NH 官能基を含有する) (Xaa) との反応 (C-N 結合形成) により調製され得る。

30

【0217】

スキーム 2 中の特定の状況において、Q₁が、R₄ 及び R₅ が式 I に定義されているとおりである -N(R₄)COR₅ 又は -N(R₄)CON(R₄)₂ である場合、X が SO 又は SO₂ である式 I-Qb の化合物は、式 I-Xb (式中、A、R₃、R₁、G₁、G₂ 及び R₂ は、式 I に定義されているとおりであり、ここで、X は、SO 又は SO₂ であり、Xb は、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素 (好ましくは塩素若しくは臭素) のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアールー若しくはアルキルスルホネートである) の化合物から、HN(R₄)COR₅ 又は HN(R₄)CON(R₄)₂ (式中、R₄ 及び R₅ は、式 I に定義されているとおりである) に対する均等物である試薬 Q₁-H (Xaa) との反応 (C-N 結合形成) により調製され得る。このような反応は、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウムなどの塩基の存在下、トルエン、ジメチルホルム

40

50

アミドDMF、N-メチルピロリジンNMP、ジメチルスルホキシドDMSO、ジオキサン、テトラヒドロフランTHF等などの不活性溶剤中、任意に例えば酢酸パラジウム(I I)、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0) ($\text{Pd}(\text{dba})_2$) 若しくはトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0) ($\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ 、任意にクロロホルム付加物の形態)又は例えば $t\text{-BuBrettPhos Pd G3}$ [(2-ジ- t -ブチルホスフィノ-3, 6-ジメトキシ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル)-2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム(I I)メタンスルホン酸若しくは BrettPhos Pd G3 [(2-ジ-シクロヘキシルホスフィノ-3, 6-ジメトキシ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル)-2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム(I I)メタンスルホン酸などのパラジウムプレ触媒といった触媒の存在下及び任意に例えば SPhos 、 $t\text{-BuBrettPhos}$ 又はキサントホスといったリガンドの存在下、60~180℃の温度で任意にマイクロ波の照射下において行われる。

【0218】

スキーム2中の特定の状況において、 Q_1 が、 R_4 が式Iに定義されているとおりである-N(R_4)₂である場合、XがSO又はSO₂である式I-Qbの化合物は、式IXb (式中、A、 R_3 、 R_1 、 G_1 、 G_2 及び R_2 は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、SO又はSO₂であり、Xbは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素(好ましくは塩素若しくは臭素)のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-若しくはアルキルスルホネートである)の化合物から、HN(R_4)₂に対する均等物である試薬 $\text{Q}_1\text{-H}(\text{Xaa})$ (式中、 R_4 は、式Iに定義されているとおりである)又はその塩(ハロゲン化水素酸塩など、好ましくは塩酸塩、若しくは臭化水素酸塩、若しくはトリフルオロ酢酸塩又はいずれかの他の均等な塩)を伴う反応(C-N結合形成)により調製され得る。このような反応は、通常、アルコール、アミド、エステル、エーテル、ニトリル及び水などの不活性溶剤、特に好ましくはメタノール、エタノール、2, 2, 2-トリフルオロエタノール、プロパノール、イソプロパノール、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセタミド、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、アセトニトリル、酢酸エチル、トルエン、水又はこれらの混合物といった不活性溶剤中、0~150℃の温度において、任意にマイクロ波の照射下又はオートクレーブを用いた加圧条件下、任意に銅粉末、ヨウ化銅(I)若しくは硫酸銅(任意に水和物の形態)などの銅触媒又はこれらの混合物の存在下、任意に例えばジアミンリガンド(例えば、N, N'-ジメチルエチレンジアミン若しくはトランス-シクロヘキシルジアミン)、又はジベンジリデンアセトン(dba)、又は1, 10-フェナントロリンといったリガンドの存在下及び任意にリン酸カリウムなどの塩基の存在下で行われる。

【0219】

試薬HN(R_4)₂、HN(R_4)COR₅又はHN(R_4)CON(R_4)₂ (式中、 R_4 及び R_5 は、式Iに定義されているとおりである)は、いずれも公知であり、市販されているか、又は当業者に公知の方法により調製され得る。

【0220】

代わりに、XがSO又はSO₂である式I-Qbの化合物は、式IXb (式中、A、 R_3 、 R_1 、 G_1 、 G_2 及び R_2 は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、SO又はSO₂であり、Xbは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素(好ましくは塩素若しくは臭素)のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-若しくはアルキルスルホネートである)の化合物と、式(X) (式中、 Q_1 は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、 Y_{b1} は、例えば、B(OH)₂又はB(OR_{b1})₂などのホウ素由来官能基であり得、 R_{b1} は、C₁~C₄アルキル基であり得るか、又は2つの基OR_{b1}は、ホウ素原子と一緒にあって、例えばボロン酸ピナコールエステルとしての5員環を形成することが可能である)の化合物との反応を例えば伴うスズキ反応(スキーム2)によって調製され得る。この反応は、炭酸ナトリウム、リン酸三カリウム又はフッ化セシウムのような塩基の存在下、例えばトルエン、ジオキサン、アセトニトリル、N, N-

ジメチルホルムアミド、1, 2-ジメトキシエタン及び水の混合物、若しくはジオキサン／水の混合物、若しくはトルエン／水の混合物といった溶剤又は溶剤混合物中において、好ましくは不活性雰囲気例えばテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）、（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-ジクロロメタン（1:1錯体）又はクロロ（2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-ビフェニル）[2-（2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル）]パラジウム（II）（XPhosパラダサイクル）といったパラジウム系触媒により触媒され得る。反応温度は、好ましくは、室温から反応混合物の沸点の範囲であり得るか、又はこの反応は、マイクロ波の照射下で行われ得る。このようなスズキ反応は、当業者に周知であり、且つ例えばJ. Org. Chem. 576, 1999, 147-168においてレビューされている。

10

【0221】

代わりに、XがSO又はSO₂である式I-Qbの化合物は、式(Xa)（式中、Q₁は、上記に定義されているとおりであり、ここで、Y_{b2}は、トリアルキルスズ誘導体、好ましくはトリ-n-ブチルスズ又はトリメチルスズである）の化合物と、式IXb（式中、A、R₃、R₁、G₁、G₂及びR₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、SO又はSO₂であり、Xbは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリアル-若しくはアルキルスルホネートである）の化合物とのスティール反応により調製され得る。このようなスティール反応は、通常、例えばテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）又はビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（II）ジクロリドといったパラジウム触媒の存在下、N, N-ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、トルエン又はジオキサンなどの不活性溶剤中、任意にフッ化セシウム又は塩化リチウム添加剤の存在下及び任意に例えばヨウ化銅（I）といったさらなる触媒の存在下で実施される。反応温度は、好ましくは、室温から反応混合物の沸点の範囲であり得るか、又はこの反応は、マイクロ波の照射下で行われ得る。このようなスティールカップリングも当業者に周知であり、且つ例えばJ. Org. Chem., 2005, 70, 8601-8604、J. Org. Chem., 2009, 74, 5599-5602及びAngew. Chem. Int. Ed., 2004, 43, 1132-1136において記載されている。

20

【0222】

Q₁が、環窒素原子を介して、置換基Aを含有する環に結合されている5員芳香族環系である場合、XがSO又はSO₂である式I-Qbの化合物は、式IXb（式中、A、R₃、R₁、G₁、G₂及びR₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、SO又はSO₂であり、Xbは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリアル-若しくはアルキルスルホネートである）の化合物から、炭酸カリウムK₂CO₃又は炭酸セシウムCs₂CO₃などの塩基の存在下、任意に例えばヨウ化銅（I）といった銅触媒の存在下、L-プロライン、N, N'-ジメチルシクロヘキサン-1, 2-ジアミン又はN, N'-ジメチル-エチレンジアミンなどの添加剤を伴って又は伴わずに、N-メチルピロリドンNMP又はN, N-ジメチルホルムアミドDMFなどの不活性溶剤中、30~150℃の温度で任意にマイクロ波の照射下における、Q₁が上記に定義されている複素環Q₁-H（これは、適切なNH官能基を含有する）（Xaa）を伴う反応により調製され得る。

30

40

【0223】

好適な酸化剤によるXがSO又はSO₂である式IXbの化合物への式IXb（式中、A、R₃、R₁、G₁、G₂及びR₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、S（スルフィド）であり、Xbは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリアル-若しくはアルキルスルホネートである）の化合物の酸化は、上記において既述の条件下で達成され得る。

【0224】

50

多数の式 (X)、(Xa) 及び (Xaa) の化合物は、市販されているか、又は当業者により調製可能である。

【0225】

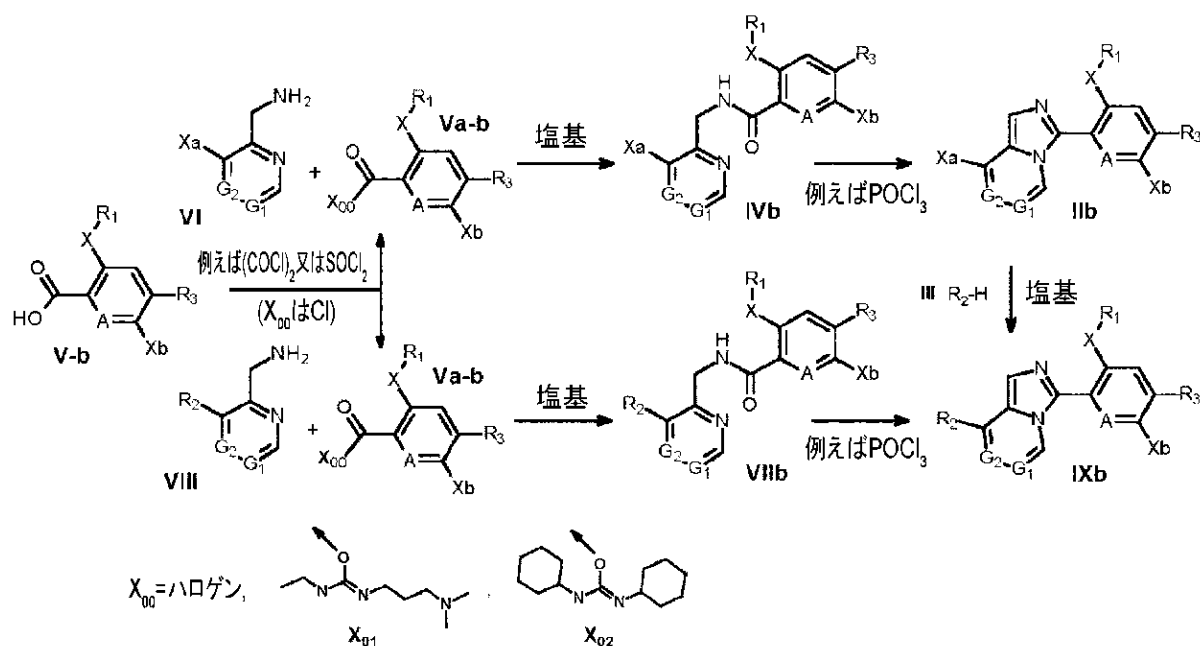
代わりに、XがSO又はSO₂である式I-Qbの化合物は、XがS（スルフィド）である式IXbの化合物から、上記のものと同一化学反応を伴うが、ステップの順番を変更することにより（すなわちスズキ、スティル又はC-N結合形成により、IXb（Xは、Sである）からI-Qb（Xは、Sである）へのシーケンスを実施し、これに続いてI-Qb（Xは、SO又はSO₂である）を形成する酸化ステップを実施することにより）調製され得る。

【0226】

式IXb（式中、A、R₃、R₁、G₁、G₂及びR₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、S（スルフィド）であり、Xbは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-若しくはアルキルスルホネートである）の化合物

スキーム3

【化19】



は、式IIb（式中、A、R₃、R₁、G₁及びG₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、S（スルフィド）であり、Xbは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-若しくはアルキルスルホネートであり、Xaは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくは塩素である）の化合物と、R₂が式Iに定義されているとおりである式IIIの化合物とを、上記において既述の条件下（化合物IIのスキーム1中の化合物Iへの変換）で反応させることにより調製可能である（スキーム3）。

【0227】

式IIb（式中、A、R₃、R₁、G₁及びG₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、S（スルフィド）であり、Xbは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しくは臭素）のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-若しくはアルキルスルホネートであり、Xaは、ハロゲン（又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基）、好ましくは塩素である）の化合物は、式IVb（式中、A、R₃、R₁、G₁及びG₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、S（スルフィド）であり、Xbは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは塩素若しく

は臭素)のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリールー若しくはアルキルスルホネートであり、X aは、ハロゲン(又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基)、好ましくは塩素である)の化合物を、上記において既述の条件下(化合物I Vのスキーム1中の化合物I Iへの変換)で環化させることにより調製可能である。

【0228】

式I V b(式中、A、R₃、R₁、G₁及びG₂は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、S(スルフィド)であり、X bは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素(好ましくは塩素若しくは臭素)のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリールー若しくはアルキルスルホネートであり、ここで、X aは、ハロゲン(又はトリフレートなどの擬ハロゲン脱離基)、好ましくは塩素である)の化合物又はその塩(ハロゲン化水素酸塩など、好ましくは塩酸塩、若しくは臭化水素酸塩、若しくはトリフルオロ酢酸塩又はいずれかの他の均等な塩)と、式V a-b(式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、S(スルフィド)であり、X bは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素(好ましくは塩素若しくは臭素)のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリールー若しくはアルキルスルホネートであり、X₀₀は、ハロゲン、好ましくは塩素であるか、又はX₀₀は、X₀₁若しくはX₀₂である)の化合物とを、上記において既述の条件下(スキーム1中の化合物I Vへの化合物V I及び化合物V aの変換)で反応させることにより調製可能である。

10

20

【0229】

置換基A、R₃、R₁、X、X b及びX₀₀が上記に定義されているとおりである式V a-bの化合物は、上記において既述の条件下(化合物Vのスキーム1中の化合物V aへの変換)における置換基A、R₃、R₁、X及びX bが上記に定義されている式V-bの化合物の活性化により調製可能である。

【0230】

置換基A、R₃、R₁、X及びX bが上記に定義されているとおりである式V-bの化合物は、いずれも公知であり、市販されているか、又は当業者に公知の方法により調製され得る。

【0231】

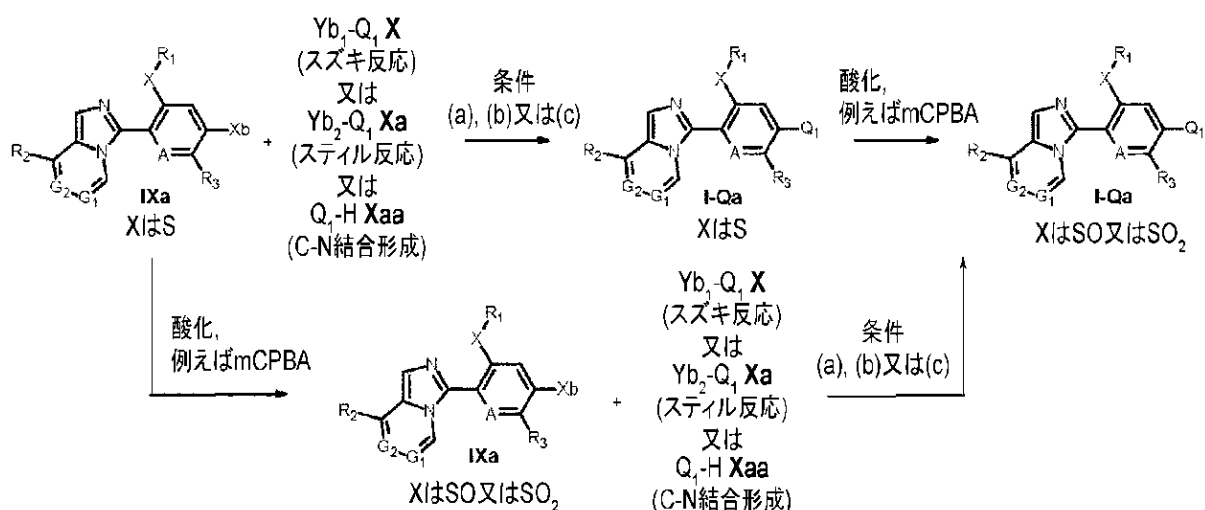
式I(式中、G₁、G₂及びR₂は、上記に定義されているとおりであり、ここで、Qは、Q aと定義され、A、Q₁、R₃、X及びR₁は、式Iに定義されているとおりである)の化合物のサブグループは、式I-Q aの化合物と定義され得る(スキーム4)。

30

【0232】

スキーム4

【化20】



40

50

(a) スズキ反応：Pd 触媒（例えば、Pd(PPh₃)₄又はPd(dppf)Cl₂）、塩基（例えば、Na₂CO₃）、溶剤（例えば、1,2-ジメトキシエタン／水）、25～180℃。

(b) スティル反応：Pd 触媒（例えば、Pd(PPh₃)₄又はPd(PPh₃)Cl₂）、溶剤（例えば、トルエン）、25～180℃。

(c) C-N結合形成：任意の塩基（例えば、K₂CO₃又はCs₂CO₃）、任意に銅又はパラジウム触媒の存在下、任意の添加剤（N,N'-ジメチルエチレンジアミンなど）、任意のリガンド（キサントホスなど）、溶剤（例えば、ジオキサン、ピリジン又はN,N-ジメチルホルムアミドDMF）、25～180℃。

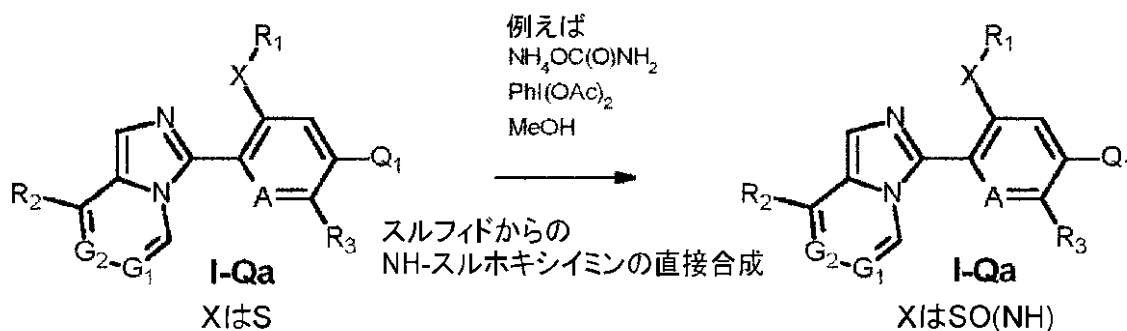
【0233】

式IXbの化合物から式I-Qbの化合物を得るためのスキーム2における既述の化学反応は、式IXaの化合物からの式I-Qaの化合物の調製に同様に適用可能であり（スキーム4）、ここで、既述のすべての置換基の定義は、有効なままである。

【0234】

式I-Qa（式中、A、Q₁、R₃、G₁、G₂、R₂及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、SO(NH)である）の化合物のサブグループ

【化21】



は、式I-Qa（式中、A、Q₁、R₃、G₁、G₂、R₂及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、Xは、Sである）のスルフィド化合物と、例えばアンモニア、アンモニウムカルバメート又は酢酸アンモニウム（好ましくはアンモニウムカルバメートなどの好適な窒素源とをジアセトキシヨードベンゼンなどの超原子価ヨウ素試薬の存在下、トルエン、アセトニトリル又はメタノールなどの溶剤中、0～100℃の温度、好ましくは約室温において、例えばChem. Commun. 53, 348-351; 2017（及びその中で引用されている文献）に見出される記載と同様に反応させることにより調製可能である。

【0235】

式V-bの化合物から式IXbの化合物を得るためのスキーム3における既述の化学反応は、式V-aの化合物からの式IXaの化合物の調製に同様に適用可能であり（スキーム5）、ここで、既述のすべての置換基の定義は、有効なままである。

【0236】

スキーム5

10

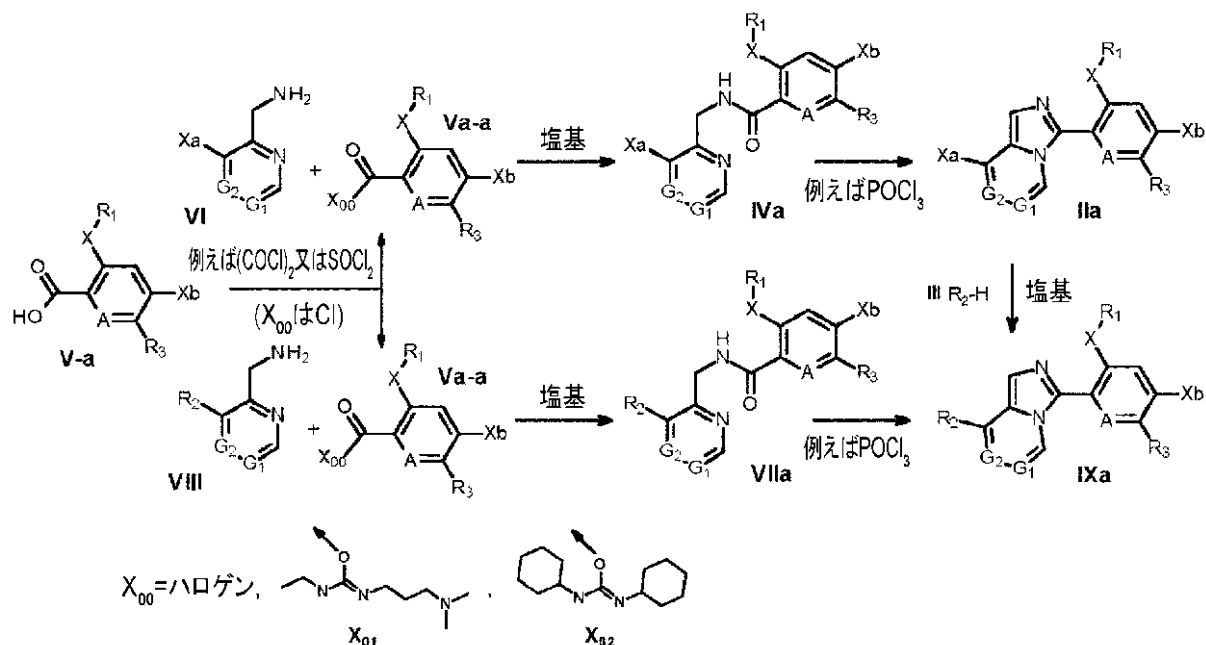
20

30

40

50

【化 2 2】



10

置換基 A、R₃、R₁、X 及び X_b が上記に定義されているとおりである式 V-a の化合物は、いずれも公知であり、市販されているか、又は当業者に公知の方法により調製され得る。

20

【0237】

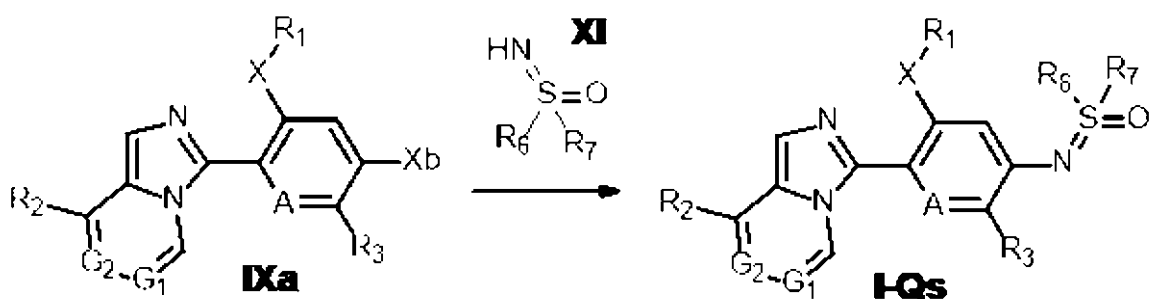
式 I (式中、G₁、G₂ 及び R₂ は、上記に定義されているとおりであり、ここで、Q は、Q_a と定義され、A、R₃、X 及び R₁ は、式 I に定義されているとおりであり、Q₁ は、-N=S(O)R₆R₇ であり、R₆ 及び R₇ は、相互に独立して、C₁~C₆ アルキル又は C₃~C₆ シクロアルキルである) の化合物のサブグループは、式 I-Q_s の化合物と定義され得る (スキーム 6)。

【0238】

スキーム 6

30

【化 2 3】



40

このような式 I-Q_s の化合物は、式 I X_a (式中、X、A、R₃、R₁、G₁、G₂ 及び R₂ は、式 I に定義されているとおりであり、ここで、X_b は、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素 (好ましくは塩素若しくは臭素) のような脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール-若しくはアルキルスルホネートである) の化合物と、R₆ 及び R₇ が式 I に定義されているとおりである式 XI の HN=S(O)R₆R₇ の試薬とを反応させることにより調製可能である (スキーム 6)。この反応は、例えば、ビス (ジベンジリデンアセトン) パラジウム (0) (Pd(dba)₂)、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) (Pd₂(dba)₃; 任意にそのクロロホルム付加物の形態) 又は酢酸パラジウム (II) を含むパラジウム系触媒及び例えばキサントホス ((5-

50

ジフェニルホスファニル-9,9-ジメチル-キサンテン-4-イル)ジフェニルホスファン)、RuPhos(2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2',6'-ジイソプロポキシビフェニル)、JohnPhos([1,1'-ビフェニル]-2-イルビス(1,1'-ジメチル-エチル)ホスフィン)、BINAP(2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフタレン)、tol-BINAP([2,2'-ビス(ジ-p-トリル-ホスフィノ)-1,1'-ビナフチル])又はトリ-(o-トリル)ホスフィンといったリガンドにより、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム、又はナトリウム、又はカリウムt-ブチレートのような塩基の存在下、例えばジオキサン、1,2-ジメトキシエタン又はトルエンといった溶剤又は溶剤混合物中、好ましくは不活性雰囲気下で触媒され得る。反応温度は、好ましくは、室温から反応混合物の沸点の範囲であり得るか、又はこの反応は、マイクロ波の照射下で行われ得る。このような反応及び代替的な条件(例えば、鉄又は銅触媒)は、例えば、国際公開第18/099812号に記載されている。

10

【0239】

R₆及びR₇が式Iに定義されているとおりである式XIの化合物は、公知の化合物であり、市販されているか、又は例えば国際公開第18/099812号、Journal of the Chemical Society, 3004-5; 1965又はe-E ROS Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis, 1-8; 2013といった文献に記載されている公知の方法により調製可能である。

20

【0240】

式V(式中、Qは、Q_aとして定義されており、ここで、Xは、Sであり、及びA、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、Q₁は、シアノイソプロポキシである)の化合物のサブグループは、式V-5の化合物と定義され得る(スキーム7)。

【0241】

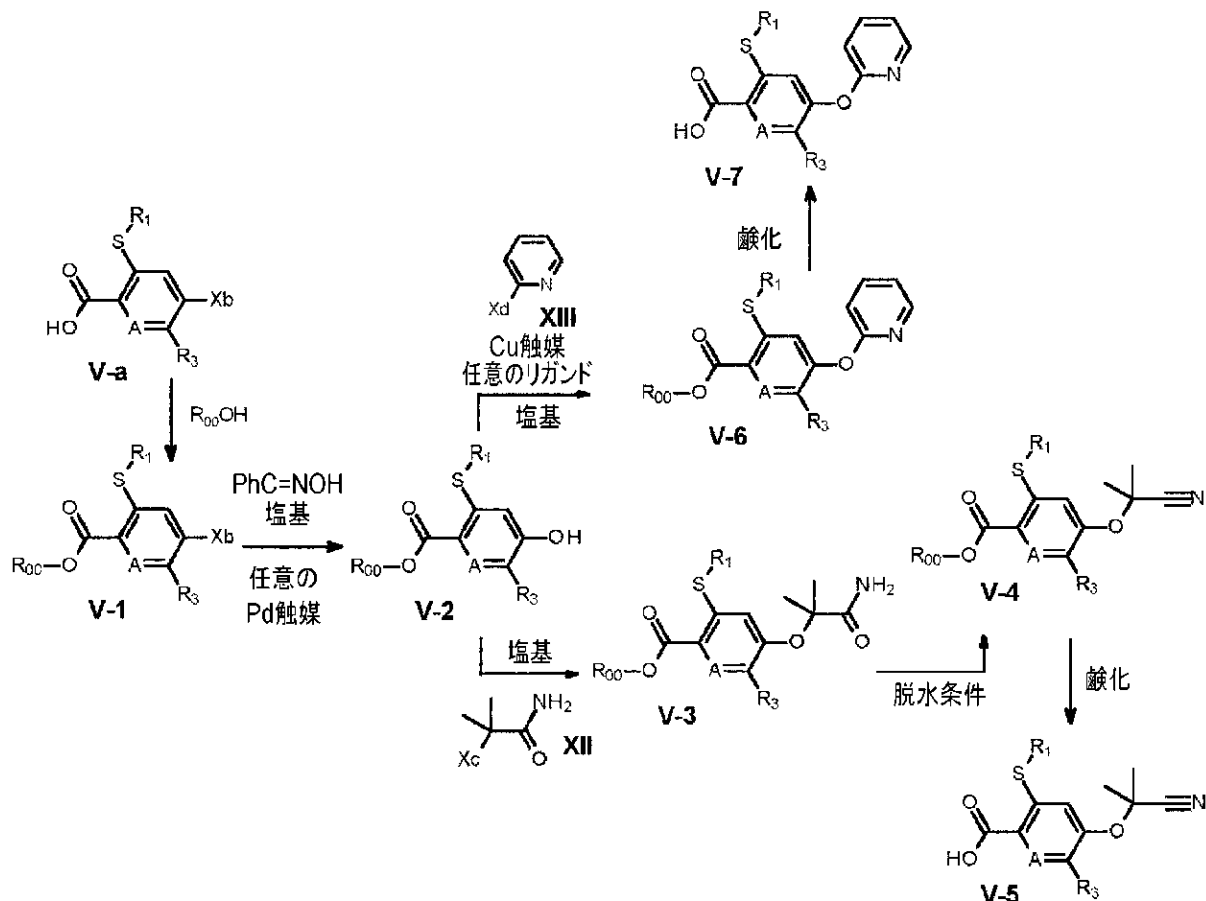
スキーム7

30

40

50

【化 2 4】



10

20

30

40

50

A、R₃及びR₁が式Iに定義されているとおりである式V-5の化合物は、当業者に公知の条件下（例えば、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン又はジオキサン中の水性水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又は水酸化リチウム、室温において又は還元条件以下などの条件を用いる）における、式V-4（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルである）の化合物の鹼化により調製可能である（スキーム7）。

【0242】

式V-4（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルである）の化合物は、式V-3（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルである）の化合物と、トリフルオロ酢酸、トリフルオロ酢酸無水物、五酸化リン、塩化チオニル又はオキシ塩化リンなどの脱水剤とを任意にトリエチルアミン又はピリジンなどの塩基の存在下、例えばジクロロメタン、ジオキサン又はN，N-ジメチルホルムアミドなどの適切な溶剤中、0℃～180℃、好ましくは5℃～80℃の温度において、例えば米国特許出願公開第20100267738号明細書に記載されているとおり脱水条件で反応させることにより調製可能である。

【0243】

式V-3（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルである）の化合物は、式V-2（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルである）の化合物と、式XII（式中、Xcは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは臭素）などの脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール、アルキル若しくはハロアルキルスルホネートである）の化合物とを例えば水酸化リチウム、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基

の存在下、アセトン、ジオキサン、アセトニトリル、N，N－ジメチルホルムアミド又はN，N－ジメチルアセタミドなどの好適な溶剤中、－10℃～100℃、好ましくは0℃～80℃の温度において、例えば国際公開第2014071044号に記載されているとおり反応させることにより調製可能である。

【0244】

式V－2（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルである）の化合物は、式V－1（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルであり、及びX_bは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは臭素）などの脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール、アルキル若しくはハロアルキルスルホネートである）の化合物と、例えばベンズアルドキシムPhC＝NOH、好ましくは（E）－ベンズアルデヒドオキシムとを炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下、任意にRockPhos－G3－パラダサイクル（〔（2－ジ－テ－ブチルホスフィノ－3－メトキシ－6－メチル－2’，4’，6’－トリイソプロピル－1，1’－ビフェニル）－2－（2－アミノビフェニル）〕パラジウム（II）メタンスルホン酸）などのパラジウム触媒の存在下、アセトニトリル又はN，N－ジメチルホルムアミドDMFなどの非プロトン性溶剤中、0～100℃、好ましくは室温～80℃の温度において、例えばAngew．Chem．Int．Ed．56（16），4478－4482，2017に記載されているとおり反応させることにより調製可能である。

【0245】

式V－1（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルであり、及びX_bは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは臭素）などの脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール、アルキル若しくはハロアルキルスルホネートである）の化合物、特にX_bが臭素又はヨウ素であるこれらの化合物は、公知の化合物であり、市販されているか、又は例えば国際公開第2016／005263号、国際公開第2016／023954号、国際公開第2016／026848号及び国際公開第2016／104746号といった文献に記載されている公知の方法により調製され得る。特に、式V－1の化合物は、当業者に公知である標準状態における、式R₀₀OHのアルコールによる上記において本明細書に記載の式V－aの化合物のエステル化により調製され得る。

【0246】

式V（式中、Qは、Q_aと定義され、ここで、Xは、Sであり、及びA、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、Q₁は、2－ピリジルオキシである）の化合物のサブグループは、式V－7の化合物と定義され得る（スキーム7）。

【0247】

A、R₃及びR₁が式Iに定義されているとおりである式V－7の化合物は、当業者に公知である条件下（例えば、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン又はジオキサン中の水性水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又は水酸化リチウム、室温において又は還元条件以下などの条件を用いる）における、式V－6（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルである）の化合物の酸化により調製可能である（スキーム7）。

【0248】

式V－6（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルである）の化合物は、式V－2（式中、A、R₃及びR₁は、式Iに定義されているとおりであり、ここで、R₀₀は、C₁～C₆アルキルである）の化合物と、式XIII（式中、X_dは、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素（好ましくは臭素若しくはヨウ素）などの脱離基又はトリフルオロメタンスルホン酸などのアリール、アルキル若しくはハロアルキルスルホネートである）の化合物とを例えば水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下、ジオキサン、アセトニトリル、N，N－ジメチルホルムアミド又はN，N－ジメチルアセタミドなどの好適な溶剤中、

例えばヨウ化銅（Ⅰ）といった銅触媒の存在下、任意に追加のリガンドの存在下、 20°C ～ 200°C の温度、好ましくは室温から反応混合物の沸点の範囲の温度において、任意にマイクロ波の照射下で反応させることにより調製可能である。

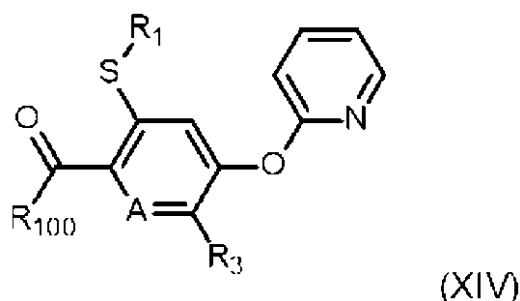
【0249】

式XⅠⅠ及びXⅠⅠⅠの化合物（置換基は、上記に定義されているとおりである）は公知の化合物であり、市販されているか、又は公知の方法により調製可能である。

【0250】

式XⅠⅤ

【化25】



10

（式中、

20

R_1 、 R_3 及びAは、上記の式Ⅰに定義されているとおりであり、及び R_{100} は、OH、クロロ又は $C_1\sim C_4$ アルコキシである）

の化合物は、新規であり、特に本発明に係る式Ⅰの化合物の調製のために開発されたものであり、従って本発明のさらなる目的を表す。式Ⅰの化合物の置換基の好ましさ及び好ましい実施形態も式XⅠⅤの化合物に関して有効である。

【0251】

反応剤は、塩基の存在下で反応され得る。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-7-エン（DBU）である。

30

40

【0252】

反応剤は、そのまま、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。しかしながら、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。

【0253】

反応は、約 -80°C ～約 $+140^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは約 -30°C ～約 $+100^{\circ}\text{C}$ の温度範囲、

50

多くの場合、周囲温度から約 + 8 0 °C の範囲で行われるのが有利である。

【0254】

従来の方法において、本発明に係る他の置換基によって式 I の出発化合物の 1 つ以上の置換基を置換することにより、且つ酸化、アルキル化、還元、アシル化などの反応及び当業者に公知である他の方法による化合物の後変性により、式 I の化合物は、それ自体公知である様式で他の式 I の化合物に転換可能である。

【0255】

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、又は複数の置換基が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。

10

【0256】

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が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、塩基による塩が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。

【0257】

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り、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り、塩基による塩に慣例的な方法で転化され得る。

【0258】

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 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。

20

【0259】

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。

【0260】

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、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又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若しく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。

30

【0261】

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。

40

【0262】

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、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 (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、酒石酸若しく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

50

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って光学対掌体に分解され得る。

【0263】

純粋なジアステレオマー又は鏡像異性体は、本発明に従って、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によっても、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も得られる。

【0264】

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H₂O₂/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。

【0265】

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、例えば鏡像異性体若しく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。

【0266】

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、必要に応じて水和物の形態で得ることもでき、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。

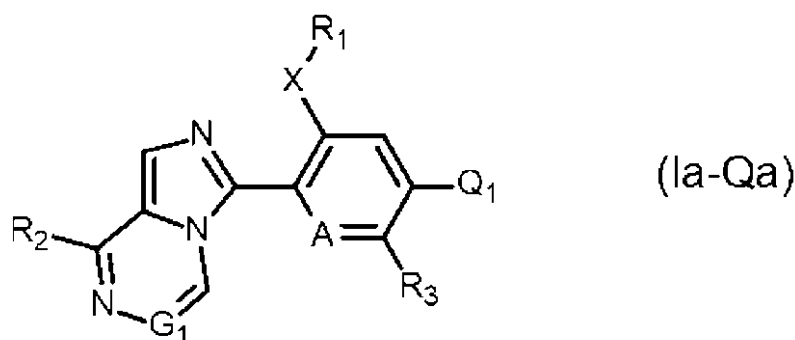
【0267】

以下の表A-1～A-93、AA-1～AA-81、AB-1～AB-93及びAC-1～AC-81並びに表B-1～B-66、BB-1～BB-54、BC-1～BC-66及びBD-1～BD-54に係る化合物は、上記の方法に従って調製可能である。以下の例は、本発明を例示することを意図したものであり、好ましい式Iの化合物を示す。

【0268】

以下のA-1～A-93及びAA-1～AA-81は、本発明の特定の化合物を示す。

【化26】



【0269】

10

20

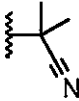
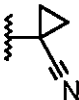
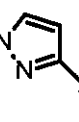
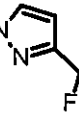
30

40

50

【表 1】

表Y Q₁の置換基定義:

インデックス	Q ₁	インデックス	Q ₁
1	H	12	
2	-N(CH ₃)COCH ₂ CH ₃	13	
3	Cl	14	
4	Br	15	-OCH ₂ CF ₃
5	- N(CH ₃)COcycloC3	16	
6	CF ₃	17	
7	-NH ₂	18	
8	-NH(CH ₃)	19	
9	-N(CH ₃) ₂	20	
10	-NHCOCH ₃	21	-N=S(O)(CH ₃) ₂
11	-N(CH ₃)COCH ₃	22	

10

20

30

40

50

【0270】

表Y並びに表A及びAAにおいて、「シクロC3」は、シクロプロピルを表す。

【0271】

表A-1は、22種の式Ia-Qaの化合物A-1.001~A-1.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0272】

表A-2は、22種の式Ia-Qaの化合物A-2.001~A-2.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義

されているとおりである。

【0273】

表A-3は、22種の式Ia-Qaの化合物A-3.001~A-3.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0274】

表A-4は、22種の式Ia-Qaの化合物A-4.001~A-4.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0275】

表A-5は、22種の式Ia-Qaの化合物A-5.001~A-5.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0276】

表A-6は、22種の式Ia-Qaの化合物A-6.001~A-6.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0277】

表A-7は、22種の式Ia-Qaの化合物A-7.001~A-7.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0278】

表A-8は、22種の式Ia-Qaの化合物A-8.001~A-8.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0279】

表A-9は、22種の式Ia-Qaの化合物A-9.001~A-9.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0280】

表A-10は、22種の式Ia-Qaの化合物A-10.001~A-10.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0281】

表A-11は、22種の式Ia-Qaの化合物A-11.001~A-11.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0282】

表A-12は、22種の式Ia-Qaの化合物A-12.001~A-12.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定

50

義されているとおりである。

【0283】

表A-13は、22種の式Ia-Qaの化合物A-13.001~A-13.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0284】

表A-14は、22種の式Ia-Qaの化合物A-14.001~A-14.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0285】

表A-15は、22種の式Ia-Qaの化合物A-15.001~A-15.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0286】

表A-16は、22種の式Ia-Qaの化合物A-16.001~A-16.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0287】

表A-17は、22種の式Ia-Qaの化合物A-17.001~A-17.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0288】

表A-18は、22種の式Ia-Qaの化合物A-18.001~A-18.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0289】

表A-19は、22種の式Ia-Qaの化合物A-19.001~A-19.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0290】

表A-20は、22種の式Ia-Qaの化合物A-20.001~A-20.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0291】

表A-21は、22種の式Ia-Qaの化合物A-21.001~A-21.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0292】

表A-22は、22種の式Ia-Qaの化合物A-22.001~A-22.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表

50

Yに定義されているとおりである。

【0293】

表A-23は、22種の式Ia-Qaの化合物A-23.001~A-23.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0294】

表A-24は、22種の式Ia-Qaの化合物A-24.001~A-24.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0295】

表A-25は、22種の式Ia-Qaの化合物A-25.001~A-25.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0296】

表A-26は、22種の式Ia-Qaの化合物A-26.001~A-26.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0297】

表A-27は、22種の式Ia-Qaの化合物A-27.001~A-27.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0298】

表A-28は、22種の式Ia-Qaの化合物A-28.001~A-28.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0299】

表A-29は、22種の式Ia-Qaの化合物A-29.001~A-29.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0300】

表A-30は、22種の式Ia-Qaの化合物A-30.001~A-30.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0301】

表A-31は、22種の式Ia-Qaの化合物A-31.001~A-31.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0302】

表A-32は、22種の式Ia-Qaの化合物A-32.001~A-32.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁

50

は表 Y に定義されているとおりである。

【0303】

表 A-33 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-33.001~A-33.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0304】

表 A-34 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-34.001~A-34.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0305】

表 A-35 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-35.001~A-35.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0306】

表 A-36 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-36.001~A-36.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0307】

表 A-37 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-37.001~A-37.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0308】

表 A-38 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-38.001~A-38.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0309】

表 A-39 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-39.001~A-39.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0310】

表 A-40 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-40.001~A-40.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0311】

表 A-41 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-41.001~A-41.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0312】

表 A-42 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-42.001~A-42.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁

50

は表 Y に定義されているとおりである。

【0313】

表 A-43 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-43.001~A-43.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0314】

表 A-44 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-44.001~A-44.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0315】

表 A-45 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-45.001~A-45.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0316】

表 A-46 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-46.001~A-46.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0317】

表 A-47 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-47.001~A-47.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0318】

表 A-48 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-48.001~A-48.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0319】

表 A-49 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-49.001~A-49.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0320】

表 A-50 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-50.001~A-50.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0321】

表 A-51 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-51.001~A-51.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0322】

表 A-52 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-52.001~A-52.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義

50

されているとおりである。

【0323】

表A-53は、22種の式Ia-Qaの化合物A-53.001~A-53.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0324】

表A-54は、22種の式Ia-Qaの化合物A-54.001~A-54.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0325】

表A-55は、22種の式Ia-Qaの化合物A-55.001~A-55.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0326】

表A-56は、22種の式Ia-Qaの化合物A-56.001~A-56.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0327】

表A-57は、22種の式Ia-Qaの化合物A-57.001~A-57.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0328】

表A-58は、22種の式Ia-Qaの化合物A-58.001~A-58.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0329】

表A-59は、22種の式Ia-Qaの化合物A-59.001~A-59.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0330】

表A-60は、22種の式Ia-Qaの化合物A-60.001~A-60.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0331】

表A-61は、22種の式Ia-Qaの化合物A-61.001~A-61.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0332】

表A-62は、22種の式Ia-Qaの化合物A-62.001~A-62.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁

50

は表 Y に定義されているとおりである。

【0333】

表 A-63 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-63.001~A-63.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は SO₂ であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0334】

表 A-64 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-64.001~A-64.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は S であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0335】

表 A-65 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-65.001~A-65.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は SO であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0336】

表 A-66 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-66.001~A-66.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は SO₂ であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0337】

表 A-67 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-67.001~A-67.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CHF₂ であり、R₃ は H であり、X は S であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0338】

表 A-68 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-68.001~A-68.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CHF₂ であり、R₃ は H であり、X は SO であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0339】

表 A-69 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-69.001~A-69.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CHF₂ であり、R₃ は H であり、X は SO₂ であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0340】

表 A-70 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-70.001~A-70.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は S であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0341】

表 A-71 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-71.001~A-71.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は SO であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0342】

表 A-72 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-72.001~A-72.022 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は SO₂ であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q

50

1は表Yに定義されているとおりである。

【0343】

表A-73は、22種の式Ia-Qaの化合物A-73.001~A-73.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0344】

表A-74は、22種の式Ia-Qaの化合物A-74.001~A-74.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0345】

表A-75は、22種の式Ia-Qaの化合物A-75.001~A-75.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0346】

表A-76は、22種の式Ia-Qaの化合物A-76.001~A-76.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0347】

表A-77は、22種の式Ia-Qaの化合物A-77.001~A-77.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0348】

表A-78は、22種の式Ia-Qaの化合物A-78.001~A-78.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0349】

表A-79は、22種の式Ia-Qaの化合物A-79.001~A-79.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0350】

表A-80は、22種の式Ia-Qaの化合物A-80.001~A-80.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0351】

表A-81は、22種の式Ia-Qaの化合物A-81.001~A-81.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0352】

表A-82は、22種の式Ia-Qaの化合物A-82.001~A-82.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁

50

は表 Y に定義されているとおりである。

【0353】

表 A-83 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-83.001~A-83.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0354】

表 A-84 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-84.001~A-84.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0355】

表 A-85 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-85.001~A-85.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0356】

表 A-86 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-86.001~A-86.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0357】

表 A-87 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-87.001~A-87.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0358】

表 A-88 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-88.001~A-88.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0359】

表 A-89 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-89.001~A-89.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0360】

表 A-90 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-90.001~A-90.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0361】

表 A-91 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-91.001~A-91.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0362】

表 A-92 は、22 種の式 I a-Q a の化合物 A-92.001~A-92.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり

50

、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0363】

表 A-93 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 A-93.001 ~ A-93.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は $S(O)NH$ であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0364】

表 AA-1 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 AA-1.001 ~ AA-1.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0365】

表 AA-2 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 AA-2.001 ~ AA-2.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0366】

表 AA-3 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 AA-3.001 ~ AA-3.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0367】

表 AA-4 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 AA-4.001 ~ AA-4.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0368】

表 AA-5 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 AA-5.001 ~ AA-5.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0369】

表 AA-6 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 AA-6.001 ~ AA-6.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0370】

表 AA-7 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 AA-7.001 ~ AA-7.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0371】

表 AA-8 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 AA-8.001 ~ AA-8.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0372】

表 AA-9 は、22 種の式 $Ia-Qa$ の化合物 AA-9.001 ~ AA-9.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義

50

されているとおりである。

【0373】

表AA-10は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-10.001~AA-10.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0374】

表AA-11は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-11.001~AA-11.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0375】

表AA-12は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-12.001~AA-12.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0376】

表AA-13は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-13.001~AA-13.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0377】

表AA-14は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-14.001~AA-14.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0378】

表AA-15は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-15.001~AA-15.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0379】

表AA-16は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-16.001~AA-16.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0380】

表AA-17は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-17.001~AA-17.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0381】

表AA-18は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-18.001~AA-18.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0382】

表AA-19は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-19.001~AA-19.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は

50

表 Y に定義されているとおりである。

【0383】

表 AA-20 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-20.001~AA-20.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0384】

表 AA-21 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-21.001~AA-21.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂ であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0385】

表 AA-22 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-22.001~AA-22.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0386】

表 AA-23 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-23.001~AA-23.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0387】

表 AA-24 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-24.001~AA-24.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO₂ であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0388】

表 AA-25 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-25.001~AA-25.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0389】

表 AA-26 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-26.001~AA-26.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0390】

表 AA-27 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-27.001~AA-27.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO₂ であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0391】

表 AA-28 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-28.001~AA-28.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Y に定義されているとおりである。

【0392】

表 AA-29 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-29.001~AA-29.022 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁ は表

50

Yに定義されているとおりである。

【0393】

表AA-30は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-30.001~AA-30.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0394】

表AA-31は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-31.001~AA-31.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0395】

表AA-32は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-32.001~AA-32.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0396】

表AA-33は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-33.001~AA-33.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0397】

表AA-34は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-34.001~AA-34.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0398】

表AA-35は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-35.001~AA-35.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0399】

表AA-36は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-36.001~AA-36.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0400】

表AA-37は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-37.001~AA-37.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0401】

表AA-38は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-38.001~AA-38.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0402】

表AA-39は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-39.001~AA-39.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ

50

1は表Yに定義されているとおりである。

【0403】

表AA-40は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-40.001~AA-40.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0404】

表AA-41は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-41.001~AA-41.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0405】

表AA-42は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-42.001~AA-42.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0406】

表AA-43は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-43.001~AA-43.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0407】

表AA-44は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-44.001~AA-44.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0408】

表AA-45は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-45.001~AA-45.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0409】

表AA-46は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-46.001~AA-46.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0410】

表AA-47は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-47.001~AA-47.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0411】

表AA-48は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-48.001~AA-48.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0412】

表AA-49は、22種の式Ia-Qaの化合物AA-49.001~AA-49.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及

50

び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0413】

表 AA-50 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-50.001~AA-50.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHFCF_3$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0414】

表 AA-51 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-51.001~AA-51.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHFCF_3$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0415】

表 AA-52 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-52.001~AA-52.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0416】

表 AA-53 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-53.001~AA-53.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0417】

表 AA-54 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-54.001~AA-54.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0418】

表 AA-55 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-55.001~AA-55.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0419】

表 AA-56 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-56.001~AA-56.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0420】

表 AA-57 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-57.001~AA-57.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0421】

表 AA-58 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-58.001~AA-58.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0422】

表 AA-59 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-59.001~AA-59.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり

50

、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0423】

表 AA-60 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-60.001~AA-60.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0424】

表 AA-61 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-61.001~AA-61.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0425】

表 AA-62 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-62.001~AA-62.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0426】

表 AA-63 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-63.001~AA-63.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0427】

表 AA-64 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-64.001~AA-64.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0428】

表 AA-65 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-65.001~AA-65.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0429】

表 AA-66 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-66.001~AA-66.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0430】

表 AA-67 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-67.001~AA-67.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0431】

表 AA-68 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-68.001~AA-68.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0432】

表 AA-69 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-69.001~AA-69.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は CH で

50

あり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0433】

表 AA-70 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-70.001~AA-70.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₃ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0434】

表 AA-71 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-71.001~AA-71.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₃ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0435】

表 AA-72 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-72.001~AA-72.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₃ であり、 R_3 は H であり、X は SO₂ であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0436】

表 AA-73 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-73.001~AA-73.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CF₃ であり、 R_3 は CH₃ であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0437】

表 AA-74 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-74.001~AA-74.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CF₃ であり、 R_3 は CH₃ であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0438】

表 AA-75 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-75.001~AA-75.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CF₃ であり、 R_3 は CH₃ であり、X は SO₂ であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0439】

表 AA-76 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-76.001~AA-76.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CHF₂ であり、 R_3 は CH₃ であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0440】

表 AA-77 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-77.001~AA-77.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CHF₂ であり、 R_3 は CH₃ であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0441】

表 AA-78 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-78.001~AA-78.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CHF₂ であり、 R_3 は CH₃ であり、X は SO₂ であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0442】

表 AA-79 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-79.001~AA-79.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₃ であり、 R_3 は CH₃ であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び

50

Q₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0443】

表 AA-80 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-80.001~AA-80.022 を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0444】

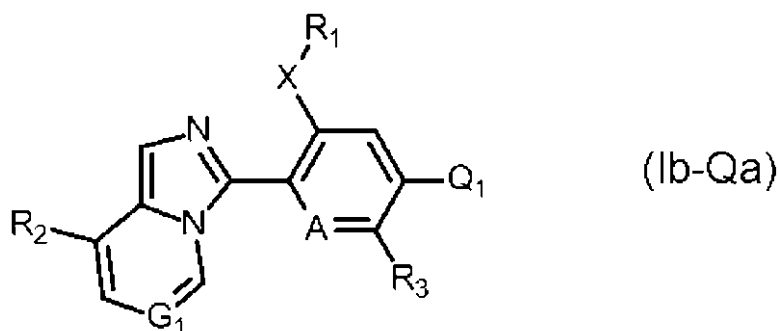
表 AA-81 は、22 種の式 Ia-Qa の化合物 AA-81.001~AA-81.022 を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0445】

以下の表 AB-1~AB-93 及び AC-1~AC-81 は、本発明の特定の化合物を示す。

【化27】



20

【0446】

表 AB-1 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-1.001~AB-1.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0447】

表 AB-2 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-2.001~AB-2.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0448】

表 AB-3 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-3.001~AB-3.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0449】

表 AB-4 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-4.001~AB-4.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0450】

表 AB-5 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-5.001~AB-5.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表

50

Yに定義されているとおりである。

【0451】

表AB-6は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-6.001~AB-6.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0452】

表AB-7は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-7.001~AB-7.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0453】

表AB-8は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-8.001~AB-8.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0454】

表AB-9は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-9.001~AB-9.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0455】

表AB-10は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-10.001~AB-10.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0456】

表AB-11は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-11.001~AB-11.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0457】

表AB-12は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-12.001~AB-12.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0458】

表AB-13は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-13.001~AB-13.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0459】

表AB-14は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-14.001~AB-14.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0460】

表AB-15は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-15.001~AB-15.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、

50

及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0461】

表 AB-16 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-16.001 ~ AB-16.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0462】

表 AB-17 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-17.001 ~ AB-17.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0463】

表 AB-18 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-18.001 ~ AB-18.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0464】

表 AB-19 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-19.001 ~ AB-19.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0465】

表 AB-20 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-20.001 ~ AB-20.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0466】

表 AB-21 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-21.001 ~ AB-21.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0467】

表 AB-22 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-22.001 ~ AB-22.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0468】

表 AB-23 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-23.001 ~ AB-23.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0469】

表 AB-24 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-24.001 ~ AB-24.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0470】

表 AB-25 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-25.001 ~ AB-25.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は

50

表 Y に定義されているとおりである。

【0471】

表 AB-26 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-26.001~AB-26.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0472】

表 AB-27 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-27.001~AB-27.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0473】

表 AB-28 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-28.001~AB-28.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0474】

表 AB-29 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-29.001~AB-29.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0475】

表 AB-30 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-30.001~AB-30.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0476】

表 AB-31 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-31.001~AB-31.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0477】

表 AB-32 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-32.001~AB-32.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0478】

表 AB-33 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-33.001~AB-33.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0479】

表 AB-34 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-34.001~AB-34.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0480】

表 AB-35 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-35.001~AB-35.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表

50

Yに定義されているとおりである。

【0481】

表AB-36は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-36.001~AB-36.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0482】

表AB-37は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-37.001~AB-37.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0483】

表AB-38は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-38.001~AB-38.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0484】

表AB-39は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-39.001~AB-39.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0485】

表AB-40は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-40.001~AB-40.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0486】

表AB-41は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-41.001~AB-41.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0487】

表AB-42は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-42.001~AB-42.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0488】

表AB-43は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-43.001~AB-43.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0489】

表AB-44は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-44.001~AB-44.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0490】

表AB-45は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-45.001~AB-45.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

50

1は表Yに定義されているとおりである。

【0491】

表AB-46は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-46.001~AB-46.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0492】

表AB-47は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-47.001~AB-47.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0493】

表AB-48は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-48.001~AB-48.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0494】

表AB-49は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-49.001~AB-49.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0495】

表AB-50は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-50.001~AB-50.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0496】

表AB-51は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-51.001~AB-51.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0497】

表AB-52は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-52.001~AB-52.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0498】

表AB-53は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-53.001~AB-53.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0499】

表AB-54は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-54.001~AB-54.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0500】

表AB-55は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-55.001~AB-55.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、

50

及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0501】

表 AB-56 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-56.001~AB-56.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0502】

表 AB-57 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-57.001~AB-57.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0503】

表 AB-58 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-58.001~AB-58.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0504】

表 AB-59 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-59.001~AB-59.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0505】

表 AB-60 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-60.001~AB-60.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0506】

表 AB-61 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-61.001~AB-61.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0507】

表 AB-62 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-62.001~AB-62.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0508】

表 AB-63 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-63.001~AB-63.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0509】

表 AB-64 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-64.001~AB-64.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0510】

表 AB-65 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AB-65.001~AB-65.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は CH であ

50

り、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0511】

表 AB-66 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-66.001~AB-66.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CF₃であり、 R_3 は H であり、X は SO₂ であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0512】

表 AB-67 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-67.001~AB-67.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CHF₂であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0513】

表 AB-68 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-68.001~AB-68.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CHF₂であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0514】

表 AB-69 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-69.001~AB-69.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CHF₂であり、 R_3 は H であり、X は SO₂ であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0515】

表 AB-70 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-70.001~AB-70.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₃であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0516】

表 AB-71 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-71.001~AB-71.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₃であり、 R_3 は H であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0517】

表 AB-72 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-72.001~AB-72.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₃であり、 R_3 は H であり、X は SO₂ であり、 G_1 は CH であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0518】

表 AB-73 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-73.001~AB-73.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CF₃であり、 R_3 は CH₃ であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0519】

表 AB-74 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-74.001~AB-74.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CF₃であり、 R_3 は CH₃ であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0520】

表 AB-75 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-75.001~AB-75.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は -CH₂シクロプロピルであり、 R_2 は OCH₂CF₂CF₃であり、 R_3 は CH₃ であり、X は SO₂ であり、 G_1 は CH であり、A は N

50

であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0521】

表 AB-76 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-76.001~AB-76.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0522】

表 AB-77 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-77.001~AB-77.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0523】

表 AB-78 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-78.001~AB-78.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0524】

表 AB-79 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-79.001~AB-79.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0525】

表 AB-80 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-80.001~AB-80.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0526】

表 AB-81 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-81.001~AB-81.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO_2 であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0527】

表 AB-82 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-82.001~AB-82.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は H であり、X は $S(O)NH$ であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0528】

表 AB-83 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-83.001~AB-83.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は H であり、X は $S(O)NH$ であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0529】

表 AB-84 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-84.001~AB-84.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 は H であり、X は $S(O)NH$ であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0530】

表 AB-85 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AB-85.001~AB-85.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は $S(O)NH$ であり、 G_1 は CH であり、A は N であり、及び

50

Q₁は表Yに定義されているとおりである。

【0531】

表AB-86は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-86.001~AB-86.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0532】

表AB-87は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-87.001~AB-87.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0533】

表AB-88は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-88.001~AB-88.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0534】

表AB-89は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-89.001~AB-89.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0535】

表AB-90は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-90.001~AB-90.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0536】

表AB-91は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-91.001~AB-91.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0537】

表AB-92は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-92.001~AB-92.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0538】

表AB-93は、22種の式Ib-Qaの化合物AB-93.001~AB-93.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS(O)NHであり、G₁はCHであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0539】

表AC-1は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-1.001~AC-1.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0540】

表AC-2は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-2.001~AC-2.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに

50

定義されているとおりである。

【0541】

表AC-3は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-3.001~AC-3.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0542】

表AC-4は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-4.001~AC-4.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0543】

表AC-5は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-5.001~AC-5.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0544】

表AC-6は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-6.001~AC-6.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0545】

表AC-7は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-7.001~AC-7.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0546】

表AC-8は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-8.001~AC-8.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0547】

表AC-9は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-9.001~AC-9.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0548】

表AC-10は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-10.001~AC-10.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0549】

表AC-11は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-11.001~AC-11.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0550】

表AC-12は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-12.001~AC-12.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Y

50

に定義されているとおりである。

【0551】

表AC-13は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-13.001~AC-13.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0552】

表AC-14は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-14.001~AC-14.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0553】

表AC-15は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-15.001~AC-15.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0554】

表AC-16は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-16.001~AC-16.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0555】

表AC-17は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-17.001~AC-17.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0556】

表AC-18は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-18.001~AC-18.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0557】

表AC-19は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-19.001~AC-19.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0558】

表AC-20は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-20.001~AC-20.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0559】

表AC-21は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-21.001~AC-21.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0560】

表AC-22は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-22.001~AC-22.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は

50

表 Y に定義されているとおりである。

【0561】

表 AC-23 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-23.001~AC-23.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0562】

表 AC-24 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-24.001~AC-24.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0563】

表 AC-25 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-25.001~AC-25.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0564】

表 AC-26 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-26.001~AC-26.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0565】

表 AC-27 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-27.001~AC-27.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0566】

表 AC-28 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-28.001~AC-28.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0567】

表 AC-29 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-29.001~AC-29.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0568】

表 AC-30 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-30.001~AC-30.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0569】

表 AC-31 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-31.001~AC-31.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表 Y に定義されているとおりである。

【0570】

表 AC-32 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-32.001~AC-32.022 を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、

50

及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0571】

表 AC-33 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-33.001~AC-33.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0572】

表 AC-34 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-34.001~AC-34.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0573】

表 AC-35 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-35.001~AC-35.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は S O であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0574】

表 AC-36 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-36.001~AC-36.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 は H であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は CH であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0575】

表 AC-37 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-37.001~AC-37.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0576】

表 AC-38 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-38.001~AC-38.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S O であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0577】

表 AC-39 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-39.001~AC-39.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0578】

表 AC-40 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-40.001~AC-40.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0579】

表 AC-41 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-41.001~AC-41.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S O であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0580】

表 AC-42 は、22 種の式 $Ib-Qa$ の化合物 AC-42.001~AC-42.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び

50

Q₁は表Yに定義されているとおりである。

【0581】

表AC-43は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-43.001~AC-43.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0582】

表AC-44は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-44.001~AC-44.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0583】

表AC-45は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-45.001~AC-45.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0584】

表AC-46は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-46.001~AC-46.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0585】

表AC-47は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-47.001~AC-47.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0586】

表AC-48は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-48.001~AC-48.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0587】

表AC-49は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-49.001~AC-49.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0588】

表AC-50は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-50.001~AC-50.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0589】

表AC-51は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-51.001~AC-51.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0590】

表AC-52は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-52.001~AC-52.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに

50

定義されているとおりである。

【0591】

表AC-53は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-53.001~AC-53.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0592】

表AC-54は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-54.001~AC-54.022を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はCH₃であり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0593】

表AC-55は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-55.001~AC-55.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0594】

表AC-56は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-56.001~AC-56.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0595】

表AC-57は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-57.001~AC-57.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0596】

表AC-58は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-58.001~AC-58.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0597】

表AC-59は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-59.001~AC-59.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0598】

表AC-60は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-60.001~AC-60.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0599】

表AC-61は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-61.001~AC-61.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0600】

表AC-62は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-62.001~AC-62.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ

50

1は表Yに定義されているとおりである。

【0601】

表AC-63は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-63.001~AC-63.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0602】

表AC-64は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-64.001~AC-64.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

10

【0603】

表AC-65は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-65.001~AC-65.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0604】

表AC-66は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-66.001~AC-66.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

20

【0605】

表AC-67は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-67.001~AC-67.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0606】

表AC-68は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-68.001~AC-68.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

30

【0607】

表AC-69は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-69.001~AC-69.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0608】

表AC-70は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-70.001~AC-70.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

40

【0609】

表AC-71は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-71.001~AC-71.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Yに定義されているとおりである。

【0610】

表AC-72は、22種の式Ib-Qaの化合物AC-72.001~AC-72.022を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及

50

び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0611】

表 AC-73 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-73.001~AC-73.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0612】

表 AC-74 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-74.001~AC-74.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

10

【0613】

表 AC-75 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-75.001~AC-75.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0614】

表 AC-76 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-76.001~AC-76.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

20

【0615】

表 AC-77 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-77.001~AC-77.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0616】

表 AC-78 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-78.001~AC-78.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

30

【0617】

表 AC-79 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-79.001~AC-79.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は CH_3 であり、X は S であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0618】

表 AC-80 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-80.001~AC-80.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

40

【0619】

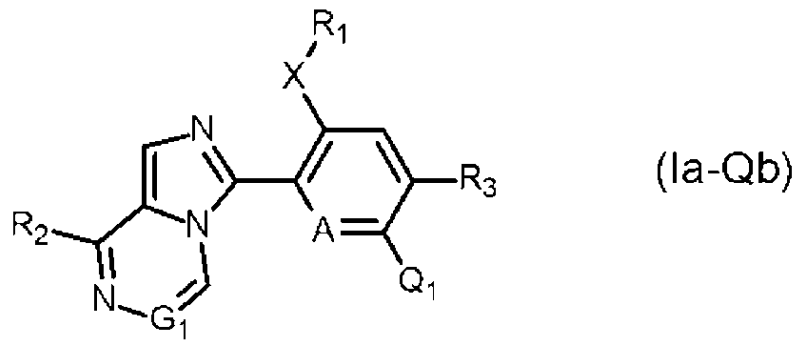
表 AC-81 は、22 種の式 Ib-Qa の化合物 AC-81.001~AC-81.022 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 は CH_3 であり、X は SO_2 であり、 G_1 は N であり、A は N であり、及び Q_1 は表 Y に定義されているとおりである。

【0620】

以下の表 B-1~B-66 及び BB-1~BB-54 は、本発明の特定の化合物をさらに示す。

50

【化 2 8】



10

【0621】

【表 2】

表Z: Q₁の置換基定義

インデックス	Q ₁	インデックス	Q ₁
1	H	12	
2	Cl	13	-N(H)CONH ₂
3	Br	14	-N(H)CONH(CH ₃)
4	-N(CH ₃)COCH ₂ CH ₃	15	-N(H)CON(CH ₃) ₂
5	-NH ₂	16	-N(CH ₃)CONH ₂
6	-NH(CH ₃)	17	-N(CH ₃)CONH(CH ₃)
7	-N(CH ₃) ₂	18	-N(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
8	-NHCOCH ₃	19	
9	-N(CH ₃)COCH ₃	20	
10	-NHCOcycloC3	21	
11	- N(CH ₃)COcycloC3		

20

30

40

【0622】

表 Z 並びに表 B 及び B B において、「シクロ C 3」は、シクロプロピルを表す。

【0623】

表 B-1 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 B-1.001~B-1.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0624】

50

表 B-2 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-2.001~B-2.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0625】

表 B-3 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-3.001~B-3.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂ であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0626】

表 B-4 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-4.001~B-4.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0627】

表 B-5 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-5.001~B-5.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0628】

表 B-6 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-6.001~B-6.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO₂ であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0629】

表 B-7 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-7.001~B-7.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0630】

表 B-8 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-8.001~B-8.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0631】

表 B-9 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-9.001~B-9.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO₂ であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0632】

表 B-10 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-10.001~B-10.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0633】

表 B-11 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-11.001~B-11.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0634】

10

20

30

40

50

表 B-12 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-12.001~B-12.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0635】

表 B-13 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-13.001~B-13.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0636】

表 B-14 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-14.001~B-14.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0637】

表 B-15 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-15.001~B-15.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0638】

表 B-16 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-16.001~B-16.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は SO₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0639】

表 B-17 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-17.001~B-17.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は SO₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0640】

表 B-18 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-18.001~B-18.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は SO₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0641】

表 B-19 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-19.001~B-19.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0642】

表 B-20 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-20.001~B-20.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0643】

表 B-21 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-21.001~B-21.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0644】

10

20

30

40

50

表 B-22 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-22.001~B-22.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0645】

表 B-23 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-23.001~B-23.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0646】

表 B-24 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-24.001~B-24.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0647】

表 B-25 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-25.001~B-25.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0648】

表 B-26 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-26.001~B-26.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0649】

表 B-27 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-27.001~B-27.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0650】

表 B-28 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-28.001~B-28.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0651】

表 B-29 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-29.001~B-29.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0652】

表 B-30 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-30.001~B-30.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0653】

表 B-31 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-31.001~B-31.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0654】

10

20

30

40

50

表 B-32 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-32.001~B-32.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0655】

表 B-33 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-33.001~B-33.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂ であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0656】

表 B-34 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-34.001~B-34.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は SO₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0657】

表 B-35 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-35.001~B-35.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は SO₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0658】

表 B-36 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-36.001~B-36.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は SO₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂ であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0659】

表 B-37 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-37.001~B-37.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0660】

表 B-38 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-38.001~B-38.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0661】

表 B-39 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-39.001~B-39.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂ であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0662】

表 B-40 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-40.001~B-40.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0663】

表 B-41 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-41.001~B-41.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は CH であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0664】

10

20

30

40

50

表 B-42 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-42.001~B-42.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CH₂CF₂であり、R₃ は H であり、X は SO₂ であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0665】

表 B-43 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-43.001~B-43.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃であり、R₃ は H であり、X は S であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0666】

表 B-44 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-44.001~B-44.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃であり、R₃ は H であり、X は SO であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0667】

表 B-45 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-45.001~B-45.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃であり、R₃ は H であり、X は SO₂ であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0668】

表 B-46 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-46.001~B-46.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃ は H であり、X は S であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0669】

表 B-47 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-47.001~B-47.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃ は H であり、X は SO であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0670】

表 B-48 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-48.001~B-48.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃ は H であり、X は SO₂ であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0671】

表 B-49 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-49.001~B-49.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CH₂CF₂であり、R₃ は H であり、X は S であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0672】

表 B-50 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-50.001~B-50.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CH₂CF₂であり、R₃ は H であり、X は SO であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0673】

表 B-51 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-51.001~B-51.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₂CH₂CF₂であり、R₃ は H であり、X は SO₂ であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0674】

10

20

30

40

50

表 B-52 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-52.001~B-52.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は S であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0675】

表 B-53 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-53.001~B-53.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は SO であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0676】

表 B-54 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-54.001~B-54.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は -CH₂シクロプロピルであり、R₂ は OCH₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は SO₂ であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0677】

表 B-55 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-55.001~B-55.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は CH₂CH₃ であり、R₂ は OCH₂CF₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は S(O)NH であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0678】

表 B-56 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-56.001~B-56.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は CH₂CH₃ であり、R₂ は OCH₂CF₂CHF₂ であり、R₃ は H であり、X は S(O)NH であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0679】

表 B-57 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-57.001~B-57.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は CH₂CH₃ であり、R₂ は OCH₂CHF₂ であり、R₃ は H であり、X は S(O)NH であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0680】

表 B-58 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-58.001~B-58.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は CH₂CH₃ であり、R₂ は OCH₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は S(O)NH であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0681】

表 B-59 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-59.001~B-59.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は CH₂CH₃ であり、R₂ は OCH₂CF₂CHF₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は S(O)NH であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0682】

表 B-60 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-60.001~B-60.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は CH₂CH₃ であり、R₂ は SO₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は S(O)NH であり、G₁ は CH であり、A は N であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0683】

表 B-61 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-61.001~B-61.021 を提供するものであり、ここで、R₁ は CH₂CH₃ であり、R₂ は OCH₂CF₂CF₃ であり、R₃ は H であり、X は S(O)NH であり、G₁ は CH であり、A は CH であり、及び Q₁ は表 Z に定義されているとおりである。

【0684】

10

20

30

40

50

表 B-62 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-62.001~B-62.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S(O)NH であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0685】

表 B-63 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-63.001~B-63.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S(O)NH であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0686】

表 B-64 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-64.001~B-64.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S(O)NH であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0687】

表 B-65 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-65.001~B-65.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S(O)NH であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0688】

表 B-66 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 B-66.001~B-66.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は SO₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S(O)NH であり、G₁は CH であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0689】

表 BB-1 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 BB-1.001~BB-1.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0690】

表 BB-2 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 BB-2.001~BB-2.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0691】

表 BB-3 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 BB-3.001~BB-3.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0692】

表 BB-4 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 BB-4.001~BB-4.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0693】

表 BB-5 は、21 種の式 I a-Q b の化合物 BB-5.001~BB-5.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0694】

10

20

30

40

50

表BB-6は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-6.001~BB-6.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0695】

表BB-7は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-7.001~BB-7.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0696】

表BB-8は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-8.001~BB-8.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0697】

表BB-9は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-9.001~BB-9.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0698】

表BB-10は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-10.001~BB-10.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0699】

表BB-11は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-11.001~BB-11.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0700】

表BB-12は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-12.001~BB-12.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0701】

表BB-13は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-13.001~BB-13.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0702】

表BB-14は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-14.001~BB-14.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0703】

表BB-15は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-15.001~BB-15.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0704】

10

20

30

40

50

表BB-16は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-16.001~BB-16.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0705】

表BB-17は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-17.001~BB-17.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0706】

表BB-18は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-18.001~BB-18.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0707】

表BB-19は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-19.001~BB-19.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0708】

表BB-20は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-20.001~BB-20.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0709】

表BB-21は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-21.001~BB-21.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0710】

表BB-22は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-22.001~BB-22.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0711】

表BB-23は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-23.001~BB-23.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0712】

表BB-24は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-24.001~BB-24.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0713】

表BB-25は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-25.001~BB-25.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0714】

10

20

30

40

50

表BB-26は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-26.001~BB-26.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0715】

表BB-27は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-27.001~BB-27.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0716】

表BB-28は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-28.001~BB-28.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0717】

表BB-29は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-29.001~BB-29.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0718】

表BB-30は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-30.001~BB-30.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0719】

表BB-31は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-31.001~BB-31.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0720】

表BB-32は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-32.001~BB-32.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0721】

表BB-33は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-33.001~BB-33.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0722】

表BB-34は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-34.001~BB-34.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0723】

表BB-35は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-35.001~BB-35.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0724】

10

20

30

40

50

表 BB-36 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-36.001~BB-36.021 を提供するものであり、ここで、R₁は CH₂CH₃であり、R₂は SO₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は N であり、A は CH であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0725】

表 BB-37 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-37.001~BB-37.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0726】

表 BB-38 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-38.001~BB-38.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0727】

表 BB-39 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-39.001~BB-39.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0728】

表 BB-40 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-40.001~BB-40.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0729】

表 BB-41 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-41.001~BB-41.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0730】

表 BB-42 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-42.001~BB-42.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₂CHF₂であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0731】

表 BB-43 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-43.001~BB-43.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は S であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0732】

表 BB-44 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-44.001~BB-44.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0733】

表 BB-45 は、21 種の式 Ia-Qb の化合物 BB-45.001~BB-45.021 を提供するものであり、ここで、R₁は -CH₂シクロプロピルであり、R₂は OCH₂CF₃であり、R₃は H であり、X は SO₂であり、G₁は N であり、A は N であり、及び Q₁は表 Z に定義されているとおりである。

【0734】

10

20

30

40

50

表BB-46は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-46.001~BB-46.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0735】

表BB-47は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-47.001~BB-47.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0736】

表BB-48は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-48.001~BB-48.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0737】

表BB-49は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-49.001~BB-49.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0738】

表BB-50は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-50.001~BB-50.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0739】

表BB-51は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-51.001~BB-51.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0740】

表BB-52は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-52.001~BB-52.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0741】

表BB-53は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-53.001~BB-53.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0742】

表BB-54は、21種の式Ia-Qbの化合物BB-54.001~BB-54.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0743】

以下の表BC-1~BC-66及びBD-1~BD-54は、本発明の特定の化合物を示す。

10

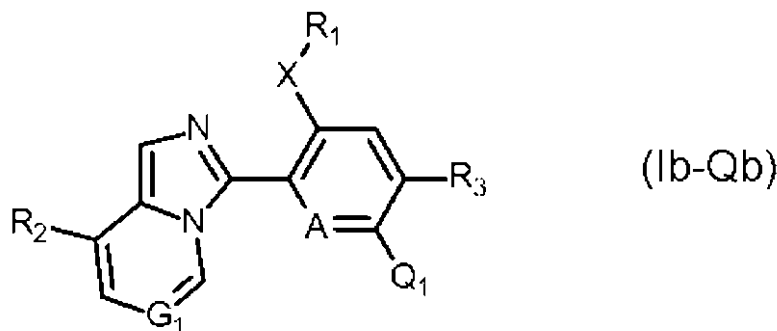
20

30

40

50

【化 2 9】



10

【0744】

表BC-1は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-1.001~BC-1.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0745】

表BC-2は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-2.001~BC-2.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

20

【0746】

表BC-3は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-3.001~BC-3.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0747】

表BC-4は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-4.001~BC-4.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

30

【0748】

表BC-5は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-5.001~BC-5.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0749】

表BC-6は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-6.001~BC-6.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

40

【0750】

表BC-7は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-7.001~BC-7.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0751】

表BC-8は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-8.001~BC-8.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R

50

3はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0752】

表BC-9は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-9.001~BC-9.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CHF₂であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0753】

表BC-10は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-10.001~BC-10.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

10

【0754】

表BC-11は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-11.001~BC-11.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0755】

表BC-12は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-12.001~BC-12.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

20

【0756】

表BC-13は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-13.001~BC-13.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0757】

表BC-14は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-14.001~BC-14.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

30

【0758】

表BC-15は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-15.001~BC-15.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はOCH₂CF₂CHF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0759】

表BC-16は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-16.001~BC-16.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

40

【0760】

表BC-17は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-17.001~BC-17.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はCHであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0761】

表BC-18は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-18.001~BC-18.021を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂CH₃であり、R₂はSO₂CF₃であり

50

、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はCHであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0762】

表BC-19は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-19.001~BC-19.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0763】

表BC-20は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-20.001~BC-20.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

10

【0764】

表BC-21は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-21.001~BC-21.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0765】

表BC-22は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-22.001~BC-22.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

20

【0766】

表BC-23は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-23.001~BC-23.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0767】

表BC-24は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-24.001~BC-24.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

30

【0768】

表BC-25は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-25.001~BC-25.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0769】

表BC-26は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-26.001~BC-26.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

40

【0770】

表BC-27は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-27.001~BC-27.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0771】

表BC-28は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-28.001~BC-28.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であ

50

り、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0772】

表BC-29は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-29.001~BC-29.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0773】

表BC-30は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-30.001~BC-30.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

10

【0774】

表BC-31は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-31.001~BC-31.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0775】

表BC-32は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-32.001~BC-32.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

20

【0776】

表BC-33は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-33.001~BC-33.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0777】

表BC-34は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-34.001~BC-34.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

30

【0778】

表BC-35は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-35.001~BC-35.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0779】

表BC-36は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-36.001~BC-36.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

40

【0780】

表BC-37は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-37.001~BC-37.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はCHであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0781】

表BC-38は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-38.001~BC-38.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は $-CH_2$ シクロプロピルであり、 R_2 は OCH_2

50

C F₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0782】

表B C-39は、21種の式I b-Q bの化合物B C-39.001~B C-39.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0783】

表B C-40は、21種の式I b-Q bの化合物B C-40.001~B C-40.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

10

【0784】

表B C-41は、21種の式I b-Q bの化合物B C-41.001~B C-41.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0785】

表B C-42は、21種の式I b-Q bの化合物B C-42.001~B C-42.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

20

【0786】

表B C-43は、21種の式I b-Q bの化合物B C-43.001~B C-43.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0787】

表B C-44は、21種の式I b-Q bの化合物B C-44.001~B C-44.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

30

【0788】

表B C-45は、21種の式I b-Q bの化合物B C-45.001~B C-45.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0789】

表B C-46は、21種の式I b-Q bの化合物B C-46.001~B C-46.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はC Hであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

40

【0790】

表B C-47は、21種の式I b-Q bの化合物B C-47.001~B C-47.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はC Hであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0791】

表B C-48は、21種の式I b-Q bの化合物B C-48.001~B C-48.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂

50

C F₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はC Hであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0792】

表B C - 49は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 49.001~B C - 49.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はC Hであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0793】

表B C - 50は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 50.001~B C - 50.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はC Hであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

10

【0794】

表B C - 51は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 51.001~B C - 51.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はC Hであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0795】

表B C - 52は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 52.001~B C - 52.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はC Hであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

20

【0796】

表B C - 53は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 53.001~B C - 53.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はC Hであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0797】

表B C - 54は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 54.001~B C - 54.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はC Hであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

30

【0798】

表B C - 55は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 55.001~B C - 55.021を提供するものであり、ここで、R₁はC H₂ C H₃であり、R₂はO C H₂ C F₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS (O) N Hであり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0799】

表B C - 56は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 56.001~B C - 56.021を提供するものであり、ここで、R₁はC H₂ C H₃であり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはS (O) N Hであり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

40

【0800】

表B C - 57は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 57.001~B C - 57.021を提供するものであり、ここで、R₁はC H₂ C H₃であり、R₂はO C H₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはS (O) N Hであり、G₁はC Hであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0801】

表B C - 58は、21種の式I b - Q bの化合物B C - 58.001~B C - 58.021を提供するものであり、ここで、R₁はC H₂ C H₃であり、R₂はO C H₂ C F₃であ

50

り、 R_3 はHであり、 X は $S(O)NH$ であり、 G_1 はCHであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0802】

表BC-59は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-59.001~BC-59.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 はHであり、 X は $S(O)NH$ であり、 G_1 はCHであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0803】

表BC-60は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-60.001~BC-60.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X は $S(O)NH$ であり、 G_1 はCHであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

10

【0804】

表BC-61は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-61.001~BC-61.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X は $S(O)NH$ であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0805】

表BC-62は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-62.001~BC-62.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 はHであり、 X は $S(O)NH$ であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

20

【0806】

表BC-63は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-63.001~BC-63.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X は $S(O)NH$ であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0807】

表BC-64は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-64.001~BC-64.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X は $S(O)NH$ であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

30

【0808】

表BC-65は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-65.001~BC-65.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 はHであり、 X は $S(O)NH$ であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0809】

表BC-66は、21種の式Ib-Qbの化合物BC-66.001~BC-66.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X は $S(O)NH$ であり、 G_1 はCHであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

40

【0810】

表BD-1は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-1.001~BD-1.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0811】

表BD-2は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-2.001~BD-2.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり

50

、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0812】

表BD-3は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-3.001~BD-3.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0813】

表BD-4は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-4.001~BD-4.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

10

【0814】

表BD-5は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-5.001~BD-5.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0815】

表BD-6は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-6.001~BD-6.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

20

【0816】

表BD-7は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-7.001~BD-7.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0817】

表BD-8は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-8.001~BD-8.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

30

【0818】

表BD-9は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-9.001~BD-9.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0819】

表BD-10は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-10.001~BD-10.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

40

【0820】

表BD-11は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-11.001~BD-11.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0821】

表BD-12は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-12.001~BD-12.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であ

50

り、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0822】

表BD-13は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-13.001~BD-13.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0823】

表BD-14は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-14.001~BD-14.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

10

【0824】

表BD-15は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-15.001~BD-15.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0825】

表BD-16は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-16.001~BD-16.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

20

【0826】

表BD-17は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-17.001~BD-17.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0827】

表BD-18は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-18.001~BD-18.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は SO_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はNであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

30

【0828】

表BD-19は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-19.001~BD-19.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0829】

表BD-20は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-20.001~BD-20.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

40

【0830】

表BD-21は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-21.001~BD-21.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0831】

表BD-22は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-22.001~BD-22.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CHF

50

2であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0832】

表BD-23は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-23.001~BD-23.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0833】

表BD-24は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-24.001~BD-24.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2$ であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

10

【0834】

表BD-25は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-25.001~BD-25.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0835】

表BD-26は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-26.001~BD-26.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

20

【0836】

表BD-27は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-27.001~BD-27.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CHF_2 であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0837】

表BD-28は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-28.001~BD-28.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

30

【0838】

表BD-29は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-29.001~BD-29.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X はSOであり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0839】

表BD-30は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-30.001~BD-30.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_3 であり、 R_3 はHであり、 X は SO_2 であり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

40

【0840】

表BD-31は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-31.001~BD-31.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は $OCH_2CF_2CHF_2CF_3$ であり、 R_3 はHであり、 X はSであり、 G_1 はNであり、 A はCHであり、及び Q_1 は表Zに定義されているとおりである。

【0841】

表BD-32は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-32.001~BD-32.021を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2CH_3 であり、 R_2 は OCH_2CF_2CH

50

F C F₃であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はNであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0842】

表BD-33は、21種の式I b-Q bの化合物BD-33.001~BD-33.021を提供するものであり、ここで、R₁はC H₂ C H₃であり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F C F₃であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はNであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0843】

表BD-34は、21種の式I b-Q bの化合物BD-34.001~BD-34.021を提供するものであり、ここで、R₁はC H₂ C H₃であり、R₂はS O₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

10

【0844】

表BD-35は、21種の式I b-Q bの化合物BD-35.001~BD-35.021を提供するものであり、ここで、R₁はC H₂ C H₃であり、R₂はS O₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はNであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0845】

表BD-36は、21種の式I b-Q bの化合物BD-36.001~BD-36.021を提供するものであり、ここで、R₁はC H₂ C H₃であり、R₂はS O₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はNであり、AはC Hであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

20

【0846】

表BD-37は、21種の式I b-Q bの化合物BD-37.001~BD-37.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0847】

表BD-38は、21種の式I b-Q bの化合物BD-38.001~BD-38.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

30

【0848】

表BD-39は、21種の式I b-Q bの化合物BD-39.001~BD-39.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C F₃であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0849】

表BD-40は、21種の式I b-Q bの化合物BD-40.001~BD-40.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

40

【0850】

表BD-41は、21種の式I b-Q bの化合物BD-41.001~BD-41.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂ C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0851】

表BD-42は、21種の式I b-Q bの化合物BD-42.001~BD-42.021を提供するものであり、ここで、R₁は-C H₂シクロプロピルであり、R₂はO C H₂

50

C F₂ C H F₂であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0852】

表BD-43は、21種の式I b-Q bの化合物BD-43.001~BD-43.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0853】

表BD-44は、21種の式I b-Q bの化合物BD-44.001~BD-44.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

10

【0854】

表BD-45は、21種の式I b-Q bの化合物BD-45.001~BD-45.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はNであり、AはNであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0855】

表BD-46は、21種の式I b-Q bの化合物BD-46.001~BD-46.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

20

【0856】

表BD-47は、21種の式I b-Q bの化合物BD-47.001~BD-47.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0857】

表BD-48は、21種の式I b-Q bの化合物BD-48.001~BD-48.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CF₃であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

30

【0858】

表BD-49は、21種の式I b-Q bの化合物BD-49.001~BD-49.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CH F₂であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0859】

表BD-50は、21種の式I b-Q bの化合物BD-50.001~BD-50.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CH F₂であり、R₃はHであり、XはS Oであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

40

【0860】

表BD-51は、21種の式I b-Q bの化合物BD-51.001~BD-51.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂CF₂CH F₂であり、R₃はHであり、XはS O₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0861】

表BD-52は、21種の式I b-Q bの化合物BD-52.001~BD-52.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂

50

C F₃であり、R₃はHであり、XはSであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0862】

表BD-53は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-53.001~BD-53.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂C F₃であり、R₃はHであり、XはSOであり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0863】

表BD-54は、21種の式Ib-Qbの化合物BD-54.001~BD-54.021を提供するものであり、ここで、R₁は-CH₂シクロプロピルであり、R₂はOCH₂C F₃であり、R₃はHであり、XはSO₂であり、G₁はNであり、AはCHであり、及びQ₁は表Zに定義されているとおりである。

【0864】

本発明に係る式Iの化合物は、低施用量でも、有害生物防除分野における予防的及び／又は治療的に価値の高い有効成分であり、これらは、きわめて好ましい殺生物範囲を有すると共に、温血種、魚類及び植物類による良好な耐性を示す。本発明に係る有効成分は、通常、感受性であるが、耐性でもある昆虫又は代表的なダニ目、線虫若しくは軟体動物などの動物有害生物の成長段階のすべて又は各々に対して作用する。本発明に係る有効成分の殺虫活性、殺線虫活性、殺軟体動物活性又は殺ダニ活性は、それ自体、直接的に顕在化（すなわち直後又は一定時間が経過した後のみ（例えば、脱皮中）生じる有害生物の駆除）されるか、又は間接的に顕在化（例えば、産卵及び／又は孵化率の低下、摂食阻害効果及び／又は成長阻害）され得る。一実施形態では、少なくとも50~60%の駆除割合（死亡率）に相当する良好な活性が観察され得る。

【0865】

本発明に係る式（I）の化合物は、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有利なレベルの優れた特性（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、向上した物理化学的特性又は高い生分解性若しくは環境プロファイル）を含む任意の数の有益性を有し得る。特に、特定の式（I）の化合物は、例えば、非標的節足動物といった非標的生物、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に対する有利な安全性プロファイルを示すことが意外なことに見出された。より具体的には、セイヨウミツバチ（*Apis mellifera*）である。

【0866】

この点に関して、特定の発明の式（I）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、例えば、50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppm又は0.2 ppmといった必要に応じてより低い施用量を用いる、生物学的実施例において概述されているものと同様の又はこれらに適応する実験手法を用いて当業者により検証可能である。

【0867】

さらに、意外なことに、本発明の式（I）の化合物は、特に、低い融点、低い親油性及び高い水溶性といった作物保護における用途について有利な物理化学的特性を示すことが見出された。このような特性は、植物による摂取及び浸透移行性分布について有利であることが見出されており、以下に列挙した特定の有害生物種を防除するために、例えばA. Buchholz, S. Trapp, Pest Manag Sci 2016; 72: 929-939)を参照されたい。

【0868】

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）、アシフトコナダニ（*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 (*Chorioptes* 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 (*Polyphagotarsonone latus*)、パノニクス属 (*Panonychus* spp.)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptruta 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 (*Agriotes* 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 (*Atenius* 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・フィロサ (*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*)、メガセルス属 (*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 (*Otiorhynchus* 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* sp

10

20

30

40

50

p.)、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 (*Scarabeidae*)、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.) ;

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 (*Lirio myza* 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 (*Pegomya 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 (*Rivelia 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*)、バチコエリア・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.)、ユースキスツス属 (*Euschistus* 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 (*Leptocorisa* 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.)、チアンタ属 (*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 (*Adalges* 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・フロッコス (*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 dictyospermi*)、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.)、リングワタムシ (*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 brimblecombei*)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (*Hyadaphis pseudobrassicae*)、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・ブルイノサ (*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.)、ネオトキシゾプテラ属 (*Neotoxoptera* sp.)、ツマグロヨコバイ属 (*Nephotettix* spp.)、ニラパルバタ属 (*Nilaparvata* spp.)、ナシミドリ

10

20

30

40

50

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 (*Oreg
 ma lanigera Zehnter*)、ヤマモモコナジラミ (*Parabemis
 ia myrica*)、パラトリオザ・コッケリ (*Paratríoza cock
 erelli*)、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 ma
 idis*)、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
 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 (*Pseu
 dococcus spp.*)、ワタノミハムシ (*Pseudatomoscelis
 seriatus*)、プシラ属 (*Psylla spp.*)、ブルビナリア・エチオピカ
 (*Pulvinaria aethiopica*)、クアドラズピジオツス属 (*Quad
 raspidiotus 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 (*Rho
 palosiphum 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 (*Schiz
 aphis spp.*)、シトビオン属 (*Sitobion spp.*)、セジロウンカ
 (*Sogatella furcifera*)、スピシスチルス・フェスチヌス (*Sp
 issistilus festinus*)、タロファガス・プロセルピナ (*Taroph
 agus Proserpina*)、トキシプテラ属 (*Toxoptera spp.*)、
 トリアレウロデス属 (*Trialeurodes spp.*)、トリジスカス・スポロボリ
 (*Tridiscus sporoboli*)、トリオニムス属 (*Trionymus
 spp.*)、ミカントガリキジラミ (*Trióza erytreae*)、ニセヤノネカイ
 ガラムシ (*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ (*Zygina fla
 mmigera*)、ジギニジア・スクテラリス (*Zyginidia scutella
 ris*) ;
 膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えばヒメハキリアリ属 (*Acromyrme
 x*)、アルゲ属 (*Arge spp.*)、ハキリアリ属 (*Atta spp.*)、セフス属
 (*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 polytom
 a*)、ホプロカンパ属 (*Hoplocampa spp.*)、ケアリ属 (*Lasius
 spp.*)、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、ネオジプリ
 オン属 (*Neodiprion spp.*)、シュウカクアリ属 (*Pogonomyrm
 ex 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 (*Ma
 crotermes 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 (*Reti
 culitermes spp.*) ; ソレノプシス・ゲミナテ (*Solenopsis
 geminate*)
 鱗翅目 (*Lepidoptera*) から、例えばアクレリス属 (*Accleris spp
 .*)、アドキシフィエス属 (*Adoxophyes spp.*)、アエゲリア属 (*Aeg
 eria 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 gemmatali
 s*)、アルチップス属 (*Archips spp.*)、アルギレスチア属 (*Argyre*

sthia 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・ツルベリエ
 ラ (*Bucculatrix thurberiella*)、アフリカズイム (*Buss
 eola fusca*)、スジマラダメイガ (*Cadra cautella*)、モモシ
 ンクイガ (*Carposina nipponensis*)、チロ属 (*Chilo* sp
 p.)、コリストネウラ属 (*Choristoneura* spp.)、クリソテウチア
 ・トピアリア (*Chrysoteuchia topiaria*)、ブドウホソハマキ (
Clysia ambiguelia)、クナファロクロシス属 (*Cnaphalocr
 ocis* 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 (*Cosmop
 hila 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 (
Cydalima 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.)、ジパロブシス・カスタネア (*Dipa
 ropsis 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 (*Ephes
 tia* 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 z
 inckinella*)、ユーコスマ属 (*Eucosma* spp.)、ブドウホソハマ
 キ (*Eupoecilia ambiguelia*)、ユープロクチス属 (*Euproc
 tis* spp.)、ユークソア属 (*Euxoa* spp.)、フェルチア・ジャクリフ
 エリア (*Feltia jaculiferia*)、グラホリタ属 (*Grapholit
 a* 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 (*Hellula
 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 (*Lasm
 opalpus lignosellus*)、レウコプテラ・シテラ (*Leucopte
 ra scitella*)、リトコレチス属 (*Lithocollethis* 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.)、マラコソマ属 (*Malac
 osoma* 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* sp
 p.)、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 flam
 mea*)、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 (*Pe
 rileucoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニプンクタ (*P
 seudaletia 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*)、ラキブルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、リチア・アルビコスタ
 (*Richia albicosta*)、シルポファガ属 (*Scirpophaga* s

10

20

30

40

50

pp.)、セサミア属 (*Sesamia* spp.)、スパルガノチス属 (*Sparganthis* 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 (*Synant hedon* 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 (*Trichop lusia ni*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*) 及びスガ属 (*Ypo nomeuta* spp.) ;

食毛目 (*Mallophaga*) から、例えばダマリネア属 (*Damalinae* spp.) 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 (*Neocur tilla 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 (*Cal liothrips 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・アウランチ (*Scirtothrips aurantii*)、ダイズアザミウマ (*Sericothrips varia bilis*)、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*)。

【0869】

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、莖、塊茎若しく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、場合により、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。

【0870】

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

10

20

30

40

50

ある。

【0871】

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／又は野菜作物にも用いられ得る。

【0872】

例えば、本発明は、以下の観賞植物種のいずれかに使用され得る：カッコウアザミ属 (*Ageratum* spp.)、アロンソア属 (*Alonsoa* spp.)、イチリンソウ属 (*Anemone* spp.)、アニソドンテア・カペンシス (*Anisodonteacapsensis*)、アンセミス属 (*Anthemis* spp.)、キンギョソウ属 (*Antirrhinum* spp.)、シオン属 (*Aster* spp.)、ベゴニア属 (*Begonia* spp.) (例えば、エラチオールベゴニア (*B. elatior*)、シキザキベゴニア (*B. semperflorens*)、*B. チュベレウクス* (*B. tubereux*))、ブーゲンビリア属 (*Bougainvillea* spp.)、ブラキスコメ属 (*Brachycome* spp.)、アブラナ属 (*Brassica* spp.) (観賞植物)、カルセオラリア属 (*Calceolaria* spp.)、トウガラシ (*Capsicum annuum*)、ニチニチソウ (*Catharanthus roseus*)、カンナ属 (*Canna* spp.)、ヤグルマギク属 (*Centaurea* spp.)、キク属 (*Chrysanthemum* spp.)、シネリア属 (*Cineraria* spp.) (シロタエギク (*C. maritime*))、ハルシャギク属 (*Coreopsis* spp.)、クラッスラ・コッキネア (*Cassula coccinea*)、クフエア・イグネア (*Cuphea ignea*)、ダリア属 (*Dahlia* spp.)、デルフィニウム属 (*Delphinium* spp.)、ケマンソウ (*Dicentra spectabilis*)、ドロテアンツス属 (*Dorotheantus* spp.)、トルコギキョウ (*Eustoma grandiflorum*)、レンギョウ属 (*Forsythia* spp.)、フクシア属 (*Fuchsia* spp.)、ゼラニウム・グナファリウム (*Geranium gnaphalium*)、ガーベラ属 (*Gerbera* spp.)、センニチコウ (*Gomphrena globosa*)、キダチルリソウ属 (*Heliotropium* spp.)、ヒマワリ属 (*Helianthus* spp.)、フヨウ属 (*Hibiscus* spp.)、アジサイ属 (*Hortensia* spp.)、アジサイ属 (*Hydrangea* spp.)、ソバカスソウ (*Hypoestes phyllostachya*)、ツリフネソウ属 (*Impatiens* spp.) (アフリカハウセンカ (*I. Walleriana*))、イレシネ属 (*Iresines* spp.)、カランコエ属 (*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 (*Lilium* spp.)、メセンブリアンテマ属 (*Mesembryanthemum* spp.)、ミゾホオズキ属 (*Mimulus* spp.)、ヤグルマハッカ属 (*Monarda* spp.)、ネメシア属 (*Nemesia* spp.)、タゲテス属 (*Tagetes* spp.)、ナデシコ属 (*Dianthus* spp.) (カーネーション)、カンナ属 (*Canna* spp.)、カタバミ属 (*Oxalis* spp.)、ヒナギク属 (*Bellis* spp.)、テンジクアオイ属 (*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 (*Viola* spp.) (パンジー)、ペチュニア属 (*Petunia* spp.)、フロックス属 (*Phlox* spp.)、プレクトランサス属 (*Plecthranthus* spp.)、ポインセチア種 (*Poinsettia* spp.)、ツタ属 (*Parthenocissus* spp.) (アメリカツタ (*P. quinquefolia*)、ツタ (*P. tricuspidata*))、サクラソウ属 (*Primula* spp.)、キンボウゲ属 (*Ranunculus* spp.)、ツツジ属 (*Rhododendron* spp.)、バラ属 (*Rosa* spp.) (バラ)、オオハンゴンソウ属 (*Rudbeckia* spp.)、

10

20

30

40

50

セントポーリア属 (*Saintpaulia* spp.)、アキギリ属 (*Salvia* spp.)、ブルーフアンフラワー (*Scaevola aemola*)、コチヨウソウ (*Schizanthus wisetonensis*)、マンネングサ属 (*Sedum* spp.)、ナス属 (*Solanum* spp.)、サフィニア種 (*Surfinia* spp.)、タゲテス属 (*Tagetes* spp.)、タバコ属 (*Nicotinia* spp.)、バーベナ種 (*Verbena* spp.)、ヒャクニチソウ属 (*Zinnia* spp.) 及び他の花壇用の植物。

【0873】

例えば、本発明は、以下の野菜種のいずれかに使用され得る：ネギ属 (*Allium* spp.) (ニンニク (*A. sativum*)、タマネギ (*A. cepa*)、エシャロット (*A. oschaninii*)、リーキ (*A. Porrum*)、シャロット (*A. ascalonicum*)、ネギ (*A. fistulosum*)、チャービル (*Anthriscus cerefolium*)、セロリ (*Apium graveolus*)、アスパラガス (*Asparagus officinalis*)、テンサイ (*Beta vulgaris*)、アブラナ属 (*Brassica* spp.) (ヤセイカンラン (*B. Oleracea*)、ハクサイ (*B. Pekinensis*)、カブ (*B. rapa*)、トウガラシ (*Capsicum annuum*)、ヒヨコマメ (*Cicer arietinum*)、エンダイブ (*Cichorium endivia*)、キクニガナ属 (*Cichorium* spp.) (チコリー (*C. intybus*)、エンダイブ (*C. endivia*))、スイカ (*Citrillus lanatus*)、キュウリ属 (*Cucumis* spp.) (サフラン (*C. sativus*)、メロン (*C. melo*))、カボチャ属 (*Cucurbita* spp.) (ペポカボチャ (*C. pepo*)、西洋カボチャ (*C. maxima*))、チョウセンアザミ属 (*Cyanara* spp.) (アーティチョーク (*C. scolymus*)、カルドン (*C. cardunculus*))、黒人参 (*Daucus carota*)、フェネル (*Foeniculum vulgare*)、オトギリソウ属 (*Hypericum* spp.)、レタス (*Lactuca sativa*)、トマト属 (*Lycopersicon* spp.) (トマト (*L. esculentum*)、トマト (*L. lycopersicum*))、ハッカ属 (*Mentha* spp.)、バジル (*Ocimum basilicum*)、パセリ (*Petroselinum crispum*)、インゲンマメ属 (*Phaseolus* spp.) (インゲンマメ (*P. vulgaris*)、ベニバナインゲン (*P. coccineus*))、エンドウ (*Pisum sativum*)、ハツカダイコン (*Raphanus sativus*)、マルバダイオウ (*Rheum rhaponticum*)、マンネンロウ属 (*Rosemarinus* spp.)、アキギリ属 (*Salvia* spp.)、キバナバラモンジン (*Scorzonera hispanica*)、ナス (*Solanum melongena*)、ホウレンソウ (*Spinacea oleracea*)、ノヂシャ属 (*Valerianella* spp.) (ノヂシャ (*V. locusta*)、イタリアンコーンサラダ (*V. eriocarpa*)) 及びソラマメ (*Vicia faba*)。

【0874】

好ましい観賞植物種としては、セントポーリア (*African violet*)、ベゴニア属 (*Begonia*)、ダリア属 (*Dahlia*)、ガーベラ属 (*Gerbera*)、アジサイ属 (*Hydrangea*)、クマツヅラ属 (*Verbena*)、バラ属 (*Rosa*)、カランコエ属 (*Kalanchoe*)、ポインセチア (*Poinsettia*)、シオン属 (*Aster*)、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、ハルシャギク属 (*Coreopsis*)、デルフィニウム属 (*Delphinium*)、ヤグルマハッカ属 (*Monarda*)、フロックス属 (*Phlox*)、オオハンゴンソウ属 (*Rudbeckia*)、マンネングサ属 (*Sedum*)、ペチュニア属 (*Petunia*)、スミレ属 (*Viola*)、ツリフネソウ属 (*Impatiens*)、フウロソウ属 (*Geranium*)、キク属 (*Chrysanthemum*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)

）、フクシア属（*Fuchsia*）、アキギリ属（*Salvia*）、アジサイ属（*Hortensia*）、ローズマリー、セージ、セイヨウオトギリ（*St. Johnswort*）、ミント、ピーマン、トマト及びキュウリが挙げられる。

【0875】

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（*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*）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、さら

10

【0876】

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（*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*）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、さらに、マメストラ属（*Mamestra*）（好ましくは野菜中）、コドリング（*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）を防除するのに特に好適である。

20

【0877】

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*）、ペロノライムス・ロンギカウダツス（*Belonolaimus longicaudatus*）及び他のペロノライムス属（*Belonolaimus*）種；マツセンチュウ、マツノザイセンチュウ（*Bursaphelenchus xylophilus*）及び他のバ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 dip*

30

40

50

saci) 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נק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*)、ロングドルス・エロンガツス (*Longidorus elongatus*) 及び他のロングドルス属 (*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.)、ヒブソベリン属 (*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攻撃を防除する方法にも関する。

【0878】

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. circumscriptus*)、*A. hortensis*)、*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. agrestis*)、*D. empiricum*)、*D. laeve*)、*D. reticulatum*) (

. 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. トルククラタ (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. ソウエルバイ (M. sowerbyi)) ; オペアス属 (Opeas) ; リンゴガイ属 (Pomacea) (スクミリングガイ (P. canaticulata)) ; ミジンマイマイ属 (Valtonia) 及びザニトイデス属 (Zanitoidea) が挙げられる。

10

【0879】

「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。

20

【0880】

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、セレウス菌 (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 (Photorhabdus 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 (Photorhabdus 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-RIP、アブリン、ルフィン、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。

30

40

【0881】

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若しくは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

50

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-G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）。

【0882】

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。

10

【0883】

このようなトランスジェニック植物の調製のための方法は、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。CryI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。

【0884】

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。

20

【0885】

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。

30

40

【0886】

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

50

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。

【0887】

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。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。

10

【0888】

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って耐虫性にされたトウモロコシ。この毒素は、カテプシン-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は、国際公開第03/018810号に記載されている。

【0889】

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。

20

【0890】

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。

【0891】

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tescos, 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。

30

【0892】

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) (グリホサート含有する) 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。

40

【0893】

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)

50

nd) Report 2003, (<http://bats.ch>)にも記載されている。
【0894】

「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。

10

【0895】

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*))又はウイルス性(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。

【0896】

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。

【0897】

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。

20

【0898】

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関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。

30

【0899】

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。

【0900】

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)を防除するための方法も提供する。一実施形態において、有害生物を防除するための方法は、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

【0901】

一実施形態において、このような有害生物を防除するための方法は、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

50

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。

【0902】

処理されるべき不織布、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

【0903】

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。

【0904】

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）昆虫に対して、特に以下の表A及びBに列举される木材穿孔性昆虫（woodborer）に対して特に好適である。

20

【0905】

【表3】

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
ガミキリムシ科 (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

40

【0906】

50

【表 4 - 1】

表B. 経済的に重要な在来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、サーブスベリー、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、サーブスベリー、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)

10

20

30

40

50

【表 4 - 2】

科	種	寄生される宿主又は作物
	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、アメリカサイカチ、ハナミズキ、ユーカリ属 (<i>Eucalyptus</i>)、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
	フロエオトリプス・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・プレイノス(<i>Pseudopityophthorus pruinosis</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(<i>Chickasaw plum</i>)、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

10

20

30

40

50

【表 4 - 3】

科	種	寄生される宿主又は作物
	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(<i>Viburnum</i>)、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・ポリスチフォルミス (<i>Vitacea polistiformis</i>)	ブドウ

10

20

【0907】

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 pear l)、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使用され得る。

【0908】

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. 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. majalis*)、コチヌス属 (*Cotinus* spp.) (例えば、アオコフキコガネ、*C. nitida*)、ポピリア属 (*Popillia* spp.) (例えば、マメコガネ (Japanese beetle)、*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. sprretulus*)、マラデラ属 (*Maladera* spp.) (例えば、アカビロウドコガネ、*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; スカプテリスクス属 (*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。

30

40

【0909】

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・

50

ウニブクダ (*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. parvulus*) など) 及びソッドウェブワーム (sod webworm) (クラムブス属 (*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。

【0910】

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 cynodonensis*))、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本線のあるアフキムシ (two-lined spittlebug) (プロサピア・ビシンクタ (*Propisapia 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。

【0911】

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。

【0912】

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。

【0913】

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 (*Phthirus* spp.)、ソレノポテス属 (*Solenopotes* spp.)。

【0914】

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.)、ウェルネツキエラ属 (*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.)。

【0915】

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

10

20

30

40

50

リボミア属 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ属 (*Braula* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、トゲアシメイトイ属 (*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.)、ツエツエバエ属 (*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.)。

10

【0916】

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.)。

【0917】

異翅目 (*Heteroptera*) 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.)。

20

【0918】

ゴキブリ目 (*Blattaria*) のうち、例えばトウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 及びスぺラ属 (*Supella* spp.)。

【0919】

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 (*Hae mophysalis* 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 (*Dermatophyes* 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.)。

30

【0920】

ダニ目 (*Actinodida*) (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 (*Hypodectes* spp.)、プテロリクス属 (*Pterolichus* spp.)、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp.)、シヨクヒヒゼンダニ属 (*Ch*

40

50

or i o p t e s s p p .) 、 ミ ミ ヒ ゼ ン ダ ニ 属 (O t o d e c t e s s p p .) 、
ヒゼンダニ属 (S a r c o p t e s s p p .) 、 シ ョ ウ セ ン コ ウ ヒ ゼ ン ダ ニ 属 (N o t
o e d r e s s p p .) 、 ク ネ ミ ド コ プ テ ス 属 (K n e m i d o c o p t e s s p p
.) 、 シ ト ジ テ ス 属 (C y t o d i t e s s p p .) 及 ビ ラ ミ ノ シ オ プ テ ス 属 (L a m
i n o s i o p t e s s p p .) 。

【 0 9 2 1 】

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。

【 0 9 2 2 】

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
カミキリ (H y l o t r u p e s b a j u l u s) 、 ク ロ ロ ホ ル ス ・ ピ ロ シ ス (C h l
o r o p h o r u s p i l o s i s) 、 ア ノ ビ ウ ム ・ プ ン ク タ ツ ム (A n o b i u m
p u n c t a t u m) 、 キ セ ス ト ビ ウ ム ・ ル ホ ビ ロ ス ム (X e s t o b i u m r u f o
v i l l o s u m) 、 プ チ リ ヌ ス ペ ク チ コ ル ニ ス (P t i l i n u s p e c t i c o r n
i s) 、 デ ン ド ロ ビ ウ ム ・ ペ ル チ ネ ク ス (D e n d r o b i u m p e r t i n e x) 、
マ ツ ザ イ シ バ ン ム シ (E r n o b i u s m o l l i s) 、 オ オ ナ ガ シ バ ン ム シ (P r i
o b i u m c a r p i n i) 、 ヒ ラ タ キ ク イ ム シ (L y c t u s b r u n n e u s)
、 ア フ リ カ ヒ ラ タ キ ク イ ム シ (L y c t u s a f r i c a n u s) 、 ア メ リ カ ヒ ラ タ キ
ク イ ム シ (L y c t u s p l a n i c o l l i s) 、 ナ ラ ヒ ラ タ キ ク イ ム シ (L y c t
u s l i n e a r i s) 、 リ ク ツ ス ・ プ ベ セ ン ス (L y c t u s p u b e s c e n s
) 、 ト ロ ゴ キ シ ロ ン ・ ア エ ク ア レ (T r o g o x y l o n a e q u a l e) 、 ミ ン テ ス
ル ギ コ リ ス (M i n t h e s r u g i c o l l i s) 、 キ シ ル ボ ル ス 属 種 (X y l e b o
r u s s p e c .) 、 ト リ プ ト デ ン ド ロ ン 属 種 (T r y p t o d e n d r o n s p e
c .) 、 ア バ テ ・ モ ナ ク ス (A p a t e m o n a c h u s) 、 ボ ス ト リ ク ス ・ カ プ シ ン
ス (B o s t r y c h u s c a p u c i n s) 、 ヘ テ ロ ボ ス ト リ ク ス ・ ブ ル ン ネ ウ ス (H e t e r o b o s t r y c h u s b r u n n e u s) 、 シ ノ キ シ ロ ン 属 種 (S i n o
x y l o n s p e c .) 及 ビ チ ビ タ ケ ナ ガ シ ン ク イ ム シ (D i n o d e r u s m i n
u t u s) などの甲虫並びにさらにコルリキバチ (S i r e x j u v e n c u s) 、 モ
ミ ノ オ オ キ バ チ (U r o c e r u s g i g a s) 、 ウ ロ セ ル ス ・ ギ ガ ス ・ タ イ グ ヌ ス (U r o c e r u s g i g a s t a i g n u s) 及 ビ ウ ロ セ ル ス ・ ア ウ グ ル (U r o c
e r u s a u g u r) などの膜翅類の昆虫 (h y m e n o p t e r a n) 並びにカロテ
ルメス・フラヴィコリス (K a l o t e r m e s f l a v i c o l l i s) 、 ニ シ イ ン
ドカンザイシロアリ (C r y p t o t e r m e s b r e v i s) 、 ヘ テ ロ テ ル メ ス ・ イ
ンディコラ (H e t e r o t e r m e s i n d i c o l a) 、 キ ア シ シ ロ ア リ (R e t
i c u l i t e r m e s f l a v i p e s) 、 レ テ ィ ク リ テ ル メ ス ・ サ ン ト ネ ン シ ス (R e t
i c u l i t e r m e s s a n t o n e n s i s) 、 レ テ ィ キ ユ リ テ ル メ ス ・ ル
シ フ グ ス (R e t i c u l i t e r m e s l u c i f u g u s) 、 ム カ シ シ ロ ア リ (M
a s t o t e r m e s d a r w i n i e n s i s) 、 ネ バ ダ オ オ シ ロ ア リ (Z o o t e
r m o p s i s n e v a d e n s i s) 及 ビ イ エ シ ロ ア リ (C o p t o t e r m e s
f o r m o s a n u s) などのシロアリ並びにセイヨウシミ (L e p i s m a s a c c
h a r i n a) などのシミ。

【 0 9 2 3 】

本発明に係る化合物は、非修飾形態で有害生物防除剤として使用され得るが、それらは、
一般に、担体、溶媒及び表面活性物質などの製剤化補助剤を用いて、様々な方法で組成物
に製剤化される。製剤は、様々な物理的形態、例えば粉剤、ゲル、水和剤、水和性粒剤、
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、水中油乳剤、油
性フロアブル剤、水性分散液、油性分散液、サスポエマルション、カプセル懸濁剤、乳化
性粒剤、可溶性液体、水溶性濃縮物（担体として水又は水混和性有機溶媒を含む）、含浸
ポリマーフィルム形態又は例えば the Manual on Developmen

10

20

30

40

50

t and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010) から公知の他の形態であり得る。このような製剤は、直接使用さ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、微量栄養素、生物有機体、油又は溶媒を用いて行われ得る。

【0924】

製剤は、微粉化された固体、粒剤、液剤、分散液又は乳剤の形態の組成物を得るために、例えば有効成分を製剤化補助剤と混合することによって調製され得る。有効成分は、微粉化された固体、鉱油、植物若しくは動物由来の油、植物若しくは動物由来の変性油、有機溶媒、水、表面活性物質又はそれらの組合せなどの他の補助剤と共に製剤化され得る。

10

【0925】

有効成分は、微細なマイクロカプセル中に含有され得る。マイクロカプセルは、多孔質担体中に有効成分も含有する。これにより、有効成分を制御された量で環境中に放出させることができる（例えば、持続放出）。マイクロカプセルは、通常、 $0.1 \sim 500 \mu\text{m}$ の直径を有する。マイクロカプセルは、カプセル重量の約 $25 \sim 95$ 重量% の量で有効成分を含有する。有効成分は、モノリシック固体の形態、固体若しくは液体分散体中の微粒子の形態又は好適な溶液の形態であり得る。封入用の膜は、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、ポリ尿素、ポリウレタン又は化学修飾ポリマー及びデンプンキサンテート又は当業者に公知の他のポリマーを含み得る。代わりに、有効成分が基剤の固体マトリクス中に微粉化された粒子の形態で含まれた微細なマイクロカプセルが形成され得るが、このマイクロカプセル自体は封入されない。

20

【0926】

本発明に係る組成物の調製に好適な製剤化補助剤は、それ自体公知である。液体担体として、以下のものが使用され得る：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、炭酸ブチレン、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、ジエチレングリコールアビエレート、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、ジプロキシトール (diproxitol)、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、炭酸エチレン、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、 α -ピネン、 δ -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、酢酸グリセロール、二酢酸グリセロール、三酢酸グリセロール、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、酸化メシチル、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-オクタールアミン、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、 α -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、乳酸プロピル、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、ペルクロロエチレン、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、オクタノールなどのより高い分子量のアルコール、

30

40

50

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-2-ピロリドンなど。

【0927】

好適な固体担体は、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石粘土、シリカ、アタパルジャイト粘土、珪藻土、石灰石、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、綿実殻、小麦粉、大豆粉、軽石、木粉、粉碎されたクルミ殻、リグニン及び同様の物質である。

【0928】

多くの表面活性物質は、固体及び液体製剤の両方中、特に使用前に担体で希釈され得る製剤中で有利に使用され得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、非イオン性又はポリマーであり得、それらは、乳化剤、湿潤剤又は懸濁化剤として又は他の目的のために使用され得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなど、硫酸アルキルの塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなど、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、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、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石鹸；ナトリウムジブチルナフタレンスルホネートなど、アルキルナフタレンスルホネートの塩；ナトリウムジ（2-エチルヘキシル）スルホスクシネートなど、スルホコハク酸塩のジアルキルエステル；オレイン酸ソルビトールなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチルアンモニウムクロリドなどの第4級アミン、ポリエチレングリコールステアレートなど、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-アルキルリン酸エステルの塩；並びにさらに例えば McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981) に記載されているさらなる物質が挙げられる。

【0929】

殺有害生物製剤に使用さ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、懸濁化剤、染料、酸化防止剤、発泡剤、光吸収剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和剤又はpH調整物質及び緩衝液、腐食防止剤、香料、湿潤剤、吸収向上剤、微量栄養素、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。

【0930】

本発明に係る組成物は、植物若しくは動物由来の油、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と油誘導体との混合物を含む添加剤を含み得る。本発明に係る組成物中の油添加剤の量は、一般に、施用される混合物を基準にして、0.01～10%である。例えば、油添加剤は、スプレー混合物が調製された後、所望の濃度でスプレータンクに加えられ得る。好ましい油添加剤は、鉱油又は植物由来の油、例えばナタネ油、オリーブ油若しくはヒマワリ油、乳化植物油、植物由来の油のアルキルエステル、例えばメチル誘導体又は魚油若しくは牛脂などの動物由来の油を含む。好ましい油添加剤は、C₈～C₂₂脂肪酸のアルキルエステル、特にC₁₂～C₁₈脂肪酸のメチル誘導体、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。

【0931】

本発明の組成物は、一般に、0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の、本発明の化合物及び1～99.9重量%の製剤化補助剤（これは、好ましくは、0～25重量%の表面活性物質を含む）を含む。市販の製品は、好ましくは、濃縮物として製剤化され得るが、最終使用者は、通常、希釈製剤を用いるであろう。

【0932】

施用量は、広い範囲内で変化し、土壌の性質、施用方法、作物植物、防除される有害生物、そのときの気候条件並びに施用方法、施用の時期及び標的作物に左右される他の要因に応じて決まる。一般的な指針として、化合物は、1～2000 l / ha、特に10～1000 l / haの割合で施用され得る。

【0933】

好ましい製剤は、以下の組成を有し得る（重量％）。

乳化性濃縮物：

有効成分：1～95％、好ましくは60～90％

表面活性剤：1～30％、好ましくは5～20％

液体担体：1～80％、好ましくは1～35％

【0934】

ダスト剤：

有効成分：0.1～10％、好ましくは0.1～5％

固体担体：99.9～90％、好ましくは99.9～99％

【0935】

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％

表面活性剤：1～40％、好ましくは2～30％

【0936】

水和剤：

有効成分：0.5～90％、好ましくは1～80％

表面活性剤：0.5～20％、好ましくは1～15％

固体担体：5～95％、好ましくは15～90％

【0937】

粒剤：

有効成分：0.1～30％、好ましくは0.1～15％

固体担体：99.5～70％、好ましくは97～85％

【0938】

以下の実施例は、本発明をさらに例示するが、本発明を限定するものではない。

【0939】

【表5】

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 %
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	—	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル(7～8モルのエチレンオキシド)	—	2 %	—
高度に分散したケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	—

【0940】

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が好適なミルにおいて十分に粉碎され、これにより、水和剤が得られ、これは、水で希釈されて、所望の濃度の懸濁液が得られる。

【0941】

【表 6】

乾燥種子処理用の粉剤	a)	b)	c)
有効成分	25 %	50 %	75 %
軽油	5 %	5 %	5 %
高度に分散したケイ酸	5 %	5 %	—
カオリン	65 %	40 %	—
タルカム	—	—	20 %

10

【0942】

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が好適なミルにおいて十分に粉砕され、種子処理に直接使用され得る粉剤が得られる。

【0943】

【表 7】

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モル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 %
ヒマシ油ポリグリコールエーテル(35モル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 %

20

【0944】

植物保護に使用され得る、任意の所要の希釈率の乳剤が水による希釈によってこの濃縮物から得られる。

【0945】

【表 8】

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

30

【0946】

即時使用可能なダスト剤は、担体と組み合わせて混合し、混合物を好適なミルにおいて粉砕することによって得られる。このような粉末は、種子の乾式粉衣にも使用され得る。

40

【0947】

50

【表 9】

押出粒剤	
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 %

【0948】

この組合せは、補助剤と混合され、粉碎され、混合物は、水で濡らされる。混合物は、押し出され、次に空気流中で乾燥される。

【0949】

【表 10】

被覆粒剤	
有効成分	8 %
ポリエチレングリコール(分子量200)	3 %
カオリン	89 %

【0950】

この微粉化された組合せは、ミキサー中において、ポリエチレングリコールで濡らされたカオリンに均一に適用される。このように、ほこりのない被覆された粒剤が得られる。

【0951】

【表 11】

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モル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75%の乳剤の形態)	1 %
水	32 %

【0952】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁液濃縮物が得られ、この懸濁液濃縮物から、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って微生物による寄生から保護され得る。

【0953】

10

20

30

40

50

【表 1 2】

種子処理用のフロアブル剤

有効成分	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 %
モノアゾー顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油(水中75%の乳剤の形態)	0.2 %
水	45.3 %

10

【0954】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁液濃縮物が得られ、この懸濁液濃縮物から、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って微生物による寄生から保護され得る。

【0955】

持続放出性カプセル懸濁剤

20

28部のこの組合せを2部の芳香族溶媒及び7部のトルエンジイソシアネート／ポリメチレンー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、所望の粒度が得られるまで、1.2部のポリビニルアルコールと、0.05部の消泡剤と、51.6部の水との混合物中で乳化する。この乳剤に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加える。混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。得られたカプセル懸濁剤を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を加えることによって安定化させる。カプセル懸濁剤製剤は、28%の有効成分を含有する。カプセルの中間直径は8～15 µmである。得られた製剤を、該当する目的に好適な装置中の水性懸濁液として種子に施用する。

【0956】

30

製剤のタイプとしては、乳剤濃縮物（EC）、懸濁液濃縮物（SC）、サスポエマルジョン（SE）、カプセル懸濁剤（CS）、水和性粒剤（WG）、乳化性粒剤（EG）、油中水乳剤（EO）、水中油乳剤（EW）、マイクロエマルジョン（ME）、油性分散液（OD）、油混和性フロアブル剤（OF）、油混和性液体（OL）、可溶性濃縮物（SL）微量散布用懸濁剤（SU）、微量散布用液剤（UL）、工業用濃縮物（TK）、分散性濃縮物（DC）、水和剤（WP）、可溶性粒剤（SG）又は農学的に許容できる補助剤と組み合わせられた任意の技術的に実現可能な製剤が挙げられる。

【実施例】

【0957】

調製実施例：

40

「Mp」は、融点（℃）を意味する。遊離基は、メチル基を表す。¹H NMR測定をBruker 400 MHz分光計で記録し、化学シフトを、TMS標準を基準としてppmで示す。示されるように、スペクトルを重水素化溶媒中で測定した。以下のLCMS法のいずれか一方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LCMS値は、保持時間（「Rt」、分で記録した）及び実測の分子イオン（M+H）⁺であった。

【0958】

LCMS及びGCMS法：

方法1：

スペクトルを、以下を備えるWaters製質量分光計（ZQシングル四重極型質量分光計）で記録した：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

50

：3.00 kV、コーン範囲：30～60 V、抽出器：2.00 V、ソース温度：150℃、脱溶剤温度：350℃、コーンガス流：0 L/Hr、脱溶剤ガス流：650 L/Hr、質量範囲：100～900 Da）及びWaters製Acquity UPLC：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。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。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 µm、30×2.1 mm、温度：60℃、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：0分間 0% B、100% A；1.2～1.5分間 100% B；流れ（mL/min）0.85。

10

【0959】

方法2：

スペクトルを、以下を備えるWaters製質量分光計（SQD又はZQシングル四重極型質量分光計）で記録した：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：3.00 kV、コーン範囲：30～60 V、抽出器：2.00 V、ソース温度：150℃、脱溶剤温度：350℃、コーンガス流：0 L/Hr、脱溶剤ガス流：650 L/Hr、質量範囲：100～900 Da）及びWaters製Acquity UPLC：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。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。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 µm、30×2.1 mm、温度：60℃、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：0分間 0% B、100% A；2.7～3.0分間 100% B；流れ（mL/min）0.85。

20

【0960】

方法3：

スペクトルを、以下を備えるWaters製質量分光計（Acquity SDS質量分光計）で記録した：エレクトロスプレーソース（極性：陽及び陰極性スイッチ、キャピラリ：3.00 kV、コーン電圧：41.00 V、ソース温度：150℃、脱溶剤ガス流：1000 L/Hr、脱溶剤温度：500℃、ガス流@コーン：50 L/hr、質量範囲：110～800 Da、PDA波長範囲：210～400 nm。カラム：Acquity UPLC HSS T3 C18、長さ30 mm、直径2.1 mm、粒径1.8 µm。カラムオープン温度40℃。溶剤勾配：A＝水＋0.1%ギ酸：アセトニトリル（95：5 v/v）。B＝アセトニトリル＋0.05%ギ酸。勾配＝0分間 90% A、10% B；0.2分間 50% A、50% B；0.7～1.3分間 0% A、100% B；1.4～1.6分間 90% A、10% B。流量0.8 mL/min。

30

【0961】

方法4：

スペクトルを、以下を備えるAgilent Technologies製の質量分光計（6410 Triple Quadrupole質量分光計）で記録した：エレクトロスプレーソース（極性：陽及び陰極性スイッチ、キャピラリ：4.00 kV、フラグメンタ：100.00 V、ガス温度：350℃、ガス流：11 L/min、ネブライザガス：45 psi、質量範囲：110～1000 Da、DAD波長範囲：210～400 nm）。カラム：KINETEX EVO C18、長さ50 mm、直径4.6 mm、粒径2.6 µm。カラムオープン温度40℃。溶剤勾配：A＝水＋0.1%ギ酸：アセトニトリル（95：5 v/v）。B＝アセトニトリル＋0.1%ギ酸。勾配＝0分間 90% A、10% B；0.9～1.8分間 0% A、100% B、2.2～2.5分間 90% A、10% B。流量1.8 mL/min。

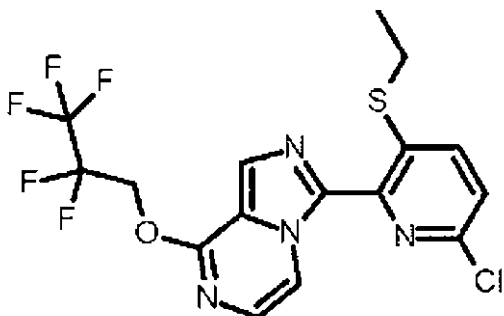
40

【0962】

実施例H1：3-（6-クロロ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル）-8-（2，

50

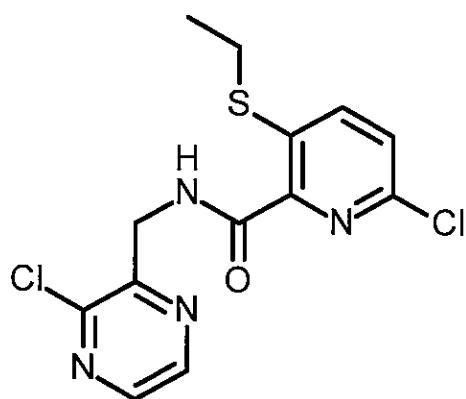
2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン(化合物P1)の調製
【化30】



化合物P1

10

ステップA: 6-クロロ-N-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミドの調製
【化31】



20

6-クロロ-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボン酸(1.57g、7.21mmol; 国際公開第17/001314号)のトルエン(28.3mL)中の懸濁液に室温で1滴のN,N-ジメチルホルムアミド及び二塩化オキサリル(0.818mL、9.38mmol)を滴下し、混合物を3時間攪拌した。反応混合物を減圧下で蒸発させて、6-クロロ-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-塩化カルボニルを得た。

30

【0963】

(3-クロロピラジン-2-イル)メタンアミンヒドロクロリド(1.30g、7.21mmol; CAS 939412-86-9)、4-ジメチルアミノピリジン(9mg、0.072mmol)及びトリエチルアミン(2.51mL、18.0mmol)のテトラヒドロフラン(20mL)中の溶液に5℃で6-クロロ-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-塩化カルボニル(7.21mmol)のテトラヒドロフラン(5.5mL)中の溶液を滴下した。反応混合物を0~5℃で1時間攪拌し、Hyfloでろ過し、残渣を酢酸エチルで洗浄した。ろ液を減圧下で濃縮し、残渣をcombiflash(シリカゲル、シクロヘキサン中の0~100%の酢酸エチル勾配)により精製して、6-クロロ-N-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミドを固体(融点138~140℃)として得た。LCMS(方法1): 343/345(M+H)⁺、保持時間0.98分間。

40

【0964】

同様に、5-ブromo-N-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミド(固体、融点127~129℃)を5-ブromo-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボン酸(国際公開第16/03022

50

9号)及び(3-クロロピラジン-2-イル)メタンアミンヒドロクロリドから得ることが可能である。LCMS(方法1):387/389/391(M+H)⁺;保持時間1.03分間。

【0965】

同様に、N-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミド(白色の固体)を3-エチルスルファニルピリジン-2-カルボン酸(国際公開第14/021468号)及び(3-クロロピラジン-2-イル)メタンアミンヒドロクロリドから得ることが可能である。LCMS(方法1):309/311(M+H)⁺;保持時間0.88分間。

【0966】

同様に、N-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミドを5-(1-シアノシクロプロピル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボン酸(国際公開第18/077565号)及び(3-クロロピラジン-2-イル)メタンアミンヒドロクロリドから得ることが可能である。LCMS(方法1):374/376(M+H)⁺;保持時間0.93分間。

【0967】

同様に、N-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-5-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミドを5-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボン酸(国際公開第18/077565号)及び(3-クロロピラジン-2-イル)メタンアミンヒドロクロリドから得ることが可能である。LCMS(方法1):376/378(M+H)⁺;保持時間0.97分間。

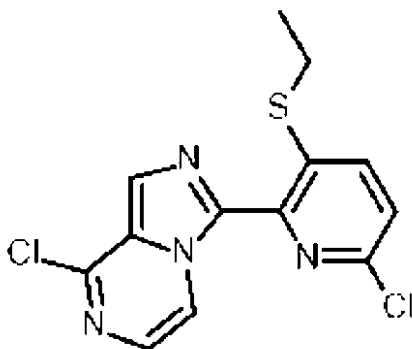
【0968】

同様に、N-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-3-エチルスルファニル-5-(2-ピリジルオキシ)ピリジン-2-カルボキサミドを3-エチルスルファニル-5-(2-ピリジルオキシ)ピリジン-2-カルボン酸(以下、実施例H11、ステップ2を参照されたい)及び(3-クロロピラジン-2-イル)メタンアミンヒドロクロリドから得ることが可能である。LCMS(方法1):402/404(M+H)⁺;保持時間1.01分間。

【0969】

ステップB:8-クロロ-3-(6-クロロ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)イミダゾ[1,5-a]ピラジンの調製

【化32】



6-クロロ-N-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミド(1.95g、5.69mmol)のトルエン(19.5mL)中の溶液にオキシ塩化リン(3.18mL、34.14mmol)を添加し、混合物を100℃で一晩攪拌した。オキシ塩化リン(1.0mL)をさらに添加し、100℃で加熱をさらに1.5時間継続した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、冷たい飽和

炭酸ナトリウム水溶液にゆっくりと添加した。室温で1時間攪拌した後、混合物をHyfloでろ過し、層を分離し、水性相を酢酸エチルで2回抽出し、組み合わせた有機層を飽和炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣をcombiflash（シクロヘキサン中に0～80%の酢酸エチル勾配）により精製して、8-クロロ-3-（6-クロロ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル）イミダゾ[1,5-a]ピラジンを固体として得た。LCMS（方法1）：325/327（M+H）⁺、保持時間1.11分間。

【0970】

同様に、3-（5-ブロモ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル）-8-クロロイミダゾ[1,5-a]ピラジン（固体、融点152～155℃）を5-ブロモ-N-〔（3-クロロピラジン-2-イル）メチル〕-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミドから得ることが可能である。LCMS（方法1）：369/371/373（M+H）⁺；保持時間1.13分間。

10

【0971】

同様に、8-クロロ-3-（3-エチルスルファニル-2-ピリジル）イミダゾ[1,5-a]ピラジン（固体、融点126～128℃）をN-〔（3-クロロピラジン-2-イル）メチル〕-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミドから得ることが可能である。LCMS（方法1）：291/293（M+H）⁺；保持時間0.97分間。

。

【0972】

同様に、1-〔6-（8-クロロイミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル）-5-エチルスルファニル-3-ピリジル〕シクロプロパンカルボニトリルをN-〔（3-クロロピラジン-2-イル）メチル〕-5-（1-シアノシクロプロピル）-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミドから得ることが可能である。LCMS（方法1）：356/358（M+H）⁺；保持時間1.03分間。

20

【0973】

同様に、2-〔6-（8-クロロイミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル）-5-エチルスルファニル-3-ピリジル〕-2-メチル-プロパンニトリルをN-〔（3-クロロピラジン-2-イル）メチル〕-5-（1-シアノ-1-メチル-エチル）-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミドから得ることが可能である。LCMS（方法1）：358/360（M+H）⁺；保持時間1.06分間。

30

【0974】

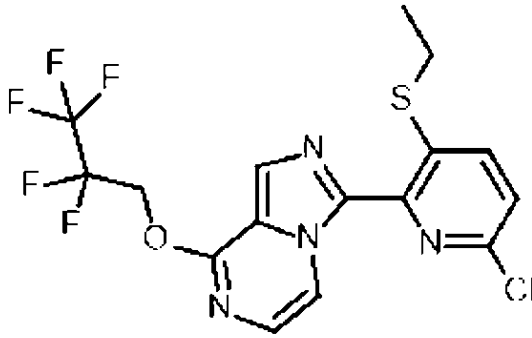
同様に、8-クロロ-3-〔3-エチルスルファニル-5-（2-ピリジルオキシ）-2-ピリジル〕イミダゾ[1,5-a]ピラジンをN-〔（3-クロロピラジン-2-イル）メチル〕-3-エチルスルファニル-5-（2-ピリジルオキシ）ピリジン-2-カルボキサミドから得ることが可能である。LCMS（方法1）：384/386（M+H）⁺；保持時間1.10分間。

【0975】

ステップC：3-（6-クロロ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル）-8-（2,2,3,3-ペンタフルオロプロポキシ）イミダゾ[1,5-a]ピラジン（化合物P1）の調製

40

【化 3 3】



10

2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロパン-1-オール (763 mg、0.507 mol、5.04 mmol) のテトラヒドロフラン (9.7 mL) 中の溶液に 10℃でアルゴン雰囲気下において水素化ナトリウム (194 mg、油中に 60 質量%、4.84 mmol) を数回に分けて添加し、混合物を 10℃で 5 分間攪拌した。この得られた混合物に 10℃で 8-クロロ-3-(6-クロロ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (1.26 g、3.87 mmol) のテトラヒドロフラン (19.4 mL) 中の溶液を滴下し、攪拌を 10℃で 5 分間、次いで室温で 21 時間継続した。反応混合物を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で失活させ、生成物を酢酸エチルで 2 回抽出し、組み合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、3-(6-クロロ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (化合物 P1) をガムとして得た。この材料を、さらなる精製ステップを行うことなく用いた。LCMS (方法 1) : 439 / 441 (M+H)⁺、保持時間 1.11 分間。

20

【0976】

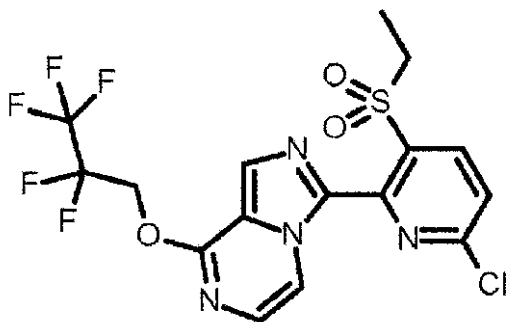
以下の表 P に示されている化合物 P3、P5、P7、P20、P23 及び P24 を、実施例 H1 に記載のものと同様のシーケンスに従って調製した。

【0977】

実施例 H2 : 3-(6-クロロ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (化合物 P2) の調製

30

【化 3 4】



40

化合物P2

3-(6-クロロ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (1.99 g、4.54 mmol) の酢酸エチル (19.9 mL) 中の溶液に 10℃で m-クロロペルオキシ安息香酸 (2.40 g、75 質量%、10.4 mmol) を数回に分けて添加し、混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を約 10% 亜硫酸水素ナトリウム水溶液で希釈し、10 分間攪拌した。飽和炭酸ナトリウム水溶液を添加し、生成物を酢酸エチルで 2 回抽

50

出し、組み合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣を *combiflash* (シクロヘキサン中に 0～30% の酢酸エチル勾配) により精製して、3-(6-クロロ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン(化合物 P2)を固体(融点 140～143℃)として得た。LCMS(方法1): 471/473 (M+H)⁺、保持時間 1.14 分間。

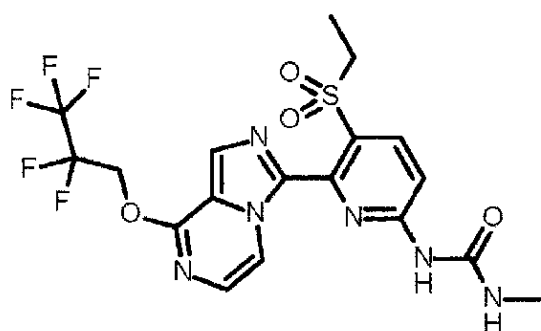
【0978】

以下の表 P に示されている化合物 P4、P6、P8、P15、P16、P19 及び P21 を、実施例 H2 に記載のものと同様のシーケンスに従って調製した。

【0979】

実施例 H3: 1-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-2-ピリジル]-3-メチル尿素(化合物 P9)の調製

【化35】



化合物P9

3-(6-クロロ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン(150mg、0.3186mmol)の1,4-ジオキサン(4.8mL)中の溶液に炭酸セシウム(130mg、0.398mmol)、メチル尿素(28mg、0.382mmol)及びキサントホス(15mg、0.0255mmol)を添加した。混合物をアルゴンで5分間フラッシュし、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)Pd₂(dba)₃(12mg、0.0127mmol)を添加し、混合物を80℃で60分間加熱した。ジオキサン(20mL)で希釈した後、混合物を、ガラスマイクロファイバーフィルタを通してクリアろ過し(clear filtered)、ろ液を減圧中で濃縮した。残渣を *combiflash* (シクロヘキサン中に0～100%の酢酸エチル勾配)により精製して、1-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-2-ピリジル]-3-メチル尿素(化合物 P9)を固体(融点 280～282℃)として得た。LCMS(方法2): 509 (M+H)⁺、保持時間 1.51 分間。

【0980】

以下の表 P に示されている化合物 P14 を、実施例 H3 に記載のものと同様のシーケンスに従って調製した。

【0981】

実施例 H4: 3-[3-エチルスルホニル-6-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)-2-ピリジル]-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン(化合物 P12)の調製

10

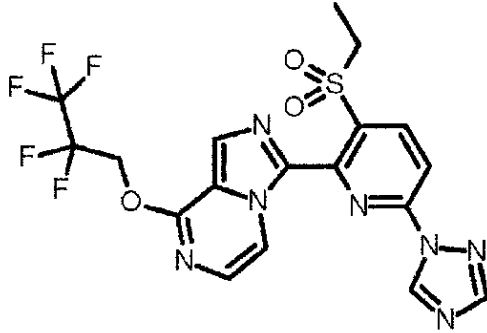
20

30

40

50

【化 3 6】



化合物P12

10

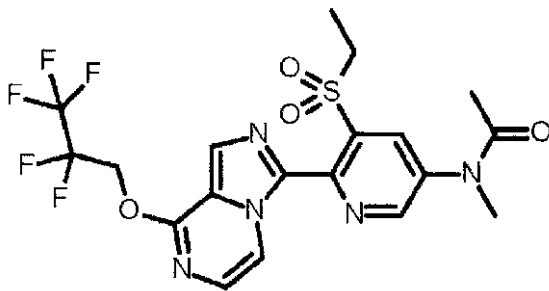
3- (6-クロロ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル) -8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (160mg、0.3398mmol) 及び1H-1, 2, 4-トリアゾール (35mg、0.5098mmol) のピリジン (2.7mL) 中の溶液をアルゴンで5分間フラッシュし、バイアルにキャップをし、反応混合物を120℃で100分間、マイクロ波中に加熱した。反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣をcombiflash (シクロヘキサン中に0~80%の酢酸エチル勾配) により精製して、3- [3-エチルスルホニル-6- (1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) -2-ピリジル] -8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (化合物P12) を固体 (融点207~208℃) として得た。LCMS (方法1) : 504 (M+H)⁺、保持時間1.06分間。

20

【0982】

実施例H5 : N- [5-エチルスルホニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] -3-ピリジル] -N-メチル-アセトアミド (化合物P13) の調製

【化 3 7】



化合物P13

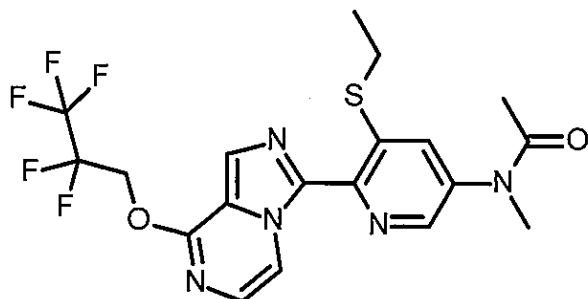
30

ステップA : N- [5-エチルスルファニル-6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] -3-ピリジル] -N-メチル-アセトアミドの調製

40

50

【化 3 8】



10

3-(5-ブロモ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン(391.3mg、0.8098mmol)の1,4-ジオキサン(2.35mL)中の溶液に炭酸セシウム(369.4mg、1.134mmol)、N-メチルアセタミド(179.4mg、0.187mL、2.429mmol)及びキサントホス(65.6mg、0.1134mmol)を添加した。混合物をアルゴンで5分間フラッシュし、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)Pd₂(dba)₃(7mg、0.008mmol)を添加し、バイアルにキャップをし、反応混合物を160℃で1時間、マイクロ波中に加熱した。重炭酸ナトリウム水溶液で希釈した後、生成物を酢酸エチルで2回抽出し、組み合わせた有機層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、N-[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]-N-メチルアセトアミドをガムとして得た。この材料を、さらなる精製ステップを行うことなく用いた。LCMS(方法1): 476(M+H)⁺、保持時間1.09分間。

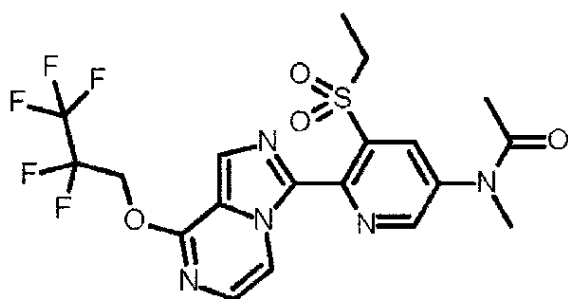
20

【0983】

ステップB: N-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]-N-メチルアセトアミド(化合物P13)の調製

30

【化 3 9】



化合物P13

40

N-[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]-N-メチルアセトアミド(1.172mmol)の酢酸エチル(5.6mL)中の溶液に10℃でメタクロロ過安息香酸(620.4mg、75質量%、2.696mmol)を数回に分けて添加し、混合物を室温で2時間攪拌した。反応混合物を約10%亜硫酸水素ナトリウム水溶液で希釈し、10分間攪拌した。飽和炭酸ナトリウム水溶液を添加し、生成物を酢酸エチルで2回抽出し、組み合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣をcombiflash(シクロヘキサン中に20~100%の酢酸エチル勾配)により精製して、N-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]-N-メチルアセトアミドを得た。

50

3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] -3-ピリジル] -N-メチル-アセトアミド (化合物 P 13) を固体 (融点 169~173℃) として得た。

LCMS (方法 1) : 508 (M+H)⁺、保持時間 1.01 分間。

【0984】

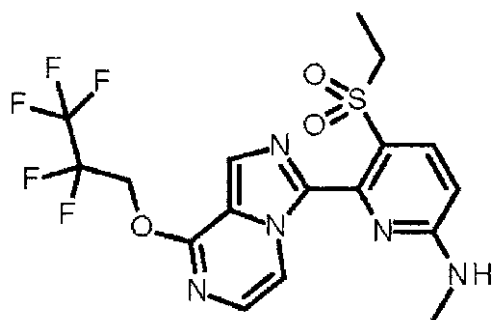
同様に、N-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] -2-ピリジル] -N-メチル-アセトアミド (化合物 P 11) (固体、融点 100~102℃) を 3-(6-クロロ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル) -8-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (化合物 P 2) から、実施例 H 5、ステップ A に記載のものと同様の手法に従って得ることが可能である。LCMS (方法 1) : 508 (M+H)⁺ ; 保持時間 1.03 分間。

10

【0985】

実施例 H 6 : 5-エチルスルホニル-N-メチル-6-[8-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] ピリジン-2-アミン (化合物 P 10) の調製

【化 40】



20

化合物P10

3-(6-クロロ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル) -8-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (200mg、0.4248mmol) のテトラヒドロフラン (4.3mL) 中の溶液にメチルアミン水溶液 (41%、0.652mL、8.496mmol) を添加し、反応混合物をマイクロ波中において 120℃ で 20 分間加熱した。清透で無色の溶液を減圧中で濃縮し、残渣を酢酸エチル中に溶解し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、乾燥するまで減圧下で濃縮して、5-エチルスルホニル-N-メチル-6-[8-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] ピリジン-2-アミン (化合物 P 10) を白色の固体 (融点 178~180℃) として得た。LCMS (方法 1) : 466 (M+H)⁺、保持時間 1.03 分間。

30

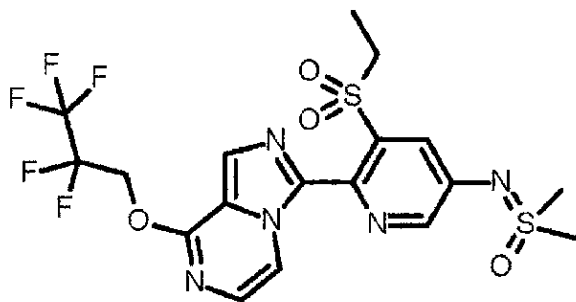
【0986】

実施例 H 7 : [5-エチルスルホニル-6-[8-(2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] -3-ピリジル] イミノ-ジメチル-オキソ-λ⁶-スルファン (化合物 P 18) の調製

40

50

【化 4 1】

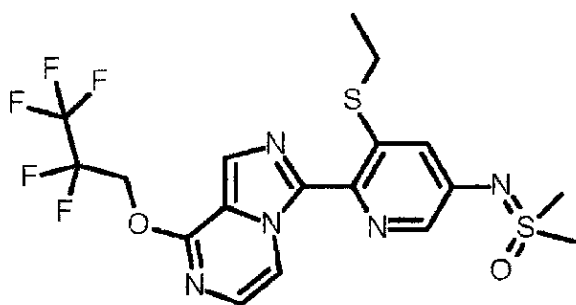


化合物P18

10

ステップ A : [5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]イミノ-ジメチル-オキソ-λ⁶-スルファン (化合物 P 17) の調製

【化 4 2】



化合物P17

20

3-(5-ブromo-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン (200 mg、0.414 mmol) の 1,4-ジオキサン (5 mL) 中の溶液に炭酸セシウム (202 mg、0.621 mmol)、イミノ-ジメチル-オキソ-λ⁶-スルファン (46 mg、0.497 mmol) 及びキサントホス (34 mg、0.058 mmol) を添加した。混合物をアルゴンで5分間フラッシュし、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0) Pd₂(dba)₃ (4 mg、0.004 mmol) を添加し、バイアルにキャップをし、反応混合物を 110℃ で 30 分間、マイクロ波中に加熱した。反応混合物を H Y F L O でろ過し、ろ液を減圧下で蒸発させた。残渣をシリカゲルによる Combiflash (酢酸エチル中のメタノール勾配) により精製して、[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]イミノ-ジメチル-オキソ-λ⁶-スルファン (化合物 P 17) を固体 (融点 188~190℃) として得た。LCMS (方法 1) : 496 (M+H)⁺、保持時間 1.03 分間。

30

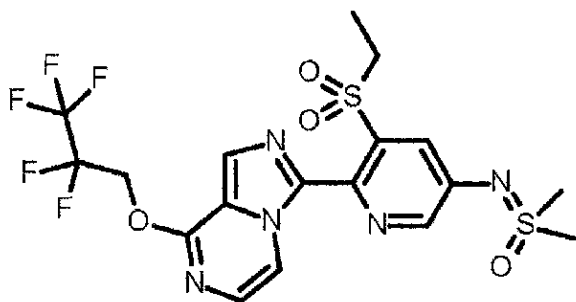
【0987】

40

ステップ B : [5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]イミノ-ジメチル-オキソ-λ⁶-スルファン (化合物 P 18) の調製

50

【化 4 3】



化合物P18

10

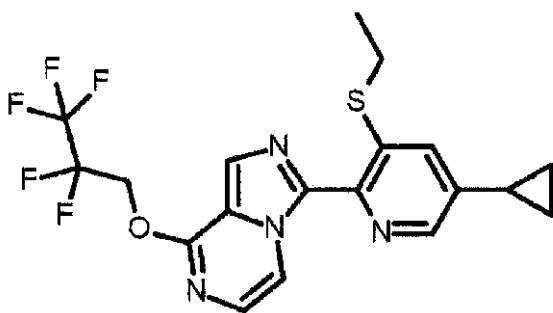
〔5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル〕イミノージメチル-オキソ-λ⁶-スルファン (181 mg、0.365 mmol) のジクロロメタン (3.6 mL) 中の溶液に 0℃ でメタクロロ過安息香酸 (172 mg、75 質量%、0.749 mmol) を 15 分間かけて 2 回に分けて添加し、混合物を室温で一晩攪拌した。反応混合物を tert-ブチルメチルエーテルで希釈し、有機層を約 10% 亜硫酸水素ナトリウム水溶液で 3 回、次いで炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣を combiflash (シクロヘキサン中の酢酸エチル勾配) により精製して、〔5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル〕イミノージメチル-オキソ-λ⁶-スルファン (化合物 P18) を固体 (融点 199~201℃) として得た。LCMS (方法 1): 528 (M+H)⁺、保持時間 1.00 分間。

20

【0988】

実施例 H8: 3-(5-シクロプロピル-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン (化合物 P22) の調製

【化 4 4】



化合物P22

30

3-(5-ブromo-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン (250 mg、0.517 mmol) のトルエン (1.6 mL) 中の溶液に水 (0.05 mL)、シクロプロピルボロン酸 (133 mg、1.552 mmol) 及びリン酸三カリウム (659 mg、3.104 mmol) を添加した。混合物をアルゴンで 5 分間フラッシュし、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (0) Pd(PPh₃)₄ (60 mg、0.052 mmol) を添加し、バイアルにキャップをし、反応混合物を 120℃ で 40 分間、マイクロ波中に加熱した。反応混合物を酢酸エチル及び水で希釈し、有機層を水及び塩水で洗浄し、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、減圧下で濃縮した。残渣を combiflash (シクロヘキサン中の酢酸エチル勾配) により精製して、3-(5-シクロプロピル-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン (化合物 P22) を固体 (融点 199~201℃) として得た。LCMS (方法 1): 528 (M+H)⁺、保持時間 1.00 分間。

40

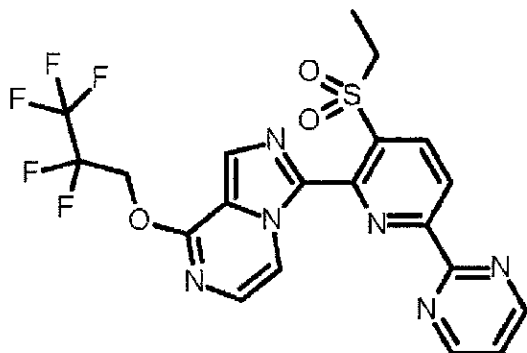
50

3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (化合物 P 2 2) を固体 (融点 94 ~ 96 °C) として得た。LCMS (方法 1) : 445 (M+H)⁺、保持時間 1.27 分間。

【0989】

実施例 H 9 : 3- (3-エチルスルホニル-6-ピリミジン-2-イル-2-ピリジル) -8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (化合物 P 2 5) の調製

【化 4 5】



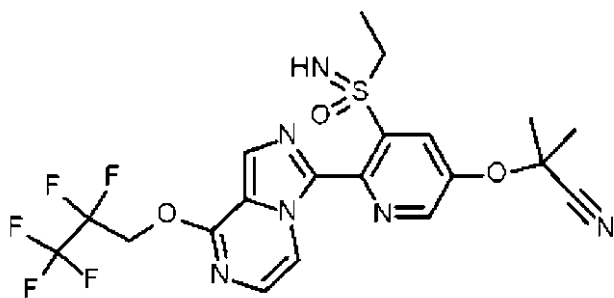
化合物P25

3- (6-クロロ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル) -8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (120 mg、0.255 mmol) のジメチルホルムアミド (1.5 mL) 中の溶液をアルゴンで5分間フラッシュし、次いでトリブチル (ピリミジン-2-イル) スタナン (0.121 mL、0.382 mmol) 及びビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) ジクロリド Pd (PPh₃)₂Cl₂ (18 mg、0.025 mmol) を添加した。バイアルにキャップをし、反応混合物を170 °Cで40分間、マイクロ波中に加熱した。混合物をn-ヘキサンで失活させ、10分間攪拌し、傾瀉し、n-ヘキサン層を慎重に廃棄した (手法を3回反復した)。油状の残渣を酢酸エチル中に溶解し、溶液をガラスマイクロファイバーフィルタでろ過し、ろ液を減圧下で濃縮した。粗生成物を combiflash (シクロヘキサン中の酢酸エチル勾配) により精製して、3- (3-エチルスルホニル-6-ピリミジン-2-イル-2-ピリジル) -8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン (化合物 P 2 5) を白色の固体 (融点 164 ~ 166 °C) として得た。LCMS (方法 1) : 515 (M+H)⁺、保持時間 1.05 分間。

【0990】

実施例 H 10 : 2- [[5- (エチルスルホニイミドイル) -6- [8- (2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロポキシ) イミダゾ [1, 5-a] ピラジン-3-イル] -3-ピリジル] オキシ] -2-メチル-プロパンニトリル (化合物 P 5 2) の調製

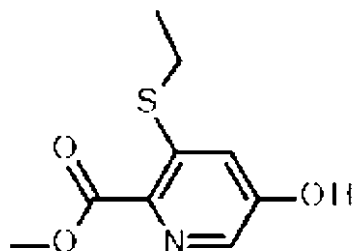
【化 4 6】



(P52)

ステップ1：メチル3-エチルスルファニル-5-ヒドロキシ-ピリジン-2-カルボキシレートの調製

【化47】



10

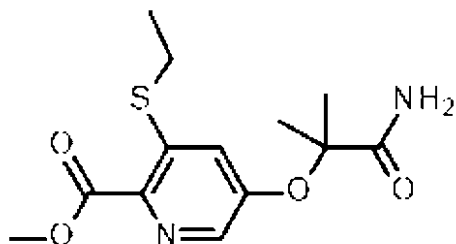
メチル5-ブロモ-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレート（国際公開第2016/026848号に記載のとおり調製した）（10.0 g、36.21 mmol）のアセトニトリル（72 mL）中の溶液に炭酸セシウム（25.96 g、79.67 mmol）及び（E）-ベンズアルデヒドオキシム（5.7 g、47.08 mmol）を添加し、懸濁液を80℃に一晩加熱した。溶剤を減圧中で蒸発させ、残渣を酢酸エチル及び水で溶解した。分離した水性層を1 M水性塩酸で酸性化し、酢酸エチルで抽出し（3回）、ジクロロメタンで1回抽出した。組み合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィ（ジクロロメタン中に勾配0～10%のメタノール）により精製して、メチル3-エチルスルファニル-5-ヒドロキシ-ピリジン-2-カルボキシレートを得た。LCMS（方法1）：m/z 214 [M+H]⁺；保持時間：0.68分間。

20

【0991】

ステップ2：メチル5-（2-アミノ-1,1-ジメチル-2-オキソ-エトキシ）-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレートの調製

【化48】



30

メチル3-エチルスルファニル-5-ヒドロキシ-ピリジン-2-カルボキシレート（2.5 g、11.72 mmol）のアセトニトリル（59 mL）中の溶液に炭酸セシウム（5.7 g、17.49 mmol）を添加し、5分間後に2-ブロモ-2-メチル-プロパンアミド（3.1 g、18.67 mmol）を添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌し、水及び酢酸エチルに注ぎ入れた。分離した水性層を酢酸エチルで抽出し（3回）、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、蒸発させて粗メチル5-（2-アミノ-1,1-ジメチル-2-オキソ-エトキシ）-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレートを得た。この材料を、さらなる精製を行うことなく次のステップに用いた。LCMS（方法1）：m/z 299 [M+H]⁺；保持時間：0.71分間。

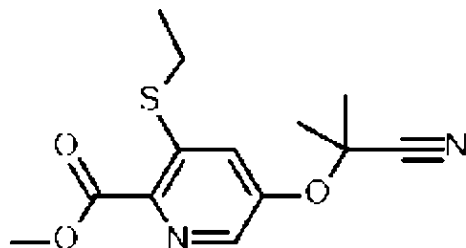
40

【0992】

ステップ3：メチル5-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレートの調製

50

【化 4 9】

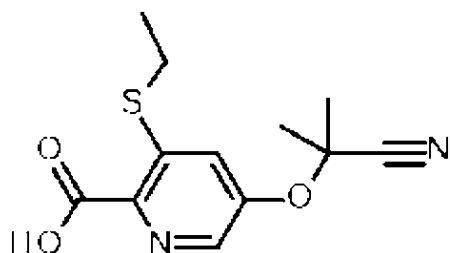


粗メチル 5 - (2 - アミノ - 1 , 1 - ジメチル - 2 - オキソ - エトキシ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレート (4 . 1 8 g 、 1 4 . 0 m m o l) 及びトリエチルアミン (5 . 7 3 g 、 7 . 8 9 m l 、 5 6 . 0 m m o l) のジクロロメタン (1 4 0 m l) 中の混合物に 0 ° C でトリフルオロ酢酸無水物 (8 . 9 2 g 、 5 . 9 0 m l 、 4 2 . 0 m m o l) を滴下した。得られる懸濁液を室温で 2 時間攪拌した。反応混合物をメタノールで、次いで炭酸水素ナトリウム水溶液で慎重に失活させた。水性層をジクロロメタンで 2 回抽出し、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、蒸発させた。残渣を c o m b i f l a s h (シクロヘキサン中に 0 ~ 4 5 % の酢酸エチル勾配) により精製して、メチル 5 - (1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレートを得た。LCMS (方法 1) : m / z 2 8 1 [M + H] ⁺ ; 保持時間 : 0 . 9 0 分間。¹H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) δ p p m 1 . 4 3 (t , J = 7 . 4 0 H z , 3 H) , 1 . 8 0 (s , 6 H) , 2 . 9 5 (q , J = 7 . 4 0 H z , 2 H) , 3 . 9 9 (s , 3 H) , 7 . 5 8 (d , J = 2 . 3 2 H z , 1 H) , 8 . 2 2 (d , J = 2 . 3 2 H z , 1 H) .

【 0 9 9 3 】

ステップ 4 : 5 - (1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボン酸の調製

【化 5 0】

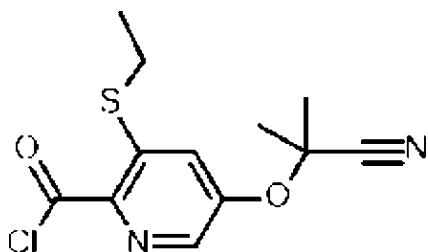


メチル 5 - (1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレート (6 . 0 g 、 2 1 . 4 1 m m o l) のテトラヒドロフラン (6 0 m l) 中の溶液に水酸化リチウム水和物 (1 . 8 g 、 4 2 . 8 1 m m o l) 及び水 (1 0 m l) を添加した。反応混合物を室温で完了するまで攪拌し (T L C で監視) 、次いで減圧下で濃縮した。残渣を水 (1 0 0 m l) で希釈し、2 N の塩酸水溶液で酸性化し、水性相を酢酸エチルで抽出した (1 0 0 m l で 3 回) 。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、減圧中で濃縮した。粗生成物を n - ペンタン (5 0 m l) で 2 回洗浄し、ろ過し、乾燥するまで蒸発させて、5 - (1 - シアノ - 1 - メチル - エトキシ) - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボン酸を固体として得た。LCMS (方法 3) : m / z 2 6 7 [M + H] ⁺ 及び m / z 2 6 5 [M - H] ⁻ ; 保持時間 : 0 . 8 2 分間。¹H NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d ₆) δ p p m 1 . 2 7 (t , J = 7 . 2 1 H z , 3 H) , 1 . 7 8 (s , 6 H) , 2 . 9 7 (q , J = 7 . 2 1 H z , 2 H) , 7 . 5 8 (d , J = 2 . 3 2 H z , 1 H) , 8 . 2 4 (d , J = 2 . 3 2 H z , 1 H) .

【0994】

ステップ5：5-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-塩化カルボニルの調製

【化51】



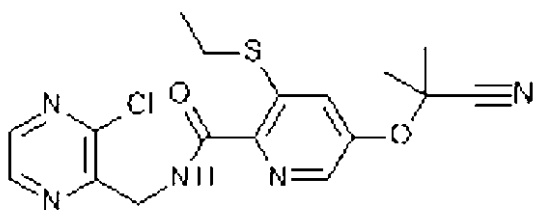
10

5-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボン酸（771 mg、2.90 mmol）及びN,N-ジメチルホルムアミド（1滴）のテトラヒドロフラン（19 mL）中の溶液に0～5℃で塩化オキサリル（0.328 mL、3.76 mmol）を添加し、混合物を室温で2時間攪拌した。溶液を減圧下で濃縮し、テトラヒドロフランで2回希釈し、乾燥するまで蒸発させた。ジメチルアミンで失活させたアリコートのLCMSデータは、5-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-3-エチルスルファニル-N,N-ジメチル-ピリジン-2-カルボキサミド（C₁₄H₁₉N₃O₂S、293.38）と一致していた：LCMS（方法1）：m/z 294 [M+H]⁺；保持時間：0.83分間。

20

【0995】

ステップ6：N-〔（3-クロロピラジン-2-イル）メチル〕-5-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミドの調製
【化52】



30

（3-クロロピラジン-2-イル）メタンアミンヒドロクロリド（0.548 g、3.05 mmol；CAS 939412-86-9）のテトラヒドロフラン（12 mL）中の溶液に室温で4-（ジメチルアミノ）ピリジン（3.5 mg、0.029 mmol）及びトリエチルアミン（1.01 mL、7.25 mmol）を滴下した。5-（1-シアノ-1-メチル-エトキシ）-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-塩化カルボニル（0.826 g、2.90 mmol）のテトラヒドロフラン（12 mL）中の溶液を冷却しながらさらに滴下した。反応混合物を室温で1時間攪拌した。次いで、これを飽和重炭酸ナトリウム水溶液でゆっくりと希釈し、酢酸エチルで2回抽出した。組み合わせた有機層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。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おける酢酸エチル勾配）による粗材料の精製で所望の生成物（0.469 g）を得た。LCMS（方法1）：m/z 392/394 [M+H]⁺；保持時間：1.01分間。

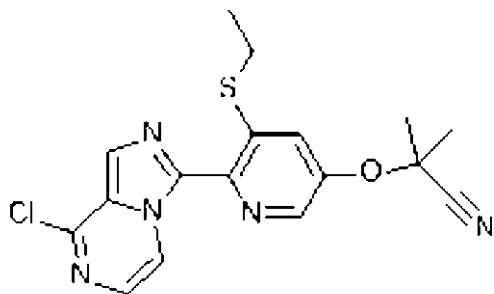
40

【0996】

ステップ7：2-〔〔6-（8-クロロイミダゾ〔1,5-a〕ピラジン-3-イル）-5-エチルスルファニル-3-ピリジル〕オキシ〕-2-メチル-プロパンニトリルの調製

50

【化 5 3】



10

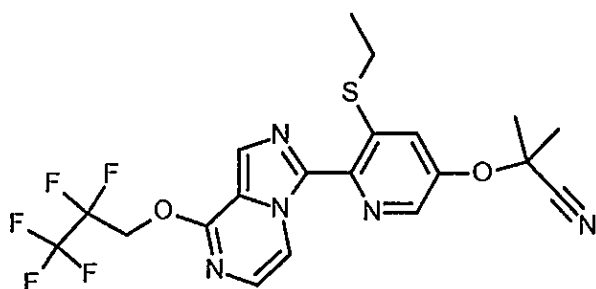
N-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-5-(1-シアノ-1-メチル-エトキシ)-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキサミド(上記のとおり調製した; 0.454 g、1.15 mmol)のトルエン(4.5 mL)中の溶液にオキシ塩化リン(V)(0.648 mL、6.95 mmol)を室温で添加した。反応混合物を100℃に加熱し、一晚攪拌した。室温に冷却した後、これを酢酸エチルで希釈し、冷たい飽和水酸化ナトリウム水溶液にゆっくりと添加し、1時間攪拌した。次いで、反応混合物を酢酸エチルで2回抽出し、組み合わせた有機層を飽和水酸化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。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おける酢酸エチル勾配)による粗材料の精製で所望の生成物(0.350 g)を得た。LCMS(方法1): m/z 374/376 [M+H]⁺; 保持時間: 1.11 分間。

20

【0997】

ステップ8: 2-[[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペントフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル(化合物P50)の調製

【化 5 4】



(P50)

30

2-[[6-(8-クロロイミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル)-5-エチルスルファニル-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル(上記のとおり調製した; 0.336 g、0.899 mmol)のアセトニトリル(4 mL)中の溶液に2,2,3,3,3-ペントフルオロ-1-プロパノール(0.109 mL、1.08 mmol)及び炭酸カリウム(0.149 g、1.08 mmol)を室温で添加した。反応混合物を50℃に加熱し、1日攪拌した。完全な転換を達成するために、追加の2,2,3,3,3-ペントフルオロ-1-プロパノール(0.080 mL、0.79 mmol)及び炭酸カリウム(0.100 g、0.72 mmol)を添加し、50℃でさらに2日間攪拌を継続した。室温に冷却した後、反応混合物をろ過し、減圧下で溶剤を除去し、残渣を酢酸エチルで希釈した。有機層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で2回洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。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おける酢酸エチル勾配)による粗材料の精製で所望の生成物を白色の固体(0.389 g)として得た。LCMS(方法1): m/z 488 [M+

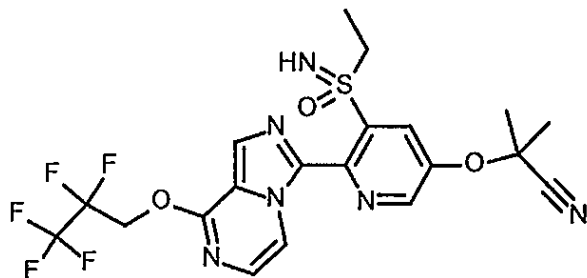
40

50

H]⁺; 保持時間: 1.25 分間。

【0998】

ステップ9: 2-[[5-(エチルスルホンイミドイル)-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル (表題の化合物 P52) の調製
【化55】



(P52)

10

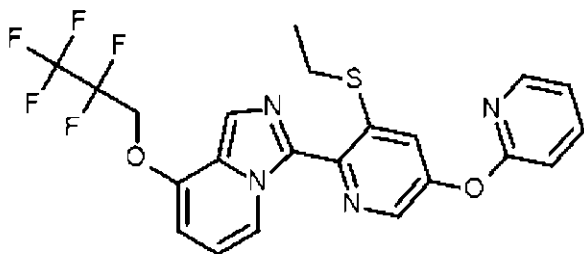
2-[[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル (上記のとおり調製した化合物 P50; 77 mg、0.16 mmol)、(ジアセトキシヨード)ベンゼン (0.13 g、0.39 mmol) 及びアンモニウムカルバメート (25 mg、0.32 mmol) を、磁気攪拌機を備えるフラスコに仕込んだ。この混合物にメタノール (1.15 mL) を室温で滴下し、次いで反応塊を室温で 2.5 時間攪拌した。Isolute を添加した後、揮発物を減圧下で除去した。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おける酢酸エチル勾配) による粗材料の精製で所望の生成物を白色の固体 (45 mg) (融点 121~123 °C) として得た。LCMS (方法1): m/z 519 [M+H]⁺; 保持時間: 1.06 分間。

20

【0999】

実施例 H11: 3-[3-エチルスルファニル-5-(2-ピリジルオキシ)-2-ピリジル]-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン (化合物 P32) の調製
【化56】

30



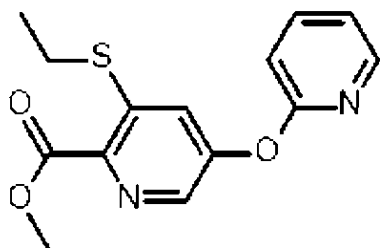
(P32)

40

ステップ1: メチル 3-エチルスルファニル-5-(2-ピリジルオキシ)ピリジン-2-カルボキシレートの調製

50

【化 5 7】

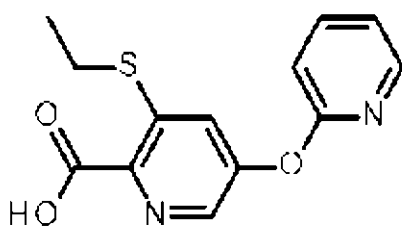


メチル 3-エチルスルファニル-5-ヒドロキシ-ピリジン-2-カルボキシレート（上記のとおり調製した；2.00 g、9.4 mmol）、炭酸カリウム（2.6 g、19 mmol）、2-ヨードピリジン（1.5 mL、14.0 mmol）及びヨウ化銅（0.187 g、0.94 mmol）のN，N-ジメチルホルムアミド（20 mL）中の混合物を110℃で6時間撹拌した。反応混合物を水性2 M塩酸（50 mL）で中和し、水（50 mL）で希釈し、酢酸エチルで抽出した（50 mLで3回）。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、メチル 3-エチルスルファニル-5-（2-ピリジルオキシ）ピリジン-2-カルボキシレートを得た。この材料を、さらなる精製を行うことなく次のステップに用いた。LCMS（方法4）： m/z 291 [M+H]⁺；保持時間：1.37分間。¹H NMR（400 MHz，CDCl₃） δ /ppm：1.38（t，3H），2.87（q，2H），3.98（s，3H），7.03（d，1H），7.10（m，1H），7.52（d，J=2.3 Hz，1H），7.77（m，1H），8.16（m，1H），8.29（d，J=2.3 Hz，1H）。

【1000】

ステップ2：3-エチルスルファニル-5-（2-ピリジルオキシ）ピリジン-2-カルボン酸の調製

【化 5 8】



メチル 3-エチルスルファニル-5-（2-ピリジルオキシ）ピリジン-2-カルボキシレート（上記のとおり調製した；0.900 g、3.10 mmol）のテトラヒドロフラン（10 mL）中の溶液に水酸化リチウム-水和物（0.0951 g、4.65 mmol）及び水（2 mL）を添加した。反応混合物を室温で2時間撹拌し、次いで水性2 M塩酸（25 mL）で酸性化し、酢酸エチルで抽出した（25 mLで3回）。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、3-エチルスルファニル-5-（2-ピリジルオキシ）ピリジン-2-カルボン酸を固体として得た。LCMS（方法4）： m/z 277 [M+H]⁺；保持時間：1.26分間。

【1001】

ステップ3：3-エチルスルファニル-5-（2-ピリジルオキシ）ピリジン-2-塩化カルボニルの調製

10

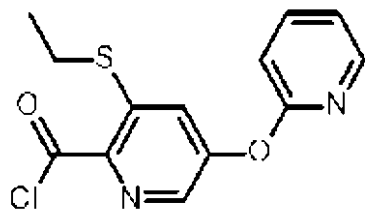
20

30

40

50

【化 5 9】



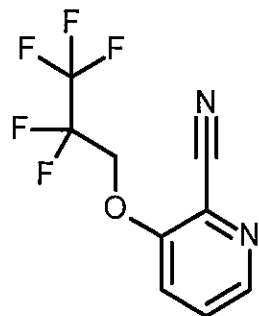
3-エチルスルファニル-5-(2-ピリジルオキシ)ピリジン-2-カルボン酸(上記のとおり調製した; 0.50 g、1.8 mmol)のテトラヒドロフラン(10 mL)中の溶液にアルゴン雰囲気下で1滴のN,N-ジメチルホルムアミド及び塩化オキサリル(0.21 mL、2.4 mmol)を滴下した。反応混合物を室温で2時間攪拌し、次いで減圧下で濃縮して、定量的に所望の生成物を油として得た。この材料を、さらなる精製を行うことなく次のステップに用いた。

10

【1002】

ステップ4: 3-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)ピリジン-2-カルボニトリルの調製

【化 6 0】



20

2-シアノ-3-フルオロピリジン(10.0 g、77.8 mmol; CAS 97509-75-6)のアセトニトリル(120 mL)中の溶液に2,2,3,3,3-ペンタフルオロ-1-プロパノール(9.40 mL、93.4 mmol)及び炭酸カリウム(12.9 g、93.4 mmol)を室温で添加した。反応混合物を50℃に加熱し、5時間攪拌した。室温に冷却した後、反応混合物をろ過し、減圧下で溶剤を除去し、残渣を酢酸エチルで希釈した。有機層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で2回洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、所望の生成物を白色の固体(19.5 g)として得た。この材料を、さらなる精製を行うことなく次のステップに用いた。LCMS(方法1): m/z 253 [M+H]⁺; 保持時間: 0.91分間。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 4.63 (m, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.56 (m, 1H) 8.45 (m, 1H)。

30

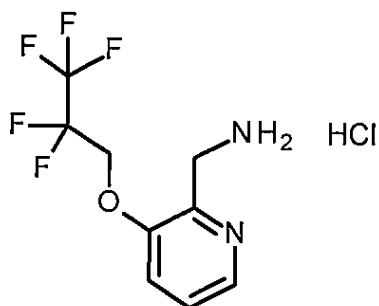
【1003】

ステップ5: [3-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)-2-ピリジル]メタンアミンヒドロクロリドの調製

40

50

【化 6 1】



10

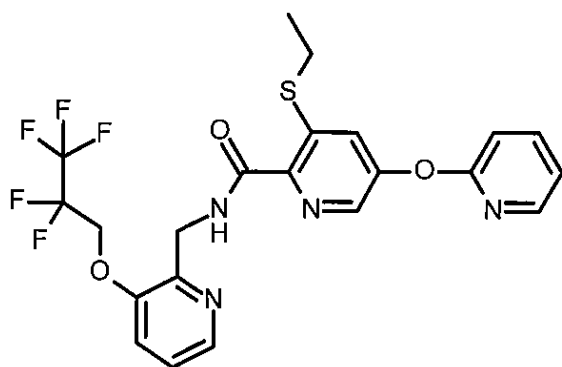
3-((2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)ピリジン-2-カルボニトリル (上記のとおり調製した; 19.5 g、77.3 mmol) のメタノール (195 mL) 中の溶液にアルゴン雰囲気下でパラジウム (活性化、炭素上に10%、2.47 g) を添加し、反応混合物を水素雰囲気下で2日間攪拌した。混合物を、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧下で濃縮した。得られる油をジエチルエーテルで希釈し、塩酸 (ジオキサン中に4 N、23.2 mL、92.8 mmol) を冷却下で添加し、懸濁液を15分間攪拌した。沈殿物をろ過し、ジエチルエーテルで洗浄し、減圧下で乾燥させて、所望の生成物を白色の固体 (19.15 g) として得た。この材料を、さらなる精製を行うことなく次のステップに用いた。LCMS (方法1): m/z 257 $[M+H]^+$; 保持時間: 0.51 分間の遊離塩基。

20

【1004】

ステップ6: 3-エチルスルファニル-N-[[3-((2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)-2-ピリジル)メチル]-5-(2-ピリジルオキシ)ピリジン-2-カルボキサミドの調製

【化 6 2】



30

[[3-((2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)-2-ピリジル)メタンアミンヒドロクロリド (ステップ5において上記のとおり調製した; 0.53 g、1.8 mmol) のテトラヒドロフラン (7.3 mL) 中の溶液に室温で4-(ジメチルアミノ)ピリジン (2.2 mg、0.018 mmol) 及びトリエチルアミン (0.88 mL、6.3 mmol) を滴下した。3-エチルスルファニル-5-(2-ピリジルオキシ)ピリジン-2-塩化カルボニル (ステップ3において上記のとおり調製した; 0.53 g、1.8 mmol) のテトラヒドロフラン (7.3 mL) 中の溶液を冷却下でさらに滴下した。反応混合物を室温で2時間攪拌し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液でゆっくりと希釈し、酢酸エチルで2回抽出した。組み合わせた有機層を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。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おける酢酸エチル勾配) による粗材料の精製で所望の生成物 (0.25 g) を得た。LCMS (方法1): m/z 515 $[M+H]^+$;

40

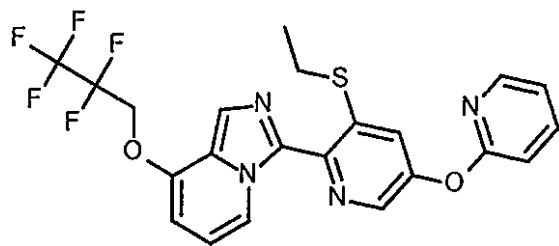
50

保持時間：1.13分間。

【1005】

ステップ7：3-[3-エチルスルファニル-5-(2-ピリジルオキシ)-2-ピリジル]-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン(表題の化合物P32)の調製

【化63】



(P32)

3-エチルスルファニル-N-[[3-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)-2-ピリジル]メチル]-5-(2-ピリジルオキシ)ピリジン-2-カルボキサミド(上記のとおり調製した; 0.23g、0.45mmol)のトルエン(2.3mL)中の溶液にオキシ塩化リン(V)(0.42mL、4.5mmol)を室温で添加した。反応混合物を100℃に加熱し、18時間撹拌した。室温に冷却した後、これを酢酸エチルで希釈し、飽和水酸化ナトリウム水溶液を10℃でゆっくりと添加した。次いで、反応混合物を酢酸エチルで2回抽出し、組み合わせた有機層を飽和水酸化ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。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おける酢酸エチル勾配)による粗材料の精製で所望の生成物(0.15g)を固体として得た。LCMS(方法1): m/z 497 $[M+H]^+$; 保持時間: 1.19分間。

【1006】

【表 13-1】

表P:式(I)の化合物の例

No.	IUPAC名	構造	LCMS			Mp (°C)
			R _t (min)	[M+H] ⁺ (実測値)	方法	
P1	3-(6-クロロ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.11	439/441	1	-
P2	3-(6-クロロ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.14	471/473	1	140 - 143
P3	3-(5-ブロモ-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.29	483/485	1	-
P4	3-(5-ブロモ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.17	515/517	1	146 - 148
P5	3-(3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.07	387	1	90 - 91
P6	3-(3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		0.97	419	1	-
P7	3-(3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.16	405	1	101 - 104
P8	3-(3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.06	437	1	105 - 106

【表 13-2】

P9	1-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-2-ピリジル]-3-メチル-尿素		1.51	509	2	280 - 282
P10	5-エチルスルホニル-N-メチル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]ピリジン-2-アミン		1.03	466	1	178 - 180
P11	N-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-2-ピリジル]-N-メチル-アセトアミド		1.03	508	1	100 - 102
P12	3-[3-エチルスルホニル-6-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)-2-ピリジル]-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.06	504	1	207 - 208
P13	N-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]-N-メチル-アセトアミド		1.01	508	1	169 - 173
P14	1-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-2-ピリジル]-1,3-ジメチル-尿素		1.01	523	1	203 - 204
P15	1-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.10	502	1	184 - 186
P16	2-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]-2-メチル-プロパンニトリル		1.12	504	1	

10

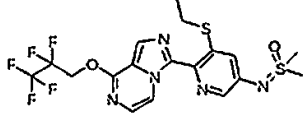
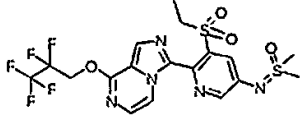
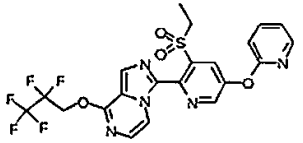
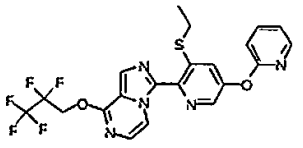
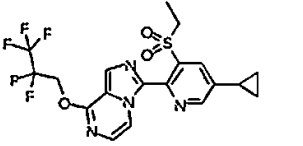
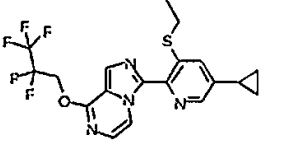
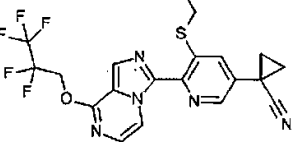
20

30

40

50

【表 13-3】

P17	[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]イミノ-ジメチル-オキソ-λ ⁶ -スルファン		1.03	496	1	188 - 190
P18	[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]イミノ-ジメチル-オキソ-λ ⁶ -スルファン		1.00	528	1	199 - 201
P19	3-[3-エチルスルホニル-5-(2-ピリジルオキシ)-2-ピリジル]-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.17	530	1	167 - 175
P20	3-[3-エチルスルファニル-5-(2-ピリジルオキシ)-2-ピリジル]-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.26	498	1	
P21	3-(5-シクロプロピル-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.15	477	1	135 - 137
P22	3-(5-シクロプロピル-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン		1.27	445	1	94 - 96
P23	1-[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.20	470	1	

10

20

30

40

50

【表 13 - 4】

P24	2-[5-エチルスルファニ ル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペン タフルオロプロポキシ) イミダゾ[1,5-a]ピラジン -3-イル]-3-ピリジル]- 2-メチル-プロパンニトリ ル		1.22	472	1	
P25	3-(3-エチルスルホニル -6-ピリミジン-2-イル- 2-ピリジル)-8- (2,2,3,3,3-ペンタフルオ ロプロポキシ)イミダゾ [1,5-a]ピラジン		1.05	515	1	164 - 166
P26	3-(3-エチルスルファニ ル-2-ピリジル)-8- (2,2,3,3,3-ペンタフルオ ロプロポキシ)イミダゾ [1,5-a]ピリジン		1.12	404	1	
P27	3-(3-エチルスルホニル -2-ピリジル)-8- (2,2,3,3,3-ペンタフルオ ロプロポキシ)イミダゾ [1,5-a]ピリジン		1.05	437	1	145 - 149
P28	2-[5-エチルスルホニル -6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタ フルオロプロポキシ)イミ ダゾ[1,5-a]ピリジン-3- イル]-3-ピリジル]-2-メ チル-プロパンニトリル		1.11	504	1	
P29	3-(6-クロロ-3-エチルス ルファニル-2-ピリジ ル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタ フルオロプロポキシ)イミ ダゾ[1,5-a]ピリジン		1.22	438	1	
P30	3-(6-クロロ-3-エチルス ルホニル-2-ピリジル)- 8-(2,2,3,3,3-ペンタフル オロプロポキシ)イミダゾ [1,5-a]ピリジン		1.14	470	1	188 - 189
P31	5-エチルスルホニル- N-メチル-6-[8- (2,2,3,3,3-ペンタフルオ ロプロポキシ)イミダゾ [1,5-a]ピリジン-3-イル] ピリジン-2-アミン		1.02	465	1	209 - 211

10

20

30

40

50

【表 13-5】

P32	3-[3-エチルスルファニル-5-(2-ピリジルオキシ)-2-ピリジル]-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン		1.19	497	1	
P33	3-[3-エチルスルホニル-6-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)-2-ピリジル]-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン		1.04	503	1	241 - 242
P34	3-(5-ブromo-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン		1.27	482	1	
P35	1-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.09	501	1	
P36	3-[3-エチルスルホニル-5-(2-ピリジルオキシ)-2-ピリジル]-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン		1.14	529	1	136 - 143
P37	N-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]-N-メチル-アセトアミド		1.03	507	1	144 - 146
P38	N-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-2-ピリジル]-N-メチル-シクロプロパンカルボキサミド		1.10	533	1	152 - 154
P39	N-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]-N-メチル-アセトアミド		1.00	507	1	

10

20

30

40

50

【表 13 - 6】

P40	3-(5-シクロプロピル-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン		1.14	476	1	
P41	N-[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]-N-メチル-アセトアミド		1.06	476	1	141 - 148
P42	3-(5-シクロプロピル-3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン		1.21	445	1	
P43	3-(5-ブロモ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン		1.17	514	1	
P44	[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]イミノ-N-ジメチル-オキソ-λ ⁶ -スルファン		0.97	496	1	
P45	[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]イミノ-N-ジメチル-オキソ-λ ⁶ -スルファン		0.96	527	1	
P46	2-[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]-2-メチル-プロパンニトリル		1.19	471	1	
P47	2-[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]オキシ-2-メチル-プロパンニトリル		1.13	519	1	

10

20

30

40

50

【表 13-7】

P48	2-[[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		1.20	487	1	
P49	2-[[5-(エチルスルホンイミドイル)-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		1.04	518	1	
P50	2-[[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		1.25	488	1	
P51	2-[[5-エチルスルホニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		1.15	520	1	110 - 116
P52	2-[[5-(エチルスルホンイミドイル)-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピラジン-3-イル]-3-ピリジル]オキシ]-2-メチル-プロパンニトリル		1.06	519	1	121 - 123
P53	1-[5-エチルスルファニル-6-[8-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-イル]-3-ピリジル]シクロプロパンカルボニトリル		1.16	469	1	

10

20

30

40

【1007】

本発明に係る組成物の活性は、他の殺虫的に、殺ダニ的に、且つ／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、他の殺虫的に、殺ダニ的に、且つ／又は殺真菌的に活性な成分との混合物は、より広い意味において、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、それらの貯蔵中若しくはそれらの使用中におけるより良好な挙動がある。

【1008】

50

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、ピレスロイド、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。

【1009】

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、「本発明の表A-1～A-93、AA-1～AA-81、AB-1～AB-93及びAC-1～AC-81、並びに表B-1～B-66、BB-1～BB-54、BC-1～BC-66及びBD-1～BD-54、並びに表Pに記載される化合物からなる群から選択される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／ケミカルアブストラクト名）（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 -シペルメトリン（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）+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、ビナパクリル（907）+TX、プロフェンバレート（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、プロロフェジン（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、カーボノレート（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、クロルフェナビル（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、クロルフェンピンホス（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）+TX、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

10

20

30

40

50

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、ジメホックス (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、ハルフェンプロックス (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ツ名) (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) + 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、ミバホックス (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 (567) + TX、NC-184 (化合物コード) + TX、NC-512 (化合物コード) + TX、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（1324）+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）+TX、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）（1347）+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）+TX、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（1402）+TX、スピロジクロフェン（738）+TX、スピロメシフェン（739）+TX、SSI-121（開発コード）（1404）+TX、スルフィラム（代替名）[CCN]+TX、スルフルアミド（750）+TX、スルホテップ（753）+TX、硫黄（754）+TX、SZE-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（786）+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、チオフアノックス（800）+TX、チオメトン（801）+TX、チオキノックス（1436）+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）[CCN]+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）及びチオフアネート（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、オキソリン酸(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・ラジオバクター(*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、アフイジウス・コレマニ(*Aphidius colemani*)(代替名)(34)+TX、アフイドレテス・アフイジミザ(*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ンシス(*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ンシス(*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(*Cryptolaemus montrouzieri*)(代替名)(178)+TX、コドリंगा(*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

10

20

30

40

50

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 bacterio*
phora) 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 dactyl*
opii) (代替名) (488) + TX、マクロロフス・カリギノス (*Macrolo*
phus caliginosus) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mame*
stra 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 anisopli*
ae 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. ani*
sopliae) (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 fumosorose*
us) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus pe*
rsimilis) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodopt*
era 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) (7
 42) + TX、スタイナーネマ・カルポカプサエ (*Steinernema carpo*
capsae) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・フェルチアエ (*Stei*
nernema 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) (7
 42) + TX、スタイナーネマ・リオブラビス (*Steinernema riobra*
vis) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (*Steiner*
nema 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) (8
 44) 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、ピサジル (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

10

20

30

40

50

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、プレビコミン (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、イブスジエノール (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) (5
 88) + TX、オクタデカ-3, 13-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名)
 (589) + TX、オルフラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタールア (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
 [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、アルドリン (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、ピフェントリン (76) + TX、ピオアレトリン (78) + TX、ピオアレトリン S-シクロペンテニル異性体 (代替名) (79) + TX、ピオエタノメトリン [CCN] + TX、ピオペルメトリン (908) + TX、ピオレスメトリン (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 (代替名) + TX、プ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-エチル (921) + TX、プフェンカルブ (924) + TX、ププロフェジン (99) + TX、プタカルブ (926) + TX、プタチオホス (927) + TX、プトカルボキシム (103) + TX、プトネート (932) + TX、プトキシカルボキシム (104) + TX、プチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (109) + TX、ヒ酸カルシ

10

20

30

40

50

ウム [CCN] + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、多硫化カルシウム (IUPAC名) (111) + TX、カンフェクロル (941) + TX、カーボレート (943) + 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ト名) (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 (119) + 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 (128) + 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、クロルフェナビル (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II (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 [CCN] + 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 (1010) + 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) + TX、シアノホス (184) + TX、シアントエート (1020) + TX、シクレトリン [CCN] + 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 (206) + TX、シロマジン (209) + TX、サイチオアート (代替名) [CCN] + TX、dーリモネン (代替名) [CCN] + TX、dーテトラメトリン (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、ジムプロピリダズ + TX、ジアリホス (1042) + 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 (236) + 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 (1070) + TX、ジエチル5ーメチルピラゾールー3ーイルホスフェート (IUPAC名) (1076) + 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 (1089) + TX、ジネクスージクレキシム (1089) + TX、ジノプロブ (1093) + TX、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、EMP C (1120) + TX、エンペントリン (292) + TX、エンドスルファン (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-DDD (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、エトフェンブロックス (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、フェンブopat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、フルコフロニ (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、フルフェンブロックス (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、ハルフェンブロックス (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、イミダクロブリド (458) + TX、イミプロトリン (460) + TX、インドキサカルブ (465) + TX、ヨードメタン (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) + TX、ジャスモリンII (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II (代替名) [CCN] + TX、幼若ホルモンIII (代替名) [CCN] + TX、ケレバン (1249) + TX、キノブレン (484) + TX、λ-シハロトリン (198) + TX、ヒ酸鉛 [CCN] + TX、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、ルフェヌロン (

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 (1263) + 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 (IUPAC/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 (531) + TX、メトプレン (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 (543) + TX、メチルクロロホルム (代替名) [CCN] + TX、塩化メチレン [CCN] + 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 (1290) + 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、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、NC-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 (586) + 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) + TX、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、ホスニコロール (1339) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスフィン (IUPAC名) (640) + TX、ホキシム (642) + TX、ホキシム-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-エチル (1345) + TX、ピリミホス-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) (1347) + 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II (代替名) [CCN] + TX、プレコセンII
 I (代替名) [CCN] + TX、プリミドホス (1349) + TX、プロフェノホス (6
 62) + 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 (678) + 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 [C
 CN] + 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II (696) + TX、ピレトリン (696) + TX、ピリダベン (6
 99) + 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 (1376) + 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 (13
 89) + 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
 オフェン (728) + TX、SN 72129 (開発コード) (1397) + TX、亜ヒ
 酸ナトリウム [CCN] + TX、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) + T
 X、セレン酸ナトリウム (IUPAC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
 ン (746) + TX、スルコフロナーナトリウム (746) + TX、スルフルアミド (750
) + TX、スルホテップ (753) + 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 (7
 64) + 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、TEPP (1417) + TX、テラレトリン (1418) + T
 X、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロエタン [C
 CN] + TX、テトラクロルビンホス (777) + TX、テトラメトリン (787) + T
 X、θ-シペルメトリン (204) + 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 (1431) + TX、チオシクラム (798) + TX、チオシ
 クラムシュウ酸水素塩 (798) + TX、チオジカルブ (799) + TX、チオファノッ
 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、チオスルタップーナトリウム (803) + TX、ツリ
 ンギエンシン (代替名) [CCN] + TX、トルフェンピラド (809) + TX、トラロ
 メトリン (812) + TX、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、トリブレン (1459) + TX、バミドチ

10

20

30

40

50

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-シペルメトリン (205) + TX、ゼタメトリン (zetamethrin) (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、フルクサメタミド (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、クロロプラレトリン [399572-87-3] + TX、フルキサメタミド [928783-29-3] + TX、シハロジアミド (cyhalodiamide) [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、グアジピル (guadipyr) (国際公開第2010/060231号に記載される) + TX、シクロキサブリド (国際公開第2005/077934号に記載される) からなる物質の群から選択される殺虫剤、+ TX、スピロピジオン + TX、アフィドピロペン + 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

10

20

30

40

ビス (トリブチルスズ) オキシド (IUPAC名) (913) + TX、ブromo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romo-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

50

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) + TX、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、DBCP (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 (262) + 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) [CCN] + 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 (543) + 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 verrucaria*) 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 [CCN] + TX、YE-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) ベンゼンスルホンアミド (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 (*antutu*) (880) + TX、三酸化ニヒ素 (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 (444) + 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 (1009) + TX、ジフェナコウム (246) + TX、ジフェチアロン (249) + TX、ジファシノン (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 (1183) + 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 [CCN] + TX、ピンドン (1341) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、ピリヌロン (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) (324) + 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、ピプロタール (1343) + 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 (1406) + 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) 及びチオファネート-メチル (802) + TX からなる物質の群から選択される傷保護剤、及び
 アメトクトラジン [865318-97-4] + TX、アミスルプロム [348635-
 87-0] + TX、アザコナゾール (60207-31-0) + TX、ベンゾビンジフル
 ビル [1072957-71-1] + TX、ビテルタノール [70585-36-3] +
 TX、プロムコナゾール [116255-48-2] + TX、クモキシストロビン [85
 0881-70-8] + TX、シプロコナゾール [94361-06-5] + 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、エノキサストロビン [238410-11-2] + 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、フェンピラザミン [473798-59-3] + 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、フルキサピロキサド [907204-
 31-3] + TX、フルオピラム [658066-35-4] + TX、フェナミンストロ
 ビン [366815-39-6] + TX、イソフェタミド [875915-78-9] +
 TX、ヘキサコナゾール [79983-71-4] + TX、イマザリル [35554-4
 4-0] + TX、イミベンコナゾール [86598-92-7] + TX、イブコナゾール
 [125225-28-7] + TX、イブフェントリフルコナゾール [1417782-
 08-1] + TX、イソチアニル [224049-04-1] + TX、マンデストロビン
 [173662-97-0] (国際公開第2010/093059号に記載されている手
 法に従って調製可能) + TX、メフェントリフルコナゾール [1417782-03-6]
] + TX、メトコナゾール [125116-23-6] + TX、ミクロブタニル [886
 71-89-0] + TX、パクロブトラゾール [76738-62-0] + TX、ペフラ
 ゴエート [101903-30-4] + TX、ペンフルフェン [494793-67-8]
] + TX、ペンコナゾール [66246-88-6] + TX、プロチオコナゾール [17

10

20

30

40

50

8928-70-6] + 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 [1075
 34-96-3] + 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 [131
 983-72-7] + TX、アンシミドール [12771-68-5] + TX、フェナリ
 モル [60168-88-9] + TX、ヌアリモル [63284-71-9] + TX、ブ
 ピリメート [41483-43-6] + TX、ジメチリモール [5221-53-4] +
 TX、エチリモール [23947-60-6] + TX、ドデモルフ [1593-77-7]
] + TX、フェンプロピジン [67306-00-7] + TX、フェンプロピモルフ [6
 7564-91-4] + TX、スピロキサミン [118134-30-8] + TX、トリ
 デモルフ [81412-43-3] + TX、シプロジニル [121552-61-2] +
 TX、メパニピリム [110235-47-7] + TX、ピリメタニル [53112-2
 8-0] + TX、フェンピクロニル [74738-17-3] + TX、フルジオキシニル
 [131341-86-1] + TX、ベナラキシル [71626-11-4] + TX、フ
 ララキシル [57646-30-7] + TX、メタラキシル [57837-19-1] +
 TX、R-メタラキシル [70630-17-0] + TX、オフレース [58810-4
 8-3] + TX、オキサジキシル [77732-09-3] + TX、ベノミル [1780
 4-35-2] + TX、カルベンダジム [10605-21-7] + TX、デバカルブ [20
 62732-91-6] + TX、フベリダゾール [3878-19-1] + TX、チアベ
 ンダゾール [148-79-8] + TX、クロゾリネート [84332-86-5] + T
 X、ジクロゾリン [24201-58-9] + TX、イプロジオン [36734-19-
 7] + TX、ミクロゾリン [54864-61-8] + TX、プロシミドン [32809
 -16-8] + TX、ピンクロゾリン [50471-44-8] + TX、ボスカリド [1
 88425-85-6] + TX、カルボキシシン [5234-68-4] + TX、フェンフ
 ラム [24691-80-3] + TX、フルトラニル [66332-96-5] + TX、
 フルチアニル [958647-10-4] + TX、メプロニル [55814-41-0]
 + TX、オキシカルボキシシン [5259-88-1] + TX、ペンチオピラド [1836
 75-82-3] + TX、チフルザミド [130000-40-7] + TX、グアザチン
 [108173-90-6] + TX、ドジン [2439-10-3] [112-65-2]
] (遊離塩基) + TX、イミノクタジン [13516-27-3] + TX、アゾキシスト
 ロビン [131860-33-8] + TX、ジモキシストロビン [149961-52-
 4] + TX、エネストロブリン {Proc. BCPC, Int. Congr., Glas
 gow, 2003, 1, 93} + TX、フルオキサストロビン [361377-29-9]
] + TX、クレソキシム-メチル [143390-89-0] + TX、メトミノストロビ
 ン [133408-50-1] + TX、トリフロキシストロビン [141517-21-
 7] + TX、オリザストロビン [248593-16-0] + TX、ピコキシストロビン
 [117428-22-5] + TX、ピラクロストロビン [175013-18-0] +
 TX、ピラオキシストロビン [862588-11-2] + TX、フルオキサピプロリン
 [1360819-11-9] + TX、フェルバム [14484-64-1] + TX、マ
 ンコゼブ [8018-01-7] + TX、マンネブ [12427-38-2] + TX、メ
 チラム [9006-42-2] + TX、プロピネブ [12071-83-9] + TX、チ
 ラム [137-26-8] + TX、ジネブ [12122-67-7] + TX、ジラム [1
 37-30-4] + TX、カプタホール [2425-06-1] + TX、キャプタン [1
 33-06-2] + TX、ジクロフルアニド [1085-98-9] + TX、フルオロイ
 ミド [41205-21-4] + TX、ホルベット [133-07-3] + TX、トリル
 フルアニド [731-27-1] + TX、ボルドー液 [8011-63-0] + TX、水
 酸化銅 [20427-59-2] + TX、オキシ塩化銅 [1332-40-7] + TX、
 硫酸銅 [7758-98-7] + TX、酸化銅 [1317-39-1] + TX、マンカッ

10

20

30

40

50

パー [5 3 9 8 8 - 9 3 - 5] + T X、オキシシン銅 [1 0 3 8 0 - 2 8 - 6] + T X、ジ
 ノカップ [1 3 1 - 7 2 - 6] + T X、ニトロタルーイソプロピル [1 0 5 5 2 - 7 4 -
 6] + T X、エディフェンホス [1 7 1 0 9 - 4 9 - 8] + T X、イプロベンホス [2 6
 0 8 7 - 4 7 - 8] + T X、イソプロチオラン [5 0 5 1 2 - 3 5 - 1] + T X、ホスジ
 フェン [3 6 5 1 9 - 0 0 - 3] + T X、ピラゾホス [1 3 4 5 7 - 1 8 - 6] + T X、
 トルコホスーメチル [5 7 0 1 8 - 0 4 - 9] + T X、アシベンゾラルーSーメチル [1
 3 5 1 5 8 - 5 4 - 2] + T X、アニラジン [1 0 1 - 0 5 - 3] + T X、ベンチアバリ
 カルブ [4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7] + T X、ブラストサイジンーS [2 0 7 9 - 0 0 - 7
] + T X、チノメチオナート [2 4 3 9 - 0 1 - 2] + T X、クロロネブ [2 6 7 5 - 7
 7 - 6] + T X、クロロタロニル [1 8 9 7 - 4 5 - 6] + T X、シフルフェナミド [1
 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3] + T X、シモキサニル [5 7 9 6 6 - 9 5 - 7] + T X、ジクロ
 ン [1 1 7 - 8 0 - 6] + T X、ジクロシメット [1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4] + T X、ジ
 クロメジン [6 2 8 6 5 - 3 6 - 5] + T X、ジクロラン [9 9 - 3 0 - 9] + T X、ジ
 エトフェンカルブ [8 7 1 3 0 - 2 0 - 9] + T X、ジメトモルフ [1 1 0 4 8 8 - 7 0
 - 5] + T X、S Y P - L I 9 0 (フルモルフ) [2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9] + T X、
 ジチアノン [3 3 4 7 - 2 2 - 6] + T X、エタボキサム [1 6 2 6 5 0 - 7 7 - 3] +
 T X、エトリジアゾール [2 5 9 3 - 1 5 - 9] + T X、ファモキサドン [1 3 1 8 0 7
 - 5 7 - 3] + T X、フェンアミドン [1 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7] + T X、フェノキサニ
 ル [1 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7] + T X、フェンチン [6 6 8 - 3 4 - 8] + T X、フェリ
 ムゾン [8 9 2 6 9 - 6 4 - 7] + T X、フルアジナム [7 9 6 2 2 - 5 9 - 6] + T X
 、フルオピコリド [2 3 9 1 1 0 - 1 5 - 7] + T X、フルスルファミド [1 0 6 9 1 7
 - 5 2 - 6] + T X、フェンヘキサミド [1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8] + T X、ホセチルー
 アルミニウム [3 9 1 4 8 - 2 4 - 8] + T X、ヒメキサゾール [1 0 0 0 4 - 4 4 - 1
] + T X、イプロバリカルブ [1 4 0 9 2 3 - 1 7 - 7] + T X、I K F - 9 1 6 (シア
 ゾファミド) [1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3] + T X、カスガマイシン [6 9 8 0 - 1 8 - 3
] + T X、メタスルホカルブ [6 6 9 5 2 - 4 9 - 6] + T X、メトラフェノン [2 2 0
 8 9 9 - 0 3 - 6] + T X、ペンシクロン [6 6 0 6 3 - 0 5 - 6] + T X、フタリド [2
 7 3 5 5 - 2 2 - 2] + T X、ピカルブトラゾクス [5 0 0 2 0 7 - 0 4 - 5] + T X
 、ポリオキシシン [1 1 1 1 3 - 8 0 - 7] + T X、プロベナゾール [2 7 6 0 5 - 7 6 -
 1] + T X、プロパモカルブ [2 5 6 0 6 - 4 1 - 1] + T X、プロキナジド [1 8 9 2
 7 8 - 1 2 - 4] + T X、ピジフルメトフェン [1 2 2 8 2 8 4 - 6 4 - 7] + T X、ピ
 ラメトストロピン [9 1 5 4 1 0 - 7 0 - 7] + T X、ピロキロン [5 7 3 6 9 - 3 2 -
 1] + T X、ピリオフェノン [6 8 8 0 4 6 - 6 1 - 9] + T X、ピリベンカルブ [7 9
 9 2 4 7 - 5 2 - 2] + T X、ピリソキサゾール [8 4 7 7 4 9 - 3 7 - 5] + T X、キ
 ノキシフェン [1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7] + T X、キントゼン [8 2 - 6 8 - 8] + T X
 、硫黄 [7 7 0 4 - 3 4 - 9] + T X、T i m o r e x G o l d (商標) (S t o c k
 t o n G r o u p 製のティーツリーオイルを含む植物抽出物) + T X、テブフロキン [3
 7 6 6 4 5 - 7 8 - 2] + T X、チアジニル [2 2 3 5 8 0 - 5 1 - 6] + T X、トリ
 アゾキシド [7 2 4 5 9 - 5 8 - 6] + T X、トルプロカルブ [9 1 1 4 9 9 - 6 2 - 2
] + T X、トリクロピリカルブ [9 0 2 7 6 0 - 4 0 - 1] + T X、トリシクラゾール [4
 1 8 1 4 - 7 8 - 2] + T X、トリホリン [2 6 6 4 4 - 4 6 - 2] + T X、バリダマ
 イシン [3 7 2 4 8 - 4 7 - 8] + T X、バリフェナレート [2 8 3 1 5 9 - 9 0 - 0]
 + T X、ゾキサミド (R H 7 2 8 1) [1 5 6 0 5 2 - 6 8 - 5] + T X、マンジプロパ
 ミド [3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2] + T X、イソピラザム [8 8 1 6 8 5 - 5 8 - 1] + T
 X、フェナマクリル + T X、セダキサニル [8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6] + T X、トリネキサ
 パックーエチル [9 5 2 6 6 - 4 0 - 3] + T X、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-メタノーナフタレン-5-イル) -アミド (国際公開第2007/048
 556号に開示されている) + T X、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

10

20

30

40

50

ド（国際公開第2006/087343号に開示されている）+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; 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[1228284 - 64 - 7] + TX、κ - ビフェントリン[439680 - 76 - 9] + TX、プロフラニリド[1207727 - 04 - 5] + TX、ジクロロメゾチアズ[1263629 - 39 - 5] + TX、ジピメチトロニル[16114 - 35 - 5] + TX、ピラジフルミド[942515 - 63 - 1] + TX、κ - テフルトリン[391634 - 71 - 2] + TX、フェンビコキサミド[517875 - 34 - 2] + TX; フルインダピル[1383809 - 87 - 7] + TX; α - ブロマジオロン[28772 - 56 - 7] + TX; フルピリミン[1689566 - 03 - 7] + TX; ベンズピリモキサン[1449021 - 97 - 9] + TX; アシノナピル[1332838 - 17 - 1] + TX; インピルフルキサム[1352994 - 67 - 2] + TX、イソフルシプラム[1255734 - 28 - 1] + TX; レスカルレ[64309 - 03 - 1] + TX; アミノピリフェン[1531626 - 08 - 0] + TX; チクロピラゾフロル[1477919 - 27 - 9] + TX; 及びスピロビジオン[1229023 - 00 - 0] + TXからなる群から選択される生物学的に有効な化合物; 及び

以下のものを含む微生物(microbials): アシネトバクター・ルオフィイ(Acinetobacter lwoffii) + TX、アクレモニウム・アルタナツム(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・ディオスピリ(Acremonium diospyri) + TX、アクレモニウム・オブクラバツム(Acremonium obclavatum) + TX、リンゴコカクモンハマキ顆粒病ウイルス(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・カシアエ(Alternaria cassia) + TX、アルテルナリア・デストルエンズ(Alternaria destruens)(Smolder(登録商標)) + TX、アンペロマイセス・キスカリス(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(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

10

20

30

40

50

) + TX、TAZO B (登録商標) + TX、アゾトバクター属 (*Azotobacter*) + TX、アゾトバクター・クロオコッカム (*Azotobacter chroococcum*) (Azotomeal (登録商標)) + TX、アゾトバクター (*Azotobacter*) シスト (cyst) (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、セレウス菌 (*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・リケニフォルミス (*Bacillus licheniformis*) 菌株 HB-2 (Biostart (商標) Rhizoboost (登録商標)) + TX、バチルス・リケニフォルミス (*Bacillus licheniformis*) 菌株 3086 (EcoGuard (登録商標)) + TX、Green Releaf (登録商標) + TX、バチルス・サーキュランス (*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・マリスモルトウイ (*Bacillus marismortui*) + TX、バチルス・メガテリウム (*Bacillus megaterium*) + TX、バチルス・ミコイデス (*Bacillus mycoides*) 菌株 AQ726 + TX、バチルス・ポピリエ (*Bacillus papillae*) (Milky Spore Powder (登録商標)) + TX、バチルス・プミルス種 (*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 (Sonata (登録商標)) + TX、Ballad Plus (登録商標) + TX、バチルス・スフェリカス (*Bacillus spahericus*) (VectoLex (登録商標)) + TX、バチルス属 (*Bacillus* spp.) + TX、バチルス属 (*Bacillus* spp.) 菌株 AQ175 + TX、バチルス属 (*Bacillus* spp.) 菌株 AQ177 + TX、バチルス属 (*Bacillus* spp.) 菌株 AQ178 + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST 713 (CEASE (登録商標)) + TX、Serenade (登録商標) + TX、Rhapsody (登録商標) + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST 714 (JAZZ (登録商標)) + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 AQ153 + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 AQ743 + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST3002 + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST3004 + TX、枯草菌変種アミロリケファシエンス (*Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*) 菌株 FZB24 (Taegro (登録商標)) + TX、Rhizopro (登録商標) + TX、バチルス・チューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) Cry 2Ae + TX、バチルス・チューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) Cry1Ab + TX、バチルス・チューリンゲンシス・アイザワイ (*Bacillus thuringiensis aizawai*) GC 91 (Agree (登録商標)) + TX、バチルス・チューリンゲンシス・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis israelensis*) (BMP123 (登録商標)) + TX、Aquabac (登録商標) + TX、VectoBac (登録商標) + TX、バチルス・チューリンゲンシス・クルスターキ (*Bacillus 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、Tur
 ilav WP (登録商標) + TX、Astuto (登録商標) + TX、Dipel W
 P (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 thurin
 giensis 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 thuri
 ngiensis 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 thurin
 giensis*) 菌株BD#32 + TX、バチルス・チューリングエンシス (*Bacill
 us 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. aiza
 wai*) (XenTari (登録商標) + TX、Dipel (登録商標)) + TX、細菌
 種 (*bacteria spp.*) (GROWMEND (登録商標) + TX、GROWS
 WEET (登録商標) + TX、Shootup (登録商標)) + TX、クラビバクター・
 ミシガネンシス (*Clavipacter michiganensis*) のバクテリオ
 ファージ (AgriPhage (登録商標)) + TX、Bakflor (登録商標) + T
 X、白きょう病菌 (*Beauveria bassiana*) (Beaugenic (登
 録商標) + TX、Brocaril WP (登録商標)) + TX、白きょう病菌 (*Bea
 uveria bassiana*) GHA (Mycotrol ES (登録商標) + TX
 、Mycotrol O (登録商標) + TX、BotaniGuard (登録商標)) +
 TX、ビューベリア・ブロングニアルティ (*Beauveria brongniart
 ii*) (Engerlingspilz (登録商標) + TX、Schweizer Be
 auveria (登録商標) + TX、Melocont (登録商標)) + TX、ビューベ
 リア属 (*Beauveria spp.*) + TX、灰色かび病菌 (*Botrytis c
 ineria*) + TX、ブラディリゾビウム・ジャポニクム (*Bradyrhizobi
 um japonicum*) (TerraMax (登録商標)) + TX、プレビバチルス
 ・ブレビス (*Brevibacillus brevis*) + TX、バチルス・チューリ
 ングエンシス・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis ten
 ebrionis*) (Novodor (登録商標)) + TX、BtBooster + TX
 、バークホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (Den
 y (登録商標) + TX、Intercept (登録商標) + TX、Blue Circ
 le (登録商標)) + TX、バークホルデリア・グラディ (*Burkholderia g
 ladii*) + TX、バークホルデリア・グラディオリ (*Burkholderia g
 ladioli*) + TX、バークホルデリア属 (*Burkholderia spp.*)
 + TX、セイヨウトゲアザミの菌 (*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・ファーマータ (*Cand
 ida famata*) + TX、カンジダ・フルクタス (*Candida fructu
 s*) + TX、カンジダ・グラブラタ (*Candida glabrata*) + TX、カン
 ジダ・ギリエルモンディ (*Candida guilliermondii*) + TX、
 カンジダ・メリビオシカ (*Candida melibiosica*) + TX、カンジダ
 ・オレオフィラ (*Candida oleophila*) 菌株O + TX、カンジダ・パラ
 プシロシス (*Candida parapsilosis*) + TX、カンジダ・ペリキュ
 ローザ (*Candida pelliculosa*) + TX、カンジダ・プルケリマ (*C
 andida pulcherrima*) + TX、カンジダ・レウカウフィ (*Candi
 da reukaufii*) + TX、カンジダ・サイトアナ (*Candida sait
 oana*) (Bio-Coat (登録商標) + TX、Biocure (登録商標)) + T
 X、カンジダ・サケ (*Candida sake*) + TX、カンジダ属 (*Candida
 spp.*) + TX、カンジダ・テヌイス (*Candida tenius*) + TX、セデ
 セア・ダビセ (*Cedecea dravisae*) + TX、セルロモナス・フラビゲナ

10

20

30

40

50

(Cellulomonas flavigena) +TX、カエトミウム・コクリオイ
 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・スブツガエ (Chromobacterium subtsugae) 菌株PRAA4-1T (Grandev
 o (登録商標)) +TX、クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (Cladospo
 rium 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 (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、コレトリウム・アクタータム (Colletotrichum acu
 tatum) +TX、コニオチリウム・ミニタンス (Coniothyrium min
 itans) (Cotans WG (登録商標)) +TX、コニオチリウム属 (Coni
 othyrium spp.) +TX、クリプトコッカス・アルビダス (Cryptoc
 occus albidus) (YIELDPLUS (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・インフィルモ・ミニアツス (Cryptococcus infirmo-mi
 niatus) +TX、クリプトコッカス・ローレンティ (Cryptococcus
 laurentii) +TX、クリプトフレビア・レウコトレタ顆粒病ウイルス (Cry
 ptophlebia leucotreta granulovirus) (Cryp
 tex (登録商標)) +TX、カプリアビダス・カンピネンシス (Cupriavidu
 s campinensis) +TX、コドリガ顆粒病ウイルス (Cydia pom
 onella granulovirus) (CYD-X (登録商標)) +TX、コドリ
 ンガ顆粒病ウイルス (Cydia pomonella granulovirus) (Ma
 dex (登録商標)) +TX、Madox Plus (登録商標) +TX、Madox
 Max / Carpovirusine (登録商標)) +TX、エビコウヤクタケ (Cyl
 indrobasidium 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、ドレクスレラ・
 ハワイエンシス (Drechslera hawaiiensis) +TX、エンテロ
 バクター・クロアカ (Enterobacter cloacae) +TX、腸内細菌科
 (Enterobacteriaceae) +TX、エントモフトラ・ビルレンタ (En
 tomophthora 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・パ
 ーパラセンス (Epicoccum purpurascens) +TX、エピコッカム
 属 (Epicoccum spp.) +TX、フィロバシディウム・フロリフォルメ (F
 ilobasidium floriforme) +TX、フザリウム・アクミナツム (F
 usarium acuminatum) +TX、フザリウム・クラミドスポルム (F
 usarium chlamydosporum) +TX、フザリウム・オキシスポルム
 (Fusarium oxysporum) (Fusaclean (登録商標)) / Bio
 fox C (登録商標)) +TX、フザリウム・プロリフェラツム (Fusarium
 proliferatum) +TX、フザリウム属 (Fusarium spp.) +T
 X、ガラクトマイセス・ゲオトリスム (Galactomyces geotrichu
 m) +TX、グリオクラジウム・カテヌラツム (Gliocladium catenu
 latum) (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 (Gliocladium spp.) (SoilGard (登録
 商標)) +TX、グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens

10

20

30

40

50

) (Soilgard (登録商標)) +TX、顆粒病ウイルス (Granulovirus) (Granupom (登録商標)) +TX、ハロバチルス・ハロフィルス (Halobacillus halophilus) +TX、ハロバチルス・リトラリス (Halobacillus litoralis) +TX、ハロバチルス・トルウエペリ (Halobacillus trueperi) +TX、ハロモナス属 (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、オオタバコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa armigera nucleopolyhedrovirus) (Helicovex (登録商標)) +TX、アメリカタバコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa zea nuclear polyhedrosis virus) (Gemstar (登録商標)) +TX、イソフラボン・ホルモノネチン (Myconate (登録商標)) +TX、クロエケラ・アピキュラータ (Kloeckera apiculata) +TX、クロエケラ属 (Kloeckera spp.) +TX、ラゲニジウム・ギガンテウム (Lagenidium giganteum) (Laginex (登録商標)) +TX、レカニシリウム・ロンギスボルム (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、マイマイガ核多角体病ウイルス (Lymantria dispar nucleopolyhedrosis virus) (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 geulakonigi) +TX、メタリジウム・アニソプリエ (Metarhizium anisopliae) (Met52 (登録商標)) +TX、メタリジウム・アニソプリエ (Metarhizium anisopliae) (Destruxin WP (登録商標)) +TX、メチニコビア・フルクチコラ (Metschnikowia fruticola) (Shemer (登録商標)) +TX、メチニコビア・プルケリマ (Metschnikowia pulcherrima) +TX、ミクロドチウム・ジメルム (Microdochium dimerum) (Antibot (登録商標)) +TX、ミクロモノスポラ・ケルレア (Micromonospora coerulea) +TX、ミクロスファエロプシス・オクラセ (Microsphaeropsis ochracea) +TX、ムスコドル・アルブス (Muscodora albus) 620 (Muscudor (登録商標)) +TX、ムスコドル・ロセウス (Muscodora roseus) 菌株 A3-5 +TX、ミコリザエ属 (Mycorrhizae spp.) (AMykor (登録商標)) +TX、Root Maximizer (登録商標)) +TX、クワ暗斑病菌 (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、ペシロマイセス・ファリノスス (Paecilomyces farinosus) +TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus) (PFR-97 (登録商標)) +TX、PreFeRal (登録商標)) +TX、ペシロマイセス・リラシヌス (Paecilomyces lilacinus) (Biostat WP (登録商標)) +TX、ペシロマイセス・リラシヌス (Paecilomyces lilacinus) 菌株 251 (MeloCon WG (登録商標)) +TX、パエニバチルス・ポリミキサ (Paenibacillus polymyxa) +TX、パントエア・アグロメランズ (Pantoea agglomerans) (BrightBan C9-1 (登録商標)) +TX、パントエア属 (Pantoea spp.) +TX、パスツールア属 (Pasteuria spp.) (Econem (登録商標)) +TX、パスツールア・ニシザワエ (Pa

10

20

30

40

50

steuria nishizawae) + TX、ペニシリウム・オーランティオグリセウム (*Penicillium aurantiogriseum*) + TX、ペニシリウム・ビライ (*Penicillium bilai*) (Jumpstart (登録商標)) + TX、TagTeam (登録商標)) + TX、ペニシリウム・ブレビコンパクトム (*Penicillium brevicompactum*) + TX、ペニシリウム・フレクエンタス (*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・ブルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) + TX、ペニシリウム属 (*Penicillium spp.*) + TX、ペニシリウム・ビリディカタム (*Penicillium viridicatum*) + TX、フレビオブシス・ギガンテア (*Phlebiopsis gigantea*) (Rotstop (登録商標)) + TX、リン酸塩溶解細菌 (*Phosphomeal* (登録商標)) + TX、フィトファトラ・クリプトゲア (*Phytophthora cryptogea*) + TX、フィトファトラ・パルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Devine (登録商標)) + TX、ピヒア・アノマラ (*Pichia anomala*) + TX、ピヒア・ギリエルモンディ (*Pichia guilhermondii*) + TX、ピヒア・メンブラネファシエンス (*Pichia membranaefaciens*) + TX、ピヒア・オニキス (*Pichia onychis*) + TX、ピヒア・ステピチス (*Pichia stipites*) + TX、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*) + TX、シュードモナス・オーレオファシエンス (*Pseudomonas aureofaciens*) (Spot-Less Biofungicide (登録商標)) + TX、シュードモナス・セパシア (*Pseudomonas cepacia*) + TX、シュードモナス・クロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*) (AtEze (登録商標)) + TX、シュードモナス・コルガータ (*Pseudomonas corrugate*) + TX、蛍光菌 (*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 reactans*) + TX、シュードモナス属 (*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・テラスペオス (*Puccinia thlaspeos*) (Wood Warrior (登録商標)) + TX、ピシウム・パレカンドルム (*Pythium paroecandrum*) + TX、ピシウム・オリガンドルム (*Pythium oligandrum*) (Polygandron (登録商標)) + TX、Polyversum (登録商標)) + TX、ピシウム病菌 (*Pythium periplocum*) + TX、ラーネラ・アクアティリス (*Rhanelia aquatilis*) + TX、ラーネラ属 (*Rhanelia spp.*) + TX、リゾビウム属 (*Rhizobia*) (Dormal (登録商標)) + TX、Vault (登録商標)) + TX、リゾクトニア属 (*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 (*Rhodosporiidium diobovatum*) + TX、ロドスポリジウム・トルロイデス (*Rhodosporiidium toruloides*) + TX、ロドトルラ属 (*Rhodotorula spp.*) + TX、ロドトルラ・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・ムチラギノーザ (*Rhod*

10

20

30

40

50

otorula mucilagnosa) +TX、ロドトルラ・ルブラ (Rhodot
 orula rubra) +TX、サッカロマイセス・セレビスエ (Saccharom
 yces cerevisiae) +TX、サリニコッカス・ロセウス (Salinoc
 occus 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、スキタリジウム属 (Scytalidium
 spp.) +TX、スキタリジウム・ウレジニコラ (Scytalidium ured
 inicola) +TX、シロイチモジヨトウ核多角体病ウイルス (Spodoptera
 exigua nuclear polyhedrosis virus) (Spod
 -X (登録商標)) +TX、Spexit (登録商標)) +TX、セラチア・マルセッセ
 ンス (Serratia marcescens) +TX、セラチア・プリムシカ (Se
 rratia plymuthica) +TX、セラチア属 (Serratia spp
 .) +TX、ソルダリア・フィミコーラ (Sordaria fimicola) +TX
 、エジプトヨトウ核多角体病ウイルス (Spodoptera littoralis
 nucleopolyhedrovirus) (Littovir (登録商標)) +TX
 、スポロボロマイセス・ロセウス (Sporobolomyces roseus) +T
 X、ステノトロホモナス・マルトフィリア (Stenotrophomonas mal
 tophilia) +TX、ストレプトマイセス・ヒグロスコピクス (Streptom
 yces ahgrosopicus) +TX、ストレプトマイセス・アルバドゥン
 カス (Streptomyces albaduncus) +TX、ストレプトマイセス
 ・エクスフォリエータス (Streptomyces exfoliates) +TX、
 ストレプトマイセス・ガルバス (Streptomyces galbus) +TX、ス
 レプトマイセス・グリセオプラヌス (Streptomyces griseopla
 nus) +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・リディカス (Streptomyces lydicus) (Actinova
 te (登録商標)) +TX、ストレプトマイセス・リディカス (Streptomyce
 s 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、チレチオブシス・ミノル (Tilletiopsis minor) +TX、チ
 レチオブシス属 (Tilletiopsis spp.) +TX、トリコデルマ・アスペ
 レルム (Trichoderma asperellum) (T34 Biocontr
 ol (登録商標)) +TX、トリコデルマ・ガムシイ (Trichoderma gam
 sii) (Tenet (登録商標)) +TX、トリコデルマ・アトリビリデ (Trich
 oderma 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 harzianu
 m rifai) (Mycostar (登録商標)) +TX、トリコデルマ・ハルジアヌ
 ム (Trichoderma harzianum) T-22 (Trianium-P (登
 録商標)) +TX、PlantShield HC (登録商標) +TX、RootShie
 ld (登録商標) +TX、Trianium-G (登録商標)) +TX、トリコデルマ・ハ
 ルジアヌム (Trichoderma harzianum) T-39 (Trichod
 ex (登録商標)) +TX、トリコデルマ・インハマタム (Trichoderma i
 nhamatum) +TX、トリコデルマ・コニング (Trichoderma kon
 ingii) +TX、トリコデルマ属 (Trichoderma spp.) LC 52
 (Sentinel (登録商標)) +TX、トリコデルマ・リグノルム (Trichod
 erma lignorum) +TX、トリコデルマ・ロンギブラキアタム (Trich
 oderma longibrachiatum) +TX、トリコデルマ・ポリスポラム
 (Trichoderma polysporum) (Binab T (登録商標)) +
 TX、トリコデルマ・タキシ (Trichoderma taxi) +TX、トリコデル

10

20

30

40

50

マ・ビレンス (*Trichoderma virens*) +TX、トリコデルマ・ビレンス (*Trichoderma virens*) (旧グリオクラジウム・ビレンス (*Gliocladium virens*) 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 (*Trichoderma viride*) 菌株 ICC 080 (Remedier (登録商標)) +TX、トリコスポロン・プルランス (*Trichosporon pullulans*) +TX、トリコスポロン属 (*Trichosporon spp.*) +TX、トリコセシウム属 (*Trichothecium spp.*) +TX、トリコセシウム・ロセウム (*Trichothecium roseum*) +TX、アカエガマノホタケ (*Typhula phacorrhiza*) 菌株 94670 +TX、アカエガマノホタケ (*Typhula phacorrhiza*) 菌株 94671 +TX、ウロクラジウム・アトラム (*Ulocladium atrum*) +TX、ウロクラジウム・オウデマンシイ (*Ulocladium oudemansii*) (Botry-Zen (登録商標)) +TX、トウモロコシ黒穂病菌 (*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 (Millennium Microbes (登録商標)) +TX、バーチシリウム・クラミドスポリウム (*Verticillium chlamydosporium*) +TX、バーチシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*) (Mycotal (登録商標)) +TX、Vertalec (登録商標)) +TX、Vip 3Aa20 (VIPtera (登録商標)) +TX、ビルジバチルス・マリスモルツイ (*Virgibacillus marismortui*) +TX、キサントモナス・カムペストリス病原型ポアエ (*Xanthomonas campestris pv. Poae*) (Camperico (登録商標)) +TX、ゼノラブダス・ボヴィエニイ (*Xenorhabdus bovienii*) +TX、ゼノラブダス・ネマトフィラ (*Xenorhabdus nematophilus*) ; 及び

以下のものを含む植物抽出物：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、MeemAzal (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)) +TX、Neemix (登録商標)) +TX、ナタネ油 (Lilly Miller Vegol (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 (MossBuster (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 (*Ortho ecosense* (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、BugOil (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

10

20

30

40

50

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、Entostate 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

以下のものを含む生物 (Macrobials) : アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Aphelinus-System (登録商標)) + TX、アセロファガス・パパイヤ (Acerophagus 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、アンブリセイウス・スウィルスキイ (Amblyseius swirskii) (Bugline swirskii (登録商標)) + TX、Swirskii-Mite (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ウォマースレイ (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 fuscus

10

20

30

40

50

ventris) + 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 pseudococci*) (*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、アフエリヌス・アブドミナリス (*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、アフイジウス・エルビ (*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 (*Theta 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・ステファノデルス (*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 ingenuus*) + TX、シロスピルス・クアドリストラアツス (*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 (*Closterocerus chamaeleon*) + TX、クロステロセルス属 (*Closterocerus spp.*) + TX、コシドキセノイデス・ベルミヌツス (*Coccidoxenoides perminutus*) (*Planopar* (登録商標)) + TX、コッコファグス・コウペリ (*Coccophagus cownperi*) + 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 (*Diachasmimor*

10

20

30

40

50

pha krausii) + TX、ジアカスミモルファ・ロンギカウダタ (Diachasmimorpha longicaudata) + TX、ジアパルス・ジユクンダ (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、ディベルシネルブス属 (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 (Eretmocerus 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 (Episyrphus balteatus) (Syrphidend (登録商標)) + TX、エルトモセリス・シフォニニ (Eretmoceris siphonini) + TX、エルトモセルス・カリフォルニクス (Eretmocerus californicus) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmocerus eremicus) (Ercal (登録商標) + TX、Eretline e (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmocerus eremicus) (Bemimix (登録商標)) + TX、エルトモセルス・ハヤチ (Eretmocerus hayati) + TX、エルトモセルス・ムンツス (Eretmocerus mundus) (Bemipar (登録商標) + TX、Eretline m (登録商標)) + TX、エルトモセルス・シフォニニ (Eretmocerus 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・アリサヌス (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 (Wirless Beehorne (登録商標)) + TX、アリガタシマアザミウマ (Franklinothrips vespiformis) (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、Entomit e-A (登録商標)) + TX、ヒポアスピス・ミルス (Hypoaspis miles

10

20

30

40

50

) (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・フロシシムス (Lecanoideus floccissimus) + TX、レモファグス・エラブンツス (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 (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・ラボトレルス (Muscidifurax raptorellus) 及びスパランギア・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) (Thripor-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 strigicollis) (Thripor-S (登録商標) + TX、パウエシア・ジュニペロルム (Pauesia juniperorum) + TX、ペディオビウス・ホベオレツス (Pediobius foveolatus) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (Phasmarhabditis hermaphrodita) (Nemaslug (登録商標) + TX、フィマスティクス・コフェア (Phymastichus coffea) + TX、フィトセイウルス・マクロピルス (Phytoseiulus macropilus) + TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (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 maculiventris) (Podisus (登録商標) + TX、シューダクテオン・クルバツス (Pseudaeteon curvatus) + TX、シューダクテオン・オブツス (Pseudaeteon obtusus) + TX、シューダクテオン・トリクスピス (Pseudaeteon 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 (Psyllaephus pilosus) + TX、サ

10

20

30

40

50

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 (Rumina
 decollate) +TX、セミエラケア・ペティオラツス (Semielacher
 petiolatus) +TX、シトビオン・アベナエ (Sitobion avena
 e) (Ervibank (登録商標)) +TX、スタイナーネマ・カーポプサエ (Ste
 inernema carpocapsae) (Nematac C (登録商標)) +TX
 、Millenium (登録商標) +TX、BioNem C (登録商標) +TX、Ne
 mAttack (登録商標) +TX、Nemastar (登録商標) +TX、Capsa
 nem (登録商標) +TX、スタイナーネマ・フェルティアエ (Steinernem
 a feltiae) (NemaShield (登録商標) +TX、Nemasys F
 (登録商標) +TX、BioNem F (登録商標) +TX、Steinernema-
 System (登録商標) +TX、NemAttack (登録商標) +TX、Nemap
 lus (登録商標) +TX、Exhibitline sf (登録商標) +TX、Sci
 a-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、Exhibitline sr
 b (登録商標) +TX、スタイナーネマ・リオブラベ (Steinernema ri
 obrave) (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 scapte
 risci) (Nematac S (登録商標)) +TX、スタイナーネマ属 (Stei
 nernema spp.) +TX、スタイナーネマチド属 (Steinernemat
 id spp.) (Guardian Nematodes (登録商標)) +TX、ステ
 トルス・punkチルム (Stethorus punctillum) (Stethor
 us (登録商標)) +TX、タマリキシア・ラジアタ (Tamarixia radia
 te) +TX、テトラスティクス・セティファー (Tetrastichus seti
 fer) +TX、トリポビウス・セミルテウス (Thripobius semilut
 eus) +TX、トリムス・シネンシス (Torymus sinensis) +TX、
 タマゴヤドリバチ (Trichogramma brassicae) (Trichol
 ine b (登録商標)) +TX、タマゴヤドリバチ (Trichogramma br
 assicae) (Tricho-Strip (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 (T
 richogramma ostriniae) +TX、トリコグラマ・プラトネリ (T
 richogramma 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 stemmator) ; 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 purpu
 reum) (Chontrol Paste (登録商標)) +TX、コレトリウム・グ
 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) (ハーピン) (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
 o-brassonolide) +TX、リン酸鉄 (Lilly Miller Wor

10

20

30

40

50

ry 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 terrestr
 is) (Des-X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Ami
 nomite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ
 (Thripline ams (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム (MilSto
 p (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) (S
 emaspace Organic Grasshopper Control (登録
 商標)) + TX、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標)) + TX、Rebe
 ll Amarillo (登録商標)) + TX及びトラップ (Takitrapping
 y + b (登録商標)) + TX、又は

10

ブロフルトリネート+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) グラニューローシスウィ
 ルス+TX、コドリガ (Cydia pomonella) グラニューローシスウィルス
 +TX、イミシアホス+TX、ニセアメリカタバコガ (Heliothis vires
 cens) 核多核体ウイルス+TX、ヘリオチスプンクチゲラ (Heliothis p
 unctigera) 核多核体ウイルス+TX、アメリカタバコガ (Helicover
 pa zea) 核多核体ウイルス+TX、スポドプテラフルギベルダ (Spodopte
 ra frugiperda) 核多核体ウイルス+TX、コナガ (Plutella x
 ylostella) 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 4
 60+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から選択される生物学的に有効な化合物若しくは薬剤；又
 は

20

コードAE 1887196 (BSC-BX60309) + TX、コードNNI-074
 5 GR+TX、コードIKI-3106+TX、コードJT-L001+TX、コード
 ZNQ-08056+TX、コードIPPA152201+TX、コードHNPC-A9
 908 (CAS: [660411-21-2]) + TX、コードHNPC-A2005 (CAS: [860028-12-2]) + TX、コードJS118+TX、コードZJ0
 967+TX、コードZJ2242+TX、コードJS7119 (CAS: [92954
 5-74-4]) + 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ZJ3265+
 TX、コードJS9117+TX、コードZJ3757+TX、コードZJ4042+T
 X、コードZJ4014+TX、コードITM-121+TX、コードDPX-RAB5
 5 (DKI-2301) + TX、コードNA-89+TX、コードMIE-1209+T
 X、コードMCI-8007+TX、コードBCS-CL73507+TX、コードS-
 1871+TX、コードDPX-RDS63+TX、又は

30

40

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、ベンゾスフィル+TX又はオキサゾスルフィル+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、ピク

50

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 -ブロマジオリ
 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、フルオキシピロサド+TX、フルオキサピプロリン+TX
 、ジムプロビリダズ+TX、テトフルピロリメト+TX、ベフルブタミド-M+TX、イ
 ソシクロセラム+TX、フルピラジフロン+TX、テトフルピロリメト+TX、N-[(
 1, 2 cis) - 2 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロブ
 チル] - 3 - (トリフルオロメチル) ピラジン - 2 - カルボキサミド+TX、2 - (トリ
 フルオロメチル) - N - [(2, 3 cis) - 2 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル
) オキセタン - 3 - イル] ベンズアミド+TX、2, 6 - ジフルオロ - N - [(2, 3 c
 is) - 2 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) オキセタン - 3 - イル] ベンズアミ
 ド+TX、N - [(1, 2 cis) - 2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) シクロブチル]
 - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド+TX、N - [(1, 2 cis) - 2 - (2
 , 4 - ジクロロフェニル) シクロブチル] - 2 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 -
 カルボキサミド+TX、N - [(1, 2 cis) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル)
 シクロブチル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド+TX、N - [(5 - クロロ
 - 2 - イソプロピル - フェニル) メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチ
 ル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第201
 0 / 130767号に記載されている手法に従って調製可能) + TX、2, 6 - ジメチル
 - 1H, 5H - [1, 4] ジチイノ [2, 3 - c : 5, 6 - c '] ジピロール - 1, 3,
 5, 7 (2H, 6H) - テトロ (国際公開第2011 / 138281号に記載されてい
 る手法に従って調製可能) + TX、6 - エチル - 5, 7 - ジオキソ - ピロロ [4, 5] [
 1, 4] ジチイノ [1, 2 - c] イソチアゾール - 3 - カルボニトリル+TX、4 - (2
 - ブロモ - 4 - フルオロ - フェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロ - フェニル) -
 2, 5 - ジメチル - ピラゾール - 3 - アミン (国際公開第2012 / 031061号に記
 載されている手法に従って調製可能) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フ
 ルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4
 - カルボキサミド (国際公開第2012 / 084812号に記載されている手法に従って
 調製可能) + TX、CAS 850881 - 30 - 0 + TX、3 - (3, 4 - ジクロロ - 1
 , 2 - チアゾール - 5 - イルメトキシ) - 1, 2 - ベンゾチアゾール 1, 1 - ジオキシド
 (国際公開第2007 / 129454号に記載されている手法に従って調製可能) + TX
 、2 - [2 - [(2, 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル] - 2 - メトキシ - N
 - メチル - アセトアミド+TX、3 - (4, 4 - ジフルオロ - 3, 4 - ジヒドロ - 3, 3
 - ジメチルイソキノリン - 1 - イル) キノロン (国際公開第2005 / 070917号に
 記載されている手法に従って調製可能) + TX、2 - [2 - フルオロ - 6 - [(8 - フル
 オロ - 2 - メチル - 3 - キノリル) オキシ] フェニル] プロパン - 2 - オール (国際公開
 第2011 / 081174号に記載されている手法に従って調製可能) + TX、2 - [2
 - [(7, 8 - ジフルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル) オキシ] - 6 - フルオロ - フェ
 ニル] プロパン - 2 - オール (国際公開第2011 / 081174号に記載されている手
 法に従って調製可能) + TX、オキサチアピプロリン+TX [1003318 - 67 - 9
] 、 ϵ -ブチル N - [6 - [[(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メ
 チレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カルバメート+TX、N - [2 - (3
 , 4 - ジフルオロフェニル) フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) ピラジン - 2 - カ
 ルボキサミド (国際公開第2007 / 072999号に記載されている手法に従って調製
 可能) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 -
 トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第2014
 / 013842号に記載されている手法に従って調製可能) + TX、2, 2, 2 - トリフ
 ルオロエチル N - [2 - メチル - 1 - [[(4 - メチルベンゾイル) アミノ] メチル] プ
 ロピル] カルバメート+TX、(2RS) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - α ,
 α , α - トリフルオロ - o - トリル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イ

10

20

30

40

50

ル) プロパン-2-オール+TX、(2RS)-2-[4-(4-クロロフェノキシ)-
 α, α, α-トリフルオロ-オトリル]-3-メチル-1-(1H-1, 2, 4-トリア
 ザール-1-イル)ブタン-2-オール+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[
 (3R)-3-エチル-1, 1-ジメチル-インダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキ
 サミド+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[3-エチル-1, 1-ジメチル-イン
 ダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX、N'-(2, 5-ジメチル-4
 -フェノキシ-フェニル)-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N'-[
 4-(4, 5-ジクロロチアゾール-2-イル)オキシ-2, 5-ジメチル-フェニル]
 -N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン(国際公開第2007/031513号に記
 載されている手法に従って調製可能)+TX、[2-[3-[2-[1-[2-[3, 5
 -ビス(ジフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]アセチル]-4-ピペリジル]チア
 ザール-4-イル]-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-5-イル]-3-クロロ-フェ
 ニル]メタンスルホン酸(国際公開第2012/025557号に記載されている手法に
 従って調製可能)+TX、ブタ-3-イニルN-[6-[[(Z)-[(1-メチルテト
 ラゾール-5-イル)-フェニル-メチレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリジル]
 カルバメート(国際公開第2010/000841号に記載されている手法に従って調製
 可能)+TX、2-[3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル)
 オキシラン-2-イル]メチル]-4H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン(国
 際公開第2010/146031号に記載されている手法に従って調製可能)+TX、
 メチルN-[5-[4-(2, 4-ジメチルフェニル)トリアゾール-2-イル]-2
 -メチル-フェニル]メチルカルバメート+TX、3-クロロ-6-メチル-5-フェ
 ニル-4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピリダジン(国際公開第2005/1
 21104号に記載されている手法に従って調製可能)+TX、2-[2-クロロ-4-
 (4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロ
 パン-2-オール(国際公開第2013/024082号に記載されている手法に従っ
 て調製可能)+TX、3-クロロ-4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチル-
 5-フェニル-ピリダジン(国際公開第2012/020774号に記載されている手法
 に従って調製可能)+TX、4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチル-5-フ
 エニル-ピリダジン-3-カルボニトリル(国際公開第2012/020774号に記載
 されている手法に従って調製可能)+TX、(R)-3-(ジフルオロメチル)-1-メ
 チル-N-[1, 1, 3-トリメチルインダン-4-イル]ピラゾール-4-カルボキサ
 ミド(国際公開第2011/162397号に記載されている手法に従って調製可能)+
 TX、3-(ジフルオロメチル)-N-(7-フルオロ-1, 1, 3-トリメチル-イン
 ダン-4-イル)-1-メチル-ピラゾール-4-カルボキサミド(国際公開第2012
 /084812号に記載されている手法に従って調製可能)+TX、1-[2-[1-
 (4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]-3-メチル-フェニル
]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(国際公開第2013/162072号に記載
 されている手法に従って調製可能)+TX、1-メチル-4-[3-メチル-2-[2
 -メチル-4-(3, 4, 5-トリメチルピラゾール-1-イル)フェノキシ]メチル]
 フェニル]テトラゾール-5-オン(国際公開第2014/051165号に記載されて
 いる手法に従って調製可能)+TX、(Z, 2E)-5-[1-(4-クロロフェニル)
 ピラゾール-3-イル]オキシ-2-メトキシイミノ-N, 3-ジメチル-ペンタ-3-
 エンアミド+TX、(4-フェノキシフェニル)メチル2-アミノ-6-メチル-ピリジ
 ン-3-カルボキシレート+TX、N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N
 -シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチルピラゾール-
 4-カルボキサミド[1255734-28-1](国際公開第2010/130767
 号に記載されている手法に従って調製可能)+TX、3-(ジフルオロメチル)-N-[
 (R)-2, 3-ジヒドロ-1, 1, 3-トリメチル-1H-インデン-4-イル]-1
 -メチルピラゾール-4-カルボキサミド[1352994-67-2]+TX、N'-(
 2, 5-ジメチル-4-フェノキシ-フェニル)-N-エチル-N-メチル-ホルムア

10

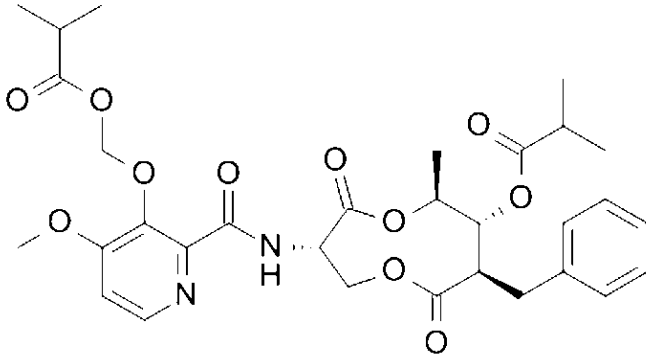
20

30

40

50

ミジン+TX、N'-[4-(4,5-ジクロロ-チアゾール-2-イルオキシ)-2,5-ジメチル-フェニル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N'-(2,5-ジメチル-4-フェノキシ-フェニル)-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、N'-[4-(4,5-ジクロロ-チアゾール-2-イルオキシ)-2,5-ジメチル-フェニル]-N-エチル-N-メチル-ホルムアミジン+TX、
【化64】



(フェンピコキサミド [517875-34-2] (国際公開第2003/035617号に記載されているとおり))+TX、(1S)-2,2-ビス(4-フルオロフェニル)-1-メチルエチルN-{[3-(アセチルオキシ)-4-メトキシ-2-ピリジル]カルボニル}-L-アラニナト [1961312-55-9]+TX; (国際公開第2016/122802号に記載されているとおり)+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(3-エチル-1,1-ジメチル-インダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(1,1-ジメチル-3-プロピル-インダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-(3-イソブチル-1,1-ジメチル-インダン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-1,1,3-トリメチルインダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-3-エチル-1,1-ジメチル-インダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX及びスピロピジオン [1229023-00-0]+TX;並びに2-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-1,1-ジメチル-3-プロピル-インダン-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド+TX (ここで、これらのカルボキサミド化合物の各々は、国際公開第2014/095675号及び/又は国際公開第2016/139189号に記載されている手法に従って調製可能)から選択される生物学的に有効な化合物。

【1010】

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。有効成分は、“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。

【1011】

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ト登録番号を意味する。

10

【1012】

表A-1～A-93、AA-1～AA-81、AB-1～AB-93及びAC-1～AC-81、並びに表B-1～B-66、BB-1～BB-54、BC-1～BC-66及びBD-1～BD-54、並びに表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成分混合物は、表A-1～A-93、AA-1～AA-81、AB-1～AB-93及びAC-1～AC-81、並びに表B-1～B-66、BB-1～BB-54、BC-1～BC-66及びBD-1～BD-54、並びに表Pから選択される化合物及び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。

20

【1013】

上記の混合物は、有害生物を防除するための方法に使用され得、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ため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。

30

【1014】

表A-1～A-93、AA-1～AA-81、AB-1～AB-93及びAC-1～AC-81、並びに表B-1～B-66、BB-1～BB-54、BC-1～BC-66及びBD-1～BD-54、並びに表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-93、AA-1～AA-81、AB-1～AB-93及びAC-1～AC-81、並びに表B-1～B-66、BB-1～BB-54、BC-1～BC-66及びBD-1～BD-54、並びに表Pから選択される式Iの化合物及び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。

40

【1015】

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

50

る固体又は液体助剤も含み得る。

【1016】

本発明に係る組成物は、例えば、固体有効成分を粉碎し、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／又は粉碎することにより、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。

【1017】

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。

10

【1018】

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、例えば土壌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。

20

【1019】

本発明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、塊茎若しく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り又は固体組成物の層を塗布することにより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の際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、100 kgの種子当たり1～200グラム、好ましくは100 kgの種子当たり5～150グラム（100 kgの種子当たり10～100グラムなど）である。

30

【1020】

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。

【1021】

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、有効成分は、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、成分の一部は、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。

40

【1022】

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

50

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。

【1023】

生物学の実施例：

以下の実施例は、本発明を例示するためのものである。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が可能であり、これは、実施例において概述されている実験手法を用いて、必要に応じて例えば50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm又は0.2ppmといった低施用量を用いて当業者により検証が可能である。

【1024】

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) に対する活性

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幼虫を寄生させた(1ウェル当たり6~10匹)。寄生の4日後、サンプルを死亡率及び成長阻害について未処理のサンプルと比べて評価した。

【1025】

以下の化合物は、200ppmの施用量で2種のカテゴリ(死亡率又は成長阻害)の少なくとも一方において少なくとも80%の効果をもたらした：P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P25、P27、P28、P31、P33、P35、P36、P37、P38、P40、P42、P43、P47、P49、P50、P51、P52、P53。

【1026】

実施例B2：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*)) に対する活性

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、10,000ppm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N2若虫を寄生させた。寄生の5日後、サンプルを死亡率及び成長阻害について未処理のサンプルと比べて評価した。

【1027】

以下の化合物は、200ppmの施用量で2種のカテゴリ(死亡率又は成長阻害)の少なくとも一方において少なくとも80%の効果をもたらした：P8、P10、P11、P12、P13、P15、P17、P18、P19、P21、P25、P28、P35、P36、P39、P45、P47、P50、P51。

【1028】

実施例B3：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ) に対する活性
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、10,000ppm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、コナガの卵をプラスチック製のステンシルを介してゲル吸い取り紙上にピペットし、プレートをこれで閉じた。寄生から8日後、死亡率及び成長阻害について未処理のサンプルと比較してサンプルを評価した。

【1029】

以下の化合物は、200ppmの施用量で2つのカテゴリ(死亡率又は成長阻害)の少なくとも一方において少なくとも80%の効果をもたらした：P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P25、P26、P27、P28、P30、P31、P33、P35、P36、P37、P38、P39、P40、P41、P42、P43、P45、P46、P47、P49、P50、P51、P52、P53。

【1030】

実施例 B 4：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ) に対する活性 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の上に置き、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ブラムシの個体群を寄生させた。サンプルを寄生の 6 日後に死亡率について評価した。

【1031】

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：P 4、P 5、P 6、P 7、P 8、P 10、P 11、P 12、P 13、P 14、P 15、P 16、P 18、P 19、P 21、P 25、P 28、P 31、P 36、P 37、P 39、P 40、P 45、P 47、P 51、P 52。

10

【1032】

実施例 B 5：エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) に対する活性

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の上に置き、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 5 匹の L1 幼虫を寄生させた。寄生の 3 日後、サンプルを死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について未処理のサンプルと比較して評価した。死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害のカテゴリの少なくとも 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。

20

【1033】

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 4、P 5、P 6、P 8、P 10、P 11、P 12、P 13、P 14、P 15、P 16、P 17、P 18、P 19、P 20、P 21、P 22、P 25、P 28、P 30、P 31、P 33、P 35、P 38、P 50、P 51、P 52。

【1034】

実施例 B 6：タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*) (綿コナジラミ) に対する活性

綿葉片を 24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000 ppm 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、葉片にコナジラミの成虫を寄生させた。インキュベーションの 6 日後、サンプルを死亡率について確認した。

30

【1035】

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：P 12、P 27、P 51、P 52。

【1036】

実施例 B 7：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) (ミカンキイロアザミウマ) に対する活性

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の上に置き、10,000 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ハナアザミウマ属 (*Frankliniella*) の個体群を寄生させた。寄生の 7 日後、サンプルを死亡率について評価した。

40

【1037】

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：P 11、P 17、P 18、P 51。

【1038】

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) に対する活性 浸透移行活性

様々な齢数のアブラムシ個体群を寄生させたエンドウマメの実生の根を、10,000 D

50

M S O ストック溶液から調製したテスト水溶液中に直接入れた。実生をテスト溶液に入れてから6日後、サンプルを死亡率について評価した。

【1039】

以下の化合物は、24 ppmのテスト量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：P 13。

10

20

30

40

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2019/086977

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D471/04 A01N43/90 A01N47/02 C07D213/78 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		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2018/199210 A1 (NIHON NOHYAKU CO LTD [JP]) 1 November 2018 (2018-11-01) cited in the application Compounds 1-1 to 1-56 and 2-1 to 2-78; claims 1-8	1-20
A	WO 2016/071214 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 12 May 2016 (2016-05-12) claims 1-14; compounds P1-P30, H-1 to H13	1-20
A	WO 2015/000715 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 8 January 2015 (2015-01-08) claims 1-3, 7-17; compounds P10, P14, P15	1-20
A	WO 2018/206348 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 15 November 2018 (2018-11-15) claims 1-16; compounds X001-X065	1-20
	----- -/--	
☒ 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 4 February 2020		Date of mailing of the international search report 17/02/2020
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 Sotoca Usina, E

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2019/086977

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2018/174170 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]) 27 September 2018 (2018-09-27) cited in the application claims 1-7; compounds 4, 5-2 -----	1-20

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2019/086977

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2018199210 A1	01-11-2018	CN 110582498 A EP 3617207 A1 WO 2018199210 A1	17-12-2019 04-03-2020 01-11-2018
WO 2016071214 A1	12-05-2016	BR 112017009454 A2 CA 2965052 A1 CN 107074865 A EP 3214939 A1 JP 6633091 B2 JP 2018502142 A KR 20170078685 A RU 2017119748 A US 2017318809 A1 WO 2016071214 A1 ZA 201702983 B	19-06-2018 12-05-2016 18-08-2017 13-09-2017 22-01-2020 25-01-2018 07-07-2017 10-12-2018 09-11-2017 12-05-2016 26-06-2019
WO 2015000715 A1	08-01-2015	CA 2917262 A1 EP 3016949 A1 JP 2016528189 A RU 2016103149 A TW 201536781 A US 2016255837 A1 WO 2015000715 A1	08-01-2015 11-05-2016 15-09-2016 07-08-2017 01-10-2015 08-09-2016 08-01-2015
WO 2018206348 A1	15-11-2018	AR 111682 A1 CN 110612301 A WO 2018206348 A1	07-08-2019 24-12-2019 15-11-2018
WO 2018174170 A1	27-09-2018	CN 110461834 A EP 3604300 A1 JP WO2018174170 A1 WO 2018174170 A1	15-11-2019 05-02-2020 23-01-2020 27-09-2018

10

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類	F I	テーマコード (参考)
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	
A 0 1 P 9/00 (2006.01)	A 0 1 P 5/00	
	A 0 1 P 7/04	
	A 0 1 P 9/00	
(32)優先日 平成31年2月28日(2019.2.28)		
(33)優先権主張国・地域又は機関 欧州特許庁(EP)		
(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,T,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,ZA,ZM,ZW		
(特許庁注：以下のものは登録商標)		
1. C o m b i F l a s h		
(74)代理人 100111796		
弁理士 服部 博信		
(72)発明者 ミューレバツハ ミシェル 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 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 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 ブッフホルツ アンケ 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 セン インディラ インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム シンジェンタ バイオサイエンスーズ プライベ ート リミテッド サンタ モニカ ワークス内		
(72)発明者 シケルヴァル ヴィカス インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム シンジェンタ バイオサイエンスーズ プライベ ート リミテッド サンタ モニカ ワークス内		
(72)発明者 シュトラー アンдре 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) 4C050 AA01 BB05 CC08 EE03 FF05 GG03 HH04 4C065 AA03 BB06 CC01 DD02 EE02 HH01 JJ03 KK05 LL01 PP12 QQ05 4H011 AC01 AC04 AE01 BB09 DA13		

【要約の続き】

